

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Кетопрофен-АКОС, раствор для внутривенного и внутримышечного введения, 50 мг/мл

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: кетопрофен.

1 мл раствора содержит 50 мг кетопрофена.

1 ампула (2 мл) содержит 100 мг кетопрофена.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: пропиленгликоль, этанол (спирт этиловый 96 % в пересчете на абсолютный этанол) - 100 мг; бензиловый спирт.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе «6.1. Перечень вспомогательных веществ»

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Прозрачная бесцветная или с желтоватым оттенком жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Кетопрофен-АКОС показан к применению у взрослых и детей старше 15 лет для терапии:

- ревматоидного артрита; серонегативного артрита: анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева), псориатического артрита, реактивного артрита (синдром Рейтера);
- подагры, псевдоподагры;
- остеоартрита;
- мигрени;
- радикулита;
- внесуставных проявлений ревматических заболеваний (тендинит, бурсит, капсулит плечевого сустава);
- посттравматического и послеоперационного болевого синдрома;
- болевого синдрома при онкологических заболеваниях;
- альгодисменореи.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Способ применения

Максимальная суточная доза составляет 200 мг. Необходимо тщательно оценить соотношение предполагаемой пользы и риска до начала приема кетопрофена в дозе 200 мг/сутки.

Взрослые и дети старше 15 лет.

Внутривенно, внутримышечно.

Внутримышечное введение

Рекомендуемая доза при внутримышечном введении составляет 100 мг (1 ампула) 1-2 раза в день.

Продолжительность внутримышечного введения препарата не должна превышать 2-3 дня. При необходимости дальнейшую терапию кетопрофеном продолжают с применением других лекарственных форм (таблетки, капсулы, суппозитории).

Внутривенное введение

Внутривенное инфузионное введение кетопрофена должно проводиться только в условиях стационара.

Продолжительность инфузии должна составлять от 0,5 до 1 ч.

Внутривенный способ введения следует применять не более 48 ч.

Непродолжительная внутривенная инфузия: 100-200 мг (1-2 ампулы) кетопрофена, разведенных в 100 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, вводится в течение 0,5-1 ч.

Продолжительная внутривенная инфузия: 100-200 мг (1-2 ампулы) кетопрофена, разведенных в 500 мл инфузионного раствора (0,9 % раствор натрия хлорида, лактатсодержащий раствор Рингера, глюкоза), вводится в течение 8 часов. Кетопрофен можно сочетать с анальгетиками центрального действия; его можно смешивать с морфином в одном флаконе: 10-20 мг морфина и 100-200 мг кетопрофена разводят в 500 мл инфузионного раствора (0,9 % раствор натрия хлорида или лактатсодержащий раствор Рингера). При необходимости парентеральное введение препарата Кетопрофен-АКОС можно сочетать с применением пероральных форм (таблетки, капсулы) или ректальных суппозиторияев.

Специальные меры предосторожности

Кетопрофен фармацевтически несовместим с раствором трамадола из-за выпадения осадка.

Инфузионные флаконы следует обернуть черной бумагой или алюминиевой фольгой, поскольку кетопрофен чувствителен к свету.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста существует повышенный риск развития тяжелых последствий нежелательных реакций.

Рекомендуется начинать применение кетопрофена у пациентов пожилого возраста с минимальной дозы препарата, поддерживая в дальнейшем минимально эффективную дозу.

Почечная недостаточность

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью применение кетопрофена противопоказано (см. раздел 4.3.).

Печеночная недостаточность

У пациентов с хронической печеночной недостаточностью и пониженным содержанием сывороточного альбумина дозу кетопрофена следует снизить.

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью применение кетопрофена противопоказано (см. раздел 4.3.).

Дети

Препарат Кетопрофен-АКОС не показан к применению у детей и подростков в возрасте до 15 лет.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к кетопрофену или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1., а также к салицилатам или другим нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП);
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, ангионевротического отека, крапивницы, острого ринита, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВП (в том числе в анамнезе);
- язвенная болезнь желудка или двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, желудочно-кишечные язвы, кровотечения и перфорации;
- хроническая диспепсия, воспалительные заболевания кишечника, язвенный колит, болезнь Крона, дивертикулит в стадии обострения;
- гемофилия и другие нарушения свертываемости крови (в том числе геморрагический диатез);
- тяжелая почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия;
- тяжелая печеночная недостаточность, активное заболевание печени;

- декомпенсированная сердечная недостаточность, периоперационный период при аортокоронарном шунтировании;
- цереброваскулярные и другие активные кровотечения;
- детский возраст (до 15 лет);
- беременность в сроке более 20 недель;
- период грудного вскармливания.

При внутримышечном введении:

- нарушение гемостаза или одновременное применение антикоагулянтов.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Бронхиальная астма в анамнезе, алкоголизм, табакокурение, алкогольный цирроз печени, гипербилирубинемия, прогрессирующие заболевания печени, печеночная недостаточность, дегидратация, хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, заболевания крови, ишемическая болезнь сердца, клинически выраженные сердечно-сосудистые, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевание периферических артерий, почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин), язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в анамнезе, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, длительное применение НПВП, тяжелые соматические заболевания, пациенты с уменьшением объема циркулирующей крови, одновременный прием пероральных глюкокортикоидных средств (в том числе преднизолонa), антикоагулянтов (в том числе варфарина), антиагрегантов (в том числе клопидогреля), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в том числе циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), пожилой возраст (старше 65 лет, в т.ч. получающие диуретики, ослабленные пациенты и с низкой массой тела), курение, беременность в сроке до 20 недель.

Особые указания

С целью снижения риска развития нежелательных явлений кетопрофена рекомендуется применение минимальной эффективной дозы в течение минимально короткого периода.

Желудочно-кишечные кровотечения, язвы и перфорации

Сообщалось о развитии желудочно-кишечных кровотечений, язв и перфораций (с возможным летальным исходом) во время применения НПВП на любом этапе лечения, вне зависимости от наличия угрожающих симптомов или тяжелых заболеваний ЖКТ в анамнезе.

Риск желудочно-кишечного кровотечения, язвообразования или перфорации повышается при применении более высоких доз НПВП, при наличии язвенной болезни в анамнезе,

особенно осложненной кровотечением или перфорацией, и при применении у пожилых пациентов. У этих групп пациентов лечение следует начинать с минимально возможных доз. Следует рассмотреть совместное применение с гастропротективными препаратами (например, мизопростолом или ингибиторами протонной помпы) у данных групп пациентов, а также у пациентов, которым необходимо применение ацетилсалициловой кислоты в низких дозах или других препаратов, повышающих риск развития нежелательных реакций со стороны ЖКТ (см. раздел 4.5.).

Риск желудочно-кишечного кровотечения: относительный риск увеличивается у пациентов с низкой массой тела. При возникновении таких нарушений со стороны ЖКТ, как кровотечения или язвообразование, лечение должно быть немедленно прекращено.

Пациенты с нежелательными реакциями со стороны ЖКТ в анамнезе (особенно пациенты пожилого возраста) должны сообщать о всех необычных симптомах со стороны ЖКТ (прежде всего о желудочно-кишечном кровотечении), в особенности на начальных этапах лечения.

В случае развития желудочно-кишечного кровотечения или образования язв органов ЖКТ при применении кетопрофена, лечение следует немедленно прекратить.

Тяжелые кожные реакции

Очень редко сообщалось о развитии тяжелых реакций со стороны кожи (с возможным летальным исходом), включая эксфолиативный дерматит, синдрома Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз, связанных с применением НПВП (см. раздел 4.8.). Наибольший риск развития данных состояний приходится на начало терапии, в большинстве случаев они развивались в течение первого месяца лечения. Следует прекратить применение кетопрофена при первом появлении кожной сыпи, изъязвления слизистых оболочек или любых других признаков гиперчувствительности.

Гиперкалиемия

Возможно развитие гиперкалиемии, особенно у пациентов с сахарным диабетом, почечной недостаточностью и/или при совместном применении с калийсберегающим препаратами (см. раздел 4.5.). У таких пациентов следует тщательно контролировать уровень калия.

При длительном применении НПВП необходимо периодически оценивать клинический анализ крови, а также контролировать функцию почек и печени, в особенности у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет), проводить анализ кала на скрытую кровь.

У пациентов с отклонениями в функциональных тестах печени или с заболеваниями печени в анамнезе следует периодически контролировать уровень «печеночных» трансаминаз, особенно при длительном лечении.

Необходимо тщательное наблюдение за пациентами с артериальной гипертензией и/или застойной сердечной недостаточностью, так как имеются сообщения о развитии или усилении задержки жидкости в организме и развитии отеков во время терапии кетопрофеном.

Применение некоторых НПВП может быть связано с риском развития артериальных тромбозов (инфаркт миокарда, инсульт). Данных для исключения такого риска для кетопрофена недостаточно. Сообщалось о повышении риска развития артериальных тромбозов при применении неаспириновых НПВП для купирования периоперационных болей при аортокоронарном шунтировании.

У пациентов с астмой, с хроническим ринитом, хроническим синуситом и/или назальным полипозом, возможно возникновение аллергических реакций к ацетилсалициловой кислоте и/или НПВП чаще, чем у остальных пациентов. Применение этих препаратов может приводить к астматическим приступам или бронхоспазму, особенно у пациентов с аллергией на ацетилсалициловую кислоту или НПВП в анамнезе (см. раздел 4.3.).

Как и другие НПВП, кетопрофен может маскировать симптомы инфекционно-воспалительных заболеваний. В случае обнаружения признаков инфекции или ухудшении самочувствия на фоне применения препарата необходимо незамедлительно обратиться к врачу.

В начале лечения следует проводить тщательный мониторинг почечной функции у пациентов с сердечной недостаточностью, циррозом и нефрозом, у пациентов, принимающих диуретики, у пациентов с хронической почечной недостаточностью, особенно если пациент в пожилом возрасте. У таких пациентов прием кетопрофена может вызвать снижение почечного кровотока в результате ингибирования простагландина и привести к почечной декомпенсации. Лечение кетопрофеном следует прекратить перед проведением радикальных хирургических вмешательств. Применение кетопрофена может влиять на женскую фертильность, поэтому препарат не рекомендуется применять женщинам, планирующим беременность. Пациенткам с бесплодием (в т.ч. проходящим обследование) следует рассмотреть вопрос об отказе от НПВП.

При сильно выраженном болевом синдроме возможно внутривенное введение кетопрофена совместно с производными морфина.

Так как препарат в качестве вспомогательного компонента содержит пропиленгликоль, при применении препарата могут возникнуть симптомы, схожие с приемом алкоголя.

Так как в разовой дозе препарата (2 мл препарата) в качестве вспомогательного компонента содержится 800 мг бензилового спирта, данный препарат противопоказан недоношенным и новорожденным. Из-за риска смертельных токсических реакций при

введении бензилового спирта в дозе, превышающей 90 мг/кг/сут, данный препарат нельзя применять у младенцев и детей младше 3 лет.

Данный лекарственный препарат содержит 96% этанола (алкоголя), то есть до 200 мг на дозу препарата. Препарат вреден для лиц с алкоголизмом. Необходимо учитывать наличие в препарате данного вспомогательного вещества беременным и кормящим грудью женщинам, детям и таким группам высокого риска, как пациенты с заболеваниями печени и эпилепсией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Препараты, совместное применение с которыми не рекомендуется

Не рекомендовано совместное применение кетопрофена с другими НПВП (включая селективные ингибиторы ЦОГ-2), салицилатами в высоких дозах, вследствие повышения риска желудочно-кишечных кровотечений и изъязвления слизистой желудочно-кишечного тракта.

Антикоагулянты

Одновременное применение с антикоагулянтами (гепарин, варфарин), антиагрегантами (тиклопидин, клопидогрел), ингибиторами тромбина (дабигатран), прямыми ингибиторами фактора свертывания Ха (апиксабан, ривароксабан, эдоксабан) повышает риск развития кровотечений. Если применение такой комбинации неизбежно, следует тщательно контролировать состояние пациента.

Препараты лития

При одновременном применении с препаратами лития возможно повышение концентрации лития в плазме крови вплоть до токсических значений из-за снижения экскреции лития почками. Следует тщательно контролировать концентрацию лития в плазме крови и своевременно корректировать дозу препаратов лития во время и после лечения НПВП.

Метотрексат в дозах свыше 15 мг в неделю

Повышает гематологическую токсичность метотрексата, особенно при его применении в высоких дозах (более 15 мг в неделю), что, вероятно, связано с вытеснением метотрексата, связанного белками, и снижением его почечного клиренса. Интервал времени между прекращением или началом терапии кетопрофеном и приемом метотрексата должен составлять не менее 12 часов.

Препараты, при совместном применении с которыми следует соблюдать осторожность

Сочетания, которые необходимо применять с осторожностью

Диуретические свойства

На фоне терапии кетопрофеном пациенты, принимающие диуретики, особенно при развитии дегидратации, имеют более высокий риск развития почечной недостаточности вследствие снижения почечного кровотока, вызванного ингибированием синтеза простагландинов. Перед началом применения кетопрофена у таких пациентов следует провести регидратационные мероприятия. После начала лечения необходимо контролировать функцию почек.

Ингибиторы АПФ и антагонисты рецепторов ангиотензина II

Совместное применение препарата с ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) и блокаторами рецепторов ангиотензина II у пациентов с нарушениями функции почек (при дегидратации, у пациентов пожилого возраста) может привести к усугублению ухудшения функции почек, в т.ч. к развитию острой почечной недостаточности.

Метотрексат в дозах ниже 15 мг в неделю

В течение первых недель одновременного применения кетопрофена и метотрексата в дозе, не превышающей 15 мг в неделю, следует еженедельно контролировать анализ крови. У пациентов пожилого возраста или при возникновении каких-либо признаков нарушения функции почек следует выполнять исследование чаще.

Тенофовир

Совместное применение тенофовира дисопроксил фумарата и НПВП может повышать риск развития почечной недостаточности.

Никорандил

Совместное применение никорандила и НПВП может повышать риск развития серьезных осложнений, таких как язвы, перфорация и кровотечение из органов ЖКТ (см. раздел 4.4.).

Сердечные гликозиды

Не было отмечено фармакокинетических взаимодействий между кетопрофеном и дигоксином. Однако при их совместном применении следует соблюдать осторожность, особенно у пациентов с почечной недостаточностью, поскольку НПВП могут ослаблять функцию почек и снижать почечный клиренс сердечных гликозидов.

Препараты, взаимодействие с которыми следует учитывать

Сочетания, которые необходимо принимать во внимание

Гипотензивные препараты (бета-адреноблокаторы, ингибиторы АПФ, диуретики)

Кетопрофен может ослаблять действие гипотензивных средств (бета-блокаторов, ингибиторов АПФ, диуретиков).

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС)

Одновременное применение с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина

(СИОЗС) повышает риск развития желудочно-кишечных кровотечений (см. раздел 4.4.).

Тромболитики

Одновременное применение с тромболитиками повышает риск развития кровотечения.

Одновременное применение с солями калия, калийсберегающими диуретиками, ингибиторами АПФ, блокаторами рецепторов ангиотензина II, НПВП, низкомолекулярными гепаринами, циклоспорином, такролимусом и триметопримом повышает риск развития гиперкалиемии.

Препараты, взаимодействие с которыми следует принимать во внимание

При одновременном применении с циклоспорином, такролимусом возможен риск развития аддитивного нефротоксического действия, особенно у пациентов пожилого возраста. Применение нескольких антиагрегантных препаратов (тирофибан, эптифибатид, абциксимаб, илопрост) повышает риск развития кровотечения.

НПВП могут уменьшать эффективность мифепристона. Прием НПВП следует начинать не ранее, чем через 8-12 дней после отмены мифепристона.

Фармацевтически несовместим с раствором трамадола из-за выпадения осадка.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Ингибирование синтеза простагландинов может оказать нежелательное влияние на течение беременности и/или на эмбриональное развитие. Данные, полученные в ходе эпидемиологических исследований при применении ингибиторов синтеза простагландинов на ранних сроках беременности, подтверждают повышение риска самопроизвольного аборта и формирования пороков сердца (~1-1,5%). Риск повышается с увеличением дозы и длительности лечения.

Назначать препарат беременным женщинам до 20-й недели беременности возможно только в случае, когда преимущества для матери оправдывают возможный риск для плода. В случае доказанной пользы применения кетопрофена у женщин до 20-й недели беременности и у женщин, планирующих беременность, следует придерживаться минимальной эффективной дозы препарата и продолжительности лечения.

Кетопрофен, как и другие НПВП, не следует применять женщинам с 20-й недели беременности в связи с возможным развитием маловодия и/или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция). Кроме того, с 20-й недели беременности все ингибиторы синтеза простагландина могут оказывать токсическое влияние на плод, приводя к преждевременному закрытию артериального протока и легочной гипертензии. У беременных женщин с 20-й недели беременности возможно развитие слабости родовой активности матки и увеличение времени кровотечения даже

при применении низких доз кетопрофена.

Лактация

На сегодняшний момент отсутствуют данные о проникновении кетопрофена в грудное молоко, поэтому применение кетопрофена при грудном вскармливании противопоказано.

Фертильность

Применение кетопрофена может влиять на женскую фертильность, поэтому препарат не рекомендуется применять женщинам, планирующим беременность.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В период применения препарата необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как препарат может вызывать головокружение и другие нежелательные реакции (НР), которые могут влиять на указанные способности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме НР

Частота возникновения нежелательных реакций приведена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (по имеющимся данным оценить частоту встречаемости не представляется возможным).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко – геморрагическая анемия; частота неизвестна – агранулоцитоз, тромбоцитопения, гемолитическая анемия, лейкопения.

Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна – анафилактические реакции (включая анафилактический шок).

Нарушения метаболизма и питания: частота неизвестна – гипонатриемия, гипокалиемия (см. раздел 4.4.).

Психические нарушения: частота неизвестна – спутанность сознания, эмоциональная лабильность.

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль, головокружение, сонливость; частота неизвестна – асептический менингит, судороги, вертиго.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нечеткость зрения (см. раздел 4.4.).

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: редко – шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: частота неизвестна – сердечная недостаточность.

Нарушения со стороны сосудов: частота неизвестна – повышение артериального давления, васкулит (включая лейкоцитокластический васкулит).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – обострение бронхиальной астмы; частота неизвестна – бронхоспазм (в особенности, у пациентов с гиперчувствительностью к НПВП), ринит.

Желудочно-кишечные нарушения: часто – тошнота, рвота; нечасто – запор, диарея, гастрит; редко – пептическая язва, стоматит; частота неизвестна – желудочно-кишечное кровотечение, перфорация органов желудочно-кишечного тракта, панкреатит. Желудочно-кишечный дискомфорт, боль в желудке и редкие случаи колита.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: редко – гепатит, повышение активности «печеночных» трансаминаз, повышение концентрации билирубина вследствие развития нарушений, вызванных гепатитом.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожная сыпь, кожный зуд; частота неизвестна – фотосенсибилизация, алопеция, крапивница, обострение хронической крапивницы, ангионевротический отек, эритема, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз, острый генерализованный экзантематозный пустулез.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна – острая почечная недостаточность, тубулоинтерстициальный нефрит, нефритический синдром.

Задержка жидкости/натрия в организме с возможным развитием отеков и гиперкалиемии (см. разделы 4.4. и 4.5.). Органическое поражение почек, способное вызывать острую почечную недостаточность: сообщалось о единичных случаях острого тубулярного и папиллярного некроза.

Общие нарушения в месте введения: нечасто – периферические отеки; частота неизвестна – боль и ощущение жжения в месте введения, реакции в месте введения, в т. ч. ливедоидная васкулопатия, известная как синдром Николау.

Данные клинических исследований и эпидемиологические данные дают основание предполагать, что применение некоторых НПВП (особенно при длительном применении в высоких дозах) может быть связано с повышенным риском развития артериальных тромбозов (например, инфаркта миокарда и инсульта) (см. раздел 4.4.).

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

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке кетопрофена могут отмечаться головная боль, головокружение, сонливость, тошнота, рвота, диарея и боль в области живота. При сильной интоксикации наблюдались гипотония, угнетение дыхания и желудочно-кишечные кровотечения. При развитии данных симптомов пациента необходимо немедленно перевести в специализированное отделение и начать симптоматическое лечение.

Лечение

Специфического антидота не обнаружено.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Механизм действия, фармакологические эффекты

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AE03.

Кетопрофен является нестероидным противовоспалительным препаратом (НПВП). Оказывает противовоспалительное, анальгетическое и жаропонижающее действие, связанное с подавлением активности циклооксигеназы-1 (ЦОГ-1) и циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2), регулирующих синтез простагландинов (Pg).

Стабилизирует *in vitro* и *in vivo* липосомальные мембраны, при высоких концентрациях *in vitro* кетопрофен подавляет синтез брадикинина и лейкотриенов.

Кетопрофен не оказывает отрицательного влияния на состояние суставного хряща.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При внутривенном введении кетопрофена средняя плазменная концентрация через 5 мин от начала инфузии и до 4 мин после ее прекращения составляет $26,4 \pm 5,4$ мкг/мл. Биодоступность составляет 90 %.

При однократном внутримышечном введении 100 мг кетопрофена препарат обнаруживается в плазме крови через 15 мин после инъекции, а пиковая концентрация (1,3 мкг/мл) достигается через 2 ч. Биодоступность препарата повышается линейно с увеличением дозы.

Распределение

Кетопрофен на 99 % связан с белками плазмы крови, в основном с альбуминовой фракцией. Объем распределения в тканях составляет 0,1-0,2 л/кг.

Кетопрофен проникает в синовиальную жидкость, и при внутривенном введении 100 мг через 3 ч его концентрация достигает 1,5 мкг/мл, что составляет 50 % от концентрации в плазме крови (около 3 мкг/мл). Через 9 ч концентрация в синовиальной жидкости составляет 0,8 мкг/мл, а в плазме крови – 0,3 мкг/мл, что означает, что кетопрофен медленнее проникает в синовиальную жидкость и медленнее выводится из нее.

Равновесная концентрация кетопрофена достигается в крови через 24 ч после его приема. У пациентов пожилого возраста равновесная концентрация достигалась через 8,7 ч и составляла 6,3 мкг/мл.

После однократного внутримышечного введения 100 мг кетопрофена препарат обнаруживается в спинномозговой жидкости, как и в сыворотке крови, через 15 мин.

Биотрансформация

Кетопрофен подвергается интенсивному метаболизму с участием микросомальных ферментов печени. Он связывается с глюкуроновой кислотой и выводится из организма в виде глюкуронида. Активных метаболитов кетопрофена нет.

Элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) кетопрофена составляет 2 ч. До 80 % кетопрофена выводится почками в течение 24 ч, в основном (более 90 %) в форме глюкуронида кетопрофена, и около 10 % – через кишечник.

Фармакокинетическая-фармакодинамическая зависимость

Почечная недостаточность

У пациентов с почечной недостаточностью кетопрофен выводится медленнее, его $T_{1/2}$ увеличивается на 1 ч.

Печеночная недостаточность

У пациентов с печеночной недостаточностью кетопрофен может накапливаться в тканях; таким пациентам необходимо назначать препарат в минимальной терапевтической дозе.

Лица пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста метаболизм и выведение кетопрофена протекают медленнее, что имеет клиническое значение только для пациентов со сниженной функцией почек.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Пропиленгликоль

Этанол (спирт этиловый) 96 %

Бензиловый спирт

1 М раствор натрия гидроксида

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Не применимо

6.3. Срок годности (срок хранения).

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

При температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

2 мл в ампулы нейтрального светозащитного стекла.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачки из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению, скарификатор ампульный.

Скарификатор ампульный не вкладывают в случае использования ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом.

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»)

Адрес: 640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: + 7 (495) 646-28-68

Электронная почта: info@binnopharmgroup.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»)

Адрес: 640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: + 7 (495) 646-28-68

Электронная почта: info@binnopharmgroup.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(000430)-(PG-RU)

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: 17.11.2021

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Кетопрофен-АКОС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>