

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
КЕТАЛГИН®

Регистрационный номер:

Торговое название: Кеталгин®

Международное непатентованное название: кеторолак

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Описание: таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые. На срезе белого или почти белого цвета.

Состав на одну таблетку:

активное вещество: кеторолак (кеторолака трометамин) 10 мг;

вспомогательные вещества: ядро - целлюлоза микрокристаллическая, лактоза (сахар молочный), магния стеарат; оболочка - гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), тальк, титана диоксид, макрогол 6000 (полиэтиленоксид 6000).

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: [M01AB15]

Фармакологические свойства

Кеталгин (кеторолак) - нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП). Кеторолак оказывает выраженное анальгетическое действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности циклооксигеназ (ЦОГ₁ и ЦОГ₂), катализирующих образование простагландинов из арахидоновой кислоты, которые играют важную роль в патогенезе боли, воспаления и лихорадки. По силе анальгетического эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВП.

После приема внутрь начало обезболивающего действия отмечается через 1 час, максимальный эффект достигается через 2-3 часа.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь - быстрая, биодоступность - 80-100 %. Максимальная концентрация в крови C_{max} после перорального приема 10 мг - 0,82-1,46 мкг/мл, время достижения максимальной концентрации $T_{C_{max}}$ - 10-78 мин. Связь с белками плазмы - 99 %. Время достижения стационарной (равновесной) концентрации C_{ss} при пероральном введении - 24 часа при назначении 4 раза в сутки (выше субтерапевтической) и составляет после перорального приема 10 мг - 0,39-0,79 мкг/мл.

Объем распределения составляет 0,15-0,33 л/кг. У больных с почечной недостаточностью объем распределения препарата может увеличиваться в 2 раза, а объем распределения его R-энантиомера - на 20 %.

Препарат проникает в грудное молоко: при приеме матерью 10 мг кеторолака C_{max} в молоке достигается через 2 часа после приема первой дозы и составляет 7,3 нг/мл, через 2 часа после применения второй дозы кеторолака (при использовании препарата 4 раза в сутки) и составляет 7,9 нг/л.

Более 50 % введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды, которые вы-

водятся почками, и гидроксикеторолак. Выводится препарат на 91 % почками, 6 % - через кишечник.

Период полувыведения $T_{1/2}$ у пациентов с нормальной функцией почек составляет в среднем 5,3 часа (2,4-9 часов после перорального приема 10 мг). $T_{1/2}$ 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 19-50 мг/л (168-442 мкмоль/л) $T_{1/2}$ составляет 10,3-10,8 часа, при более выраженной почечной недостаточности - более 13,6 часа.

Общий клиренс составляет при пероральном приеме 10 мг - 0,025 л/кг/ч; у пациентов с почечной недостаточностью при концентрации креатинина в плазме 19-50 мг/л при пероральном введении 10 мг - 0,016 л/кг/ч.

Препарат не выводится путем гемодиализа.

Показания к применению

Болевой синдром сильной и умеренной выраженности: травмы, зубная боль, боли в послеоперационном и послеоперационном периоде, онкологические заболевания, миалгия, артралгия, невралгия, радикулит, вывихи, растяжения, ревматические заболевания.

Противопоказания

Гиперчувствительность к кеторолаку или вспомогательным веществам, полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных препаратов (в том числе в анамнезе), гиповolemия (независимо от вызвавшей ее причины), эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в стадии обострения, воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит) в фазе обострения, нарушения свертываемости крови (в т.ч. гемофилия), кровотечения или высокий риск их развития, декомпенсированная сердечная недостаточность, тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, гиперкалиемия, период после проведения аортокоронарного шунтирования, печеночная недостаточность, беременность (III триместр), период родов, период лактации, детский возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не установлены).

С осторожностью

Гиперчувствительность к другим НПВП, ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, застойная сердечная недостаточность, дислипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 60 мл/мин), бронхиальная астма, холецистит; послеоперационный период, артериальная гипертензия, активный гепатит, сепсис, системная красная волчанка, беременность (I и II триместры), анамнестические данные о язвенном поражении желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, пожилой возраст (старше 65 лет), одновременный прием с другими НПВП, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, сопутствующая терапия следующими препаратами:

антикоагулянты (например, варфарин)

антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрель),

пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон),

селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

В случае наличия у Вас заболеваний/состояний, перечисленных в данном разделе, перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

Способ применения и дозы

Прием внутрь. Максимальная суточная доза при пероральном применении составляет 40 мг. Длительность лечения не должна превышать 5 суток.

При пероральном применении пациентам от 18 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг, рекомендуемая доза составляет 20 мг в первый прием, далее по 10 мг 4 раза в сутки, но не более 40 мг/сут.

Взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг или с почечной недостаточностью, пожилым пациентам - 10 мг в первый прием и далее по 10 мг 4 раза в сутки.

Следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Побочное действие

Часто — более 3 %, менее часто — 1-3 %, редко — менее 1 %. Со стороны пищеварительной системы: часто - гастралгия, диарея; менее часто - стоматит, метеоризм, запор, рвота, ощущение переполнения желудка; редко - снижение аппетита, тошнота, эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в т.ч. с перфорацией и/или кровотечением - абдоминальная боль, спазм или жжение в эпигастриальной области, кровь в кале или мекена, 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, гемолитический уремиический синдром (гемолитическая анемия, почечная недостаточность, тромбоцитопения, пурпура), частое мочеиспускание, повышение или снижение объема мочи, нефрит, отеки почечного генеза.

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

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

Со стороны 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.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто — повышение артериального давления, редко - обморок.

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, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

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 - повышенная потливость, редко - отек языка, лихорадка.

Передозировка

Симптомы (при однократном введении): абдоминальные боли, тошнота, рвота, эрозивно-язвенное поражение желудочно-кишечного тракта, нарушение функции почек, метаболический ацидоз. Лечение: симптоматическое (поддержание жизненно важных функций организма). Диализ – малоэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Совместное назначение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака.

Прием с другими НПВП, гидрокортикостероидами, этанолом, кортикотропином, препаратами Ca^{2+} увеличивает риск ulcerации и развития желудочно-кишечных кровотечений. Одновременное назначение с антикоагулянтными средствами – производными кумарина и индандиона, гепарином, тромболитиками (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа), антиагрегантными препаратами, цефалоспорины, вальпроевой и ацетилсалициловой кислотой повышает риск развития кровотечений.

Снижает эффект гипотензивных и диуретических препаратов (снижает синтез простагландинов в почках).

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

При назначении с другими нефротоксичными препаратами (в т.ч. с препаратами золота) повышается риск развития нефротоксичности.

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

Повышает эффект наркотических анальгетиков.

Особые указания

Перед назначением препарата необходимо выяснить вопрос о предшествующей аллергии на препарат или другие НПВП.

Гиповолемия повышает риск развития нефротоксических побочных реакций. При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками. Не рекомендуется применять в качестве средства для премедикации, поддержания анестезии.

При совместном приеме с другими НПВП может наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, артериальная гипертензия. Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч. Не использовать одновременно с парацетамолом более 5 суток.

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

Препарат может изменять свойства тромбоцитов, однако не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях.

Применение препарата может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность.

Риск развития лекарственных осложнений возрастает при удлинении лечения (у больных с хроническими болями) и повышении пероральной дозы препарата более 40 мг/сут. Для снижения риска развития НПВП-гастропатии назначаются антацидные средства, мизопростол, омепразол.

В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 10 мг.

По 10 или 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку. 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности.

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

Условия отпуска из аптек

Отпускается по рецепту.

Наименование и адрес предприятия-производителя/организация, принимающая претензии:

ОАО "Фармстандарт-Лексредства", 305022, Россия, г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18.
тел/факс: (4712) 34-03-13. www.pharmstd.ru

Представитель

ОАО «Фармстандарт-Лексредства»



Е.В. Толстова

