

Внимательно прочитайте эту инструкцию перед тем, как начать прием/использование этого лекарственного средства.

- Сохраните инструкцию, она может потребоваться вновь.
- Если у вас возникли вопросы, обратитесь к врачу.
- Это лекарство назначено лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.

**ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА
Доломин®**

Регистрационный номер:

Торговое название: Доломин®

МНН: кеторолак

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Состав:

1 ампула (1 мл) содержит в качестве *активного вещества* кеторолака трометамол - 30 мг;

вспомогательные вещества: этанол (спирт этиловый 95 % в пересчете на 100 % вещество), натрия хлорид, натрия гидроксид или хлористоводородная кислота, вода для инъекций.

Описание: прозрачный раствор светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП).

Код АТХ: M01AB15

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП). Оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности циклооксигеназы-1 и циклооксигеназы-2, катализирующей образование простагландинов (Pg) из арахидоновой кислоты, которые играют важную роль в патогенезе боли, воспаления и лихорадки. По силе анальгезирующего эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВП. После внутримышечного введения начало анальгезирующего действия отмечается через 30 мин, максимальный эффект достигается через 1-2 ч.

Фармакокинетика

Максимальное накопление в тканях (C_{max}) 30 мг - 1,5-3 мкг/мл, 60 мг - 3-5,5 мкг/мл. Время достижения максимальной концентрации (T_{Cmax}) – 15-70 мин. C_{max} после внутривенной инфузии 15 мг - 1,5-3 мкг/мл, 30 мг - 3-5 мкг/мл. Связь с белками плазмы – 99 %.

Время достижения равновесной концентрации (C_{ss}) - 24 ч при назначении 4 раза в сутки (выше субтерапевтической) и составляет при внутримышечном введении 15 мг - 0,5- 1 мкг/мл, 30 мг - 1-2,5 мкг/мл, при внутривенной инфузии 15 мг - 0,5-1 мкг/мл, 30 мг - 1,5-3 мкг/мл. Объем распределения - 0,15-0,3 л/кг. У больных с почечной недостаточностью объем распределения кеторолака может увеличиваться в 2 раза, а объем распределения его R-энантиомера - на 20 %. Проникает в грудное молоко: при приеме матерью 10 мг кеторолака C_{max} в молоке достигается через 2 ч после приема первой дозы и составляет 7 мг/мл, через 2 ч после применения второй дозы кеторолака (при использовании препарата 4 раза в сутки) - 8 мг/мл. Более 50 % введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды, которые выводятся почками, и p-гидрокскеторолак. Выводится на 90 % почками, 6 % - через

кишечник. Период полувыведения ($T_{1/2}$) у пациентов с нормальной функцией почек - в среднем 5 ч. $T_{1/2}$ возрастает у пожилых пациентов и укорачивается у молодых. Функция печени не оказывает влияния на $T_{1/2}$. У пациентов с нарушением функции почек при концентрации креатинина в плазме 20-50 мг/л $T_{1/2}$ - 10-11 ч, при более выраженной почечной недостаточности - более 13 ч. Не выводится путем гемодиализа.

Показания к применению

Болевой синдром сильной и умеренной выраженности при следующих состояниях:

- травма;
- зубная боль;
- боли в послеоперационном периоде;
- онкологические заболевания;
- миалгия;
- артралгия;
- невралгия;
- радикулит;
- вывихи, растяжения;
- ревматические заболевания.

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент применения; на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания

- гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или др. НПВП (в т.ч. в анамнезе);
- крапивница, ринит, вызванные приемом НПВП (в анамнезе);
- непереносимость лекарственных средств пиразолонового ряда;
- гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины);

Аллергические реакции: редко - анафилаксия или анафилактоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ или диспноэ, отеки век, периорбитальный отек, одышка, затрудненное дыхание, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание).

Прочие: часто - отеки (лица, голеней, лодыжек, пальцев, ступней, повышение массы тела); менее часто - повышенное потоотделение, редко - лихорадка.

Если у Вас развились любые из указанных в инструкции побочных эффектов, как можно скорее обратитесь к врачу.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы: боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенное поражение ЖКТ, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: симптоматическое (поддержание жизненно важных функций организма).

Диализ – малоэффективен.

Лекарственное взаимодействие

Совместное применение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака. Прием с другими НПВП, глюкокортикостероидными средствами, этанолом, кортикотропином, препаратами кальция увеличивает риск изъязвления слизистой оболочки ЖКТ и развития желудочно-кишечных кровотечений.

Одновременное применение с антикоагулянтными лекарственными средствами (ЛС) - производными кумарина и индандиона, гепарином, тромболитиками (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа), антиагрегантными ЛС, цефалоспорины, вальпроевой кислотой и аминосалициловой кислотой повышает риск развития кровотечений.

Снижает эффект гипотензивных и диуретических ЛС (снижает синтез Pg в почках).

Применение совместно с метотрексатом повышает гепато- и нефротоксичность кеторолака (совместное их применение возможно только при использовании низких доз последнего и контроле его концентрации в плазме).

При применении с другими нефротоксичными ЛС (в том числе с препаратами золота)

стоматит, метеоризм, запор, рвота, ощущение переполнения желудка; редко - снижение аппетита, тошнота, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в т.ч. с перфорацией и/или кровотечением - боль в животе, спазм или жжение в эпигастральной области, кровь в кале или мелена, рвота с кровью или по типу "кофейной гущи", тошнота, изжога и др.), холестатическая желтуха, гепатит, гепатомегалия, острый панкреатит.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - острая почечная недостаточность, боль в пояснице, гематурия, азотемия, гемолитико-уремический синдром (гемолитическая анемия, почечная недостаточность, тромбоцитопения, пурпура), учащение мочеиспускания, повышение или снижение объема мочи, нефрит, отеки почечного генеза.

Со стороны органов чувств: редко - снижение слуха, звон в ушах, нарушение зрения (в т.ч. нечеткость зрительного восприятия).

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм, ринит, отек легких, отек гортани (одышка, затруднение дыхания).

Со стороны центральной нервной системы (ЦНС): часто - головная боль, головокружение, сонливость, редко - асептический менингит (лихорадка, сильная головная боль, судороги, ригидность мышц шеи и/или спины), гиперактивность (изменение настроения, беспокойство), галлюцинации, депрессия, психоз, обморок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - повышение артериального давления.

Со стороны органов кроветворения: редко - анемия, эозинофилия, лейкопения.

Со стороны системы гемостаза: редко - кровотечение из послеоперационной раны, носовое кровотечение, ректальное кровотечение.

Со стороны кожных покровов: менее часто - кожная сыпь (включая макулопапулезную сыпь), пурпура, редко - эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, гиперемия, уплотнение или шелушение кожи, увеличение и/или болезненность небных миндалин), крапивница, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Местные реакции: менее часто - жжение или боль в месте введения.

- глюкокортикостероиды (в т.ч. преднизолон).

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Применение во время беременности и в период лактации

Проникает в грудное молоко в незначительных количествах. Применение в III триместре беременности и при кормлении грудью противопоказано (следует отказаться от кормления на период применения препарата). В крайних случаях при необходимости использования препарата во время I и II триместров беременности следует сопоставить пользу для матери и риск для плода.

Способ применения и дозы

Внутримышечно, внутривенно.

При внутривенном введении дозу необходимо вводить не менее чем за 15 с (для лекарственных форм, содержащих этанол).

Пациентам от 16 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг, внутримышечно за 1 введение вводят не более 60 мг (включая пероральную дозу); обычно по 30 мг каждые 6 ч; внутривенно - по 30 мг (не более 15 доз за 5 сут).

Внутримышечно взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг или с хронической почечной недостаточностью (ХПН) за 1 введение вводят не более 30 мг (включая пероральную дозу); обычно - по 15 мг (не более 20 доз за 5 сут); в/в - не более 15 мг каждые 6 ч (не более 20 доз за 5 сут).

Максимальные суточные дозы для внутримышечного и внутривенного введения составляют для пациентов от 16 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг - 90 мг/сут; взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг или с ХПН, а также пожилым пациентам (старше 65 лет) - для внутримышечного и внутривенного введения 60 мг. Длительность лечения не должна превышать 5 сут.

Побочное действие

Часто - более 3 %, менее часто - 1-3 %, редко - менее 1 %.

Со стороны пищеварительной системы: часто - гастралгия, диарея; менее часто -

- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) в стадии обострения;
- гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);
- кровотечения или высокий риск их развития;
- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин),
- тяжёлая печеночная недостаточность или активное заболевание печени;
- состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;
- подтверждённая гиперкалиемия;
- воспалительные заболевания кишечника;
- беременность (III триместр);
- период родов, период лактации;
- детский возраст до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

Если у Вас повышенная чувствительность к кеторолаку или другим компонентам препарата, перед приемом обязательно проконсультируйтесь с врачом.

С осторожностью

Бронхиальная астма, наличие факторов, повышающих токсичность в отношении желудочно-кишечного тракта (ЖКТ): алкоголизм и холецистит, хроническая сердечная недостаточность, отечный синдром; артериальная гипертензия, нарушение функции почек, холестаз, сепсис, одновременный прием с другими НПВП, пожилой возраст (старше 65 лет), беременность (I-II триместр).

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина 30-60 мл/мин.

Анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, подтвержденный факт наличия инфекции *Helicobacter pylori*, длительное использование НПВП, тяжелые соматические заболевания, сопутствующая терапия следующими препаратами:

- антикоагулянты (в т.ч. варфарин);
- антиагреганты (в т.ч. ацетилсалициловая кислота, клопидогрел);
- селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин);

повышается риск развития нефротоксичности.

ЛС, блокирующие канальцевую секрецию, снижают клиренс кеторолака и повышают его концентрацию в плазме.

Повышает эффект наркотических анальгетиков.

Миелотоксичные ЛС усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Если Вы принимаете другие препараты, необходимо проконсультироваться с врачом.

Особые указания

Перед назначением препарата необходимо выяснить вопрос о предшествующей аллергии на препарат или НПВП. Из-за риска развития аллергических реакций введение первой дозы проводят под тщательным наблюдением врача.

Гиповолемия повышает риск развития нефротоксических побочных реакций.

При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками. Не рекомендуется применять в качестве ЛС для премедикации, поддержания анестезии.

При совместном применении с другими НПВП могут наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, повышение артериального давления. Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч. Не использовать одновременно с парацетамолом более 5 сут.

Больным с нарушением свертывания крови назначают только при постоянном контроле числа тромбоцитов, особенно важно для послеоперационных больных, требующих тщательного контроля гемостаза.

Риск развития лекарственных осложнений возрастает при удлинении лечения (у больных с хроническими болями) и повышении дозы препарата.

Для снижения риска развития НПВП-гастропатии назначают мизопростол, омепразол.

Влияние на способность водить автомашину и работать с механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 30 мг/мл.

По 1,0 мл в ампулы светозащитного стекла тип I с цветным кольцом разлома или с цветной точкой и насечкой и/или с дополнительными цветными идентификационными кольцами или иной кодировкой.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку. По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре от 15 до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения: ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

Юридический адрес: 115533, г. Москва, проспект Андропова, д.22

Адрес производства: 141345, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н,
д. Сватково, п/о Сватково

Тел./факс: (495) 956-29-30

Претензии потребителей направлять по адресу производства.

Производитель: ЗАО «ФармФирма «Сотекс».

Начальник медицинского отдела

Капашин А.В.

