

Состав

действующее вещество: ketorolac tromethamine;

1 таблетка содержит кеторолака трометамина 10 мг;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: круглые таблетки белого цвета со слабым желтоватым оттенком, плоскоцилиндрической формы, с фаской.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные и противоревматические средства.
Кеторолак. Код АТХ М01А В15.

Фармакодинамика

Кеторолака трометамин – ненаркотический анальгетик. Это нестероидное противовоспалительное средство (далее – НПВС), которое проявляет противовоспалительную и слабую жаропонижающую активность. Кеторолака трометамин ингибирует синтез простагландинов и считается анальгетиком периферического действия. Он не имеет существенного влияния на опиатные рецепторы. После применения кеторолака трометамина в контролируемых клинических исследованиях не наблюдалось явлений, свидетельствующих об угнетении дыхания. Кеторолака трометамин не вызывает сужение зрачков.

Фармакокинетика

Кеторолака трометамин быстро и полностью абсорбируется после приема внутрь через 50 минут после приема разовой дозы 10 мг. Период полувыведения из плазмы крови составляет в среднем 5,4 часа (у лиц пожилого возраста – 6,2 часа). Более 99% кеторолака в плазме крови связывается с белками.

Фармакокинетика кеторолака является линейной. Стационарные уровни в плазме крови достигаются через 1 день при применении 4 раза в сутки. При длительном дозировании изменений не наблюдалось. Основным путем выведения кеторолака и его метаболитов является моча (91,4%), а остальная

часть выводится с калом. Диета, богатая жирами, снижает скорость абсорбции, но не объем, в то время как антациды не влияют на абсорбцию кеторолака.

Показания

Кратковременное лечение боли умеренной интенсивности, включая послеоперационные боли.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к кеторолаку или к любому компоненту лекарственного средства;
- пациенты с активной пептической язвой, с недавним желудочно-кишечным кровотечением или перфорацией, с язвенной болезнью или желудочно-кишечным кровотечением в анамнезе;
- бронхиальная астма, ринит, ангионевротический отек или крапивница, вызванные применением ацетилсалициловой кислоты или другими нестероидными противовоспалительными средствами (из-за возможности возникновения тяжелых анафилактических реакций);
- бронхиальная астма в анамнезе;
- не применять как анальгезирующее средство перед и во время оперативного вмешательства и после манипуляций на коронарных сосудах;
- тяжелая сердечная недостаточность;
- полный или частичный синдром полипов носа, отека Квинке или бронхоспазма;
- не применять пациентам, у которых было оперативное вмешательство с высоким риском кровоизлияния или неполной остановки кровотечения и пациентам, получающим антикоагулянты, включая низкие дозы гепарина (2500-5000 единиц каждые 12 часов);
- печеночная или умеренная/тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина в сыворотке крови более 160 мкмоль/л);
- подозреваемое или подтвержденное цереброваскулярное кровотечение, геморрагический диатез, включая нарушение свертываемости крови и высокий риск кровотечения;
- одновременное лечение другими НПВС (включая селективные ингибиторы циклооксигеназы), ацетилсалициловой кислотой, варфарином, пентоксифиллином, пробенецидом или солями лития;
- гиповолемия, дегидратация;
- риск возникновения почечной недостаточности вследствие уменьшения объема жидкости.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Кеторолак легко связывается с белками плазмы крови (среднее значение 99,2%), а степень связывания зависит от концентрации.

Нельзя применять одновременно с кеторолаком.

В связи с возможностью возникновения побочных эффектов кеторолак нельзя назначать с другими НПВС, включая селективные ингибиторы циклооксигеназы-2, или пациентам, получающим ацетилсалициловую кислоту, варфарин, литий, пробенецид, циклоспорин. НПВС не следует назначать в течение 8-12 суток после применения мифепристона, поскольку НПВС могут ослаблять эффект мифепристона.

Лекарственные средства в комбинации с кеторолаком следует назначать с осторожностью.

У здоровых лиц с нормоволемией кеторолак снижает диуретический эффект фуросемида примерно на 20%, следовательно, с особой осторожностью следует назначать препарат пациентам с сердечной декомпенсацией. НПВС могут усиливать сердечную недостаточность, уменьшать скорость гломерулярной фильтрации и повышать уровень сердечных гликозидов в плазме крови при одновременном введении с сердечными гликозидами. Кеторолак и другие НПВС могут ослаблять эффект гипотензивных средств. В случае одновременного применения кеторолака с ингибиторами АПФ существует повышенный риск нарушения функции почек, особенно у пациентов с уменьшенным объемом крови в организме. Существует потенциальный риск проявления нефротоксичности, если НПВС назначают вместе с такролимусом. Одновременное назначение вместе с диуретиками может приводить к ослаблению диуретического эффекта и повышению риска нефротоксичности НПВС. Как и с другими НПВС, с осторожностью следует одновременно назначать кортикостероидные лекарственные средства из-за повышенного риска возникновения желудочно-кишечных язв или кровотечений. Существует повышенный риск развития желудочно-кишечного кровотечения, если НПВС назначать в комбинации с антиагрегантными средствами и селективными ингибиторами обратного захвата серотонина. Рекомендуются быть осторожными при одновременном назначении метотрексата, поскольку сообщалось, что некоторые ингибиторы синтеза простагландинов снижают клиренс метотрексата и поэтому, возможно, повышают его токсичность.

Пациенты, принимающие НПВС и хинолоны, могут иметь повышенный риск развития судорог.

Одновременное применение НПВС с зидовудином приводит к повышению риска гематологической токсичности. Существует повышенный риск гемартроза и гематомы у ВИЧ-инфицированных, страдающих гемофилией и лечатся одновременно зидовудином и ибупрофеном.

Маловероятно, что следующие лекарственные средства взаимодействуют с кеторолаком.

Кеторолак не влияет на связывание дигоксина с белками плазмы крови. Исследования *in vitro* указывают на то, что при терапевтических концентрациях салицилата (300 мкг/мл) и выше связывание кеторолака уменьшалось примерно от 99,2% до 97,5%. Терапевтические концентрации дигоксина, варфарина, парацетамола, фенитоина и толбутамида не влияли на связывание кеторолака с белками плазмы крови. Поскольку кеторолак является высокоактивным лекарственным средством и имеющаяся его концентрация в плазме крови низкая, не ожидается, что он будет существенно замещать другие лекарственные средства, связанные с белками плазмы крови. Не ожидается, что кеторолак будет изменять фармакокинетику других лекарственных средств путем механизма индукции или ингибирования ферментов.

Противоэпилептические средства.

Сообщалось о единичных случаях возникновения приступов эпилепсии во время одновременного применения кеторолака и противоэпилептических средств (фенитоина, карбамазепина).

Психотропные средства.

При одновременном применении кеторолака и психотропных средств (флуоксетина, тиотексену, алпразолама) сообщалось о возникновении галлюцинаций.

Влияние на результаты лабораторных анализов.

Кеторолак угнетает агрегацию тромбоцитов и может продлить время кровотечения.

Особенности применения

Максимальная продолжительность лечения не должна превышать 5 дней.

Влияние на фертильность.

Применение кеторолака, как и любого другого лекарственного средства, ингибирующего синтез циклооксигеназы/простагландина, может ослаблять

фертильность и не рекомендуется для применения женщинам, планирующим беременность. Для женщин, которые не могут забеременеть или проходят обследования по поводу фертильности, следует рассмотреть вопрос об отмене кеторолака.

Желудочно-кишечные кровотечения, образование язв и перфорация.

О желудочно-кишечных кровотечениях, образовании язв или перфорации, которые могут быть летальными, сообщалось при применении НПВС, в любое время на протяжении лечения с или без симптомов-предвестников или в случае тяжелых нарушений со стороны пищеварительного тракта в анамнезе. Риск развития тяжелых желудочно-кишечных кровотечений зависит от дозировки лекарственного средства. Это в частности касается пожилых пациентов, которые применяют кеторолак в средней суточной дозе выше 60 мг. Для этих пациентов, а также для пациентов, которые одновременно применяют низкие дозы ацетилсалициловой кислоты или других лекарственных средств, которые могут увеличивать риск для пищеварительного тракта, следует рассмотреть возможность комбинированного лечения с защитными средствами (например мизопростолом или ингибиторами протонной помпы). Кетолонг-Дарница с осторожностью применять пациентам, получающим параллельно медикаментозное лечение, которое может увеличивать риск образования язв или кровотечения, таких как пероральные кортикостероиды, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС) или антитромбоцитарные средства, такие как ацетилсалициловая кислота. В случае возникновения желудочно-кишечного кровотечения или образования язв у пациентов, получающих Кетолонг-Дарница, курс лечения прекращают.

Нарушение дыхательной функции.

Необходима осторожность при применении лекарственного средства пациентам с бронхиальной астмой (или с астмой в анамнезе), поскольку сообщалось, что НПВС у таких пациентов ускоряет возникновение бронхоспазма.

Влияние на почки.

Сообщалось, что ингибиторы биосинтеза простагландинов (включая НПВС) оказывают нефротоксическое действие. С осторожностью назначать пациентам с нарушениями функции почек, сердца, печени, поскольку применение НПВС может приводить к ухудшению функции почек. Пациентам с незначительными нарушениями функции почек назначать меньшие дозы кеторолака (которые не превышают 60 мг в сутки внутримышечно или внутривенно), а также следует тщательно контролировать состояние почек у таких пациентов. Как и для других лекарственных средств, ингибирующих синтез простагландинов, сообщалось о

случаях повышения в сыворотке крови мочевины, креатинина и калия при приеме кеторолака трометамин, которые могут случиться после приема одной дозы.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы, почек и печени.

С осторожностью назначать пациентам с состояниями, которые приводят к уменьшению объема крови и/или почечного потока крови, когда простагландины почек играют поддерживающую роль в обеспечении почечной перфузии. У этих пациентов необходимо контролировать функцию почек. Уменьшение объема следует корректировать и тщательно контролировать содержание в сыворотке крови мочевины и креатинина, а также объем выделяемой мочи, пока у пациента не наступит нормоволемия. У пациентов, находящихся на почечном диализе, клиренс креатинина был уменьшен примерно вдвое по сравнению с нормальной скоростью, а время окончательного полувыведения увеличивалось примерно втрое. У пациентов с нарушением функции печени вследствие цирроза не было каких-либо клинически значимых изменений в клиренсе кеторолака или окончательного периода полувыведения. Возможны предельные повышения значений по данным одного или более функциональных тестов печени. Эти отклонения от нормы могут быть временными, могут оставаться без изменений или могут прогрессировать при продолжении лечения. Если клинические признаки и симптомы указывают на развитие заболевания печени или если наблюдаются системные проявления, Кетолонг-Дарница следует отменить.

С осторожностью назначать Кетолонг-Дарница пациентам с сердечно-сосудистыми нарушениями в анамнезе.

Задержка жидкости и отеки.

Сообщалось о задержке жидкости и отеках при применении кеторолака, поэтому его следует назначать с осторожностью пациентам с сердечной декомпенсацией, артериальной гипертензией или подобными состояниями.

Сердечно-сосудистые и цереброваскулярные эффекты.

Пока нет достаточной информации, чтобы оценить риск для кеторолака трометамин. Пациенты с неконтролируемой артериальной гипертензией, застойной сердечной недостаточностью, диагностированной ишемической болезнью сердца, заболеваниями периферических артерий и/или цереброваскулярными заболеваниями должны находиться под наблюдением врача.

Системная красная волчанка и смешанные заболевания соединительной ткани.

У пациентов с системной красной волчанкой и различными смешанными заболеваниями соединительной ткани повышается риск развития асептического менингита.

Дерматологические эффекты.

Кетолонг-Дарница следует отменить при появлении первых признаков высыпаний на коже, поражения слизистых оболочек или любых других признаках повышенной чувствительности.

Гематологические эффекты.

Пациентам с нарушением свертываемости крови не следует назначать Кетолонг-Дарница. У пациентов, получающих антикоагулянтную терапию, может возникнуть повышенный риск кровотечения, если они одновременно применяют кеторолак. Состояние пациентов, получающих другие лекарственные средства, которые могут влиять на скорость остановки кровотечения, следует тщательно наблюдать при назначении им кеторолака. В контролируемых клинических исследованиях частота случаев значительного послеоперационного кровотечения составляла менее 1%. Кеторолак ингибирует агрегацию тромбоцитов и увеличивает время кровотечения. У пациентов с нормальным временем кровотечения длительность кровотечения увеличивалась, но не выходила за пределы нормы значений в 2-11 минут. В отличие от длительного влияния вследствие применения ацетилсалициловой кислоты, функция тромбоцитов возвращается к норме в течение 24-48 часов после отмены кеторолака. Кеторолак не следует назначать пациентам, перенесшим операцию с высоким риском кровотечения или неполной его остановкой. Следует быть осторожным, если обязательная остановка кровотечения является критической. Кетолонг-Дарница не является средством для анестезии и не имеет седативных или анксиолитических свойств, следовательно, он не рекомендуется как средство премедикации перед операцией для поддержания анестезии.

Гиповолемию следует скорректировать перед тем, как начинать применение кеторолака.

Повышение дозы кеторолака в таблетках выше, чем суточная доза 40 мг, не повышает его эффективность, но увеличивает риск развития побочных реакций.

Кетолонг-Дарница не вызывает зависимости, в случае прекращения приема лекарственного средства не было зафиксировано синдрома отмены.

Это лекарственное средство содержит лактозу моногидрат. Если у Вас установлена непереносимость некоторых сахаров, проконсультируйтесь с

врачом, прежде чем принимать это лекарственное средство.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

У некоторых пациентов при применении кеторолака могут возникать сонливость, головокружение, вертиго, бессонница, повышенная утомляемость, нарушение зрения или депрессия. Если пациенты чувствуют вышеуказанные или другие аналогичные эффекты, им не следует управлять автомобилем или работать с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Данных относительно безопасности применения лекарственного средства в период беременности нет. Учитывая известное влияние НПВП на сердечно-сосудистую систему плода (риск преждевременного закрытия артериального протока), поэтому лекарственное средство противопоказано при беременности, схваток и родов. Начало родов может задерживаться, а продолжительность удлиняться с повышением тенденции к возникновению кровотечения как у матери, так и у ребенка.

Кеторолак проникает в грудное молоко, поэтому лекарственное средство противопоказано в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Таблетки желательно принимать во время или после еды. Лекарственное средство рекомендуется только для кратковременного применения (до 5 суток).

С целью минимизации побочных эффектов лекарственное средство следует применять в наименьшей эффективной дозе в течение кратчайшего периода времени, необходимого для контроля симптомов. Перед началом лечения необходимо достичь нормоволемии.

Кетолонг-Дарница назначать по 10 мг каждые 4-6 часов при необходимости. Не рекомендуется применять лекарственное средство в дозах, превышающих 40 мг в сутки. Опиоидные анальгетики (например морфин, петидин) можно применять параллельно, кеторолак не влияет на связывание опиоидных лекарственных средств и не усиливает депрессию дыхания или седативное действие, оказываемое опиоидами. Для пациентов, получающих парентерально кеторолак и которым назначен кеторолак перорально в форме таблеток, суммарная комбинированная суточная доза не должна превышать 90 мг (60 мг для лиц пожилого возраста, пациентов с нарушением функции почек и пациентов с

массой тела менее 50 кг), а дозировка пероральной формы лекарственного средства не должна превышать 40 мг в сутки, если изменено применение формы выпуска лекарственного средства. Пациентов необходимо переводить на пероральный прием лекарственного средства как можно раньше.

Пациенты пожилого возраста.

Пациенты пожилого возраста имеют больший риск развития тяжелых осложнений, в частности со стороны пищеварительного тракта. Во время лечения с применением НПВС следует регулярно наблюдать за состоянием пациента, обычно рекомендуется больший интервал между применением лекарственного средства, например, 6-8 часов.

Дети

Эффективность и безопасность применения лекарственного средства детям до 16 лет не установлены, поэтому его не следует назначать данной категории пациентов.

Передозировка

Симптомы: головная боль, тошнота, рвота, боль в эпигастрии, желудочно-кишечное кровотечение; редко – диарея, дезориентация, возбуждение, кома, сонливость, головокружение, звон в ушах, потеря сознания, различные судороги. В случаях тяжелого отравления возможны острая почечная недостаточность и поражение печени.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. Необходимо обеспечить достаточный диурез. Следует тщательно контролировать функцию почек и печени. За состоянием пациентов следует наблюдать по крайней мере в течение 4 часов после приема потенциально токсичного количества. Частые или продолжительные судороги следует лечить путем введения диазепама. Другие меры могут быть назначены в зависимости от клинического состояния пациента. Терапия симптоматическая. Диализ не выводит кеторолак с кровообращения.

Побочные реакции

Со стороны желудочно-кишечного тракта: пептическая язва, перфорация или желудочно-кишечное кровотечение, иногда летальное (особенно у людей пожилого возраста), тошнота, диспепсия, желудочно-кишечная боль, чувство дискомфорта в животе, рвота, рвота с примесью крови, гастрит, эзофагит, диарея, запор, отрыжка, метеоризм, чувство переполнения желудка, мелена, ректальное кровотечение, язвенный стоматит, кровоизлияния, перфорация,

панкреатит, обострение колита и болезни Крона, спазм или жжение в эпигастральной области.

Со стороны нервной системы: тревожность, сонливость, головокружение, головная боль, сухость во рту, усиленная жажда, нервозность, парестезия, функциональные нарушения, депрессия, эйфория, судороги, неспособность сконцентрироваться, бессонница, необычные сновидения, недомогание, повышенная утомляемость, возбуждение, вертиго, миалгия, спутанность сознания, галлюцинации, гиперкинезия, асептический менингит с соответствующей симптоматикой, психотические реакции, нарушение мышления.

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: снижение слуха, звон в ушах, возможна потеря слуха.

Со стороны органов зрения: неврит зрительного нерва, нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: повышенная частота мочеиспускания, олигурия, почечная недостаточность (в т.ч. острая), гипонатриемия, гиперкалиемия, гемолитический уремический синдром, боль в боку (с/без гематурии), повышенное содержание мочевины и креатинина в сыворотке крови, интерстициальный нефрит, задержка мочи, нефротический синдром.

Со стороны репродуктивной системы и функции молочных желез: бесплодие.

Со стороны гепатобилиарной системы: нарушение функции печени, гепатит, желтуха и печеночная недостаточность, гепатомегалия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: приливы, брадикардия, бледность, артериальная гипертензия, пальпитация, боль в грудной клетке, возникновение отеков, сердечная недостаточность.

Применение некоторых НПВС, особенно в высоких дозах и продолжительное время, может быть ассоциировано с повышенным риском развития артериальных тромбоэмболических осложнений (инфаркт миокарда или инсульт).

Со стороны респираторной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка, бронхиальная астма, отек легких.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: пурпура, тромбоцитопения, нейтропения, агранулоцитоз, апластическая и гемолитическая анемия, эозинофилия.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: зуд, крапивница, фотосенсибилизация кожи, синдром Лайелла, буллезные реакции, включая синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (очень редко), эксфолиативный дерматит, сыпь (включая макулопапулезную).

Со стороны иммунной системы: сообщалось о развитии реакций гиперчувствительности, включающих неспецифические аллергические реакции и анафилаксию, реактивность дыхательных путей, включая бронхиальную астму, ухудшение течения бронхиальной астмы, бронхоспазм, отек гортани или одышку, а также разные нарушения со стороны кожи, включающие сыпь разных типов, зуд, крапивницу, пурпуру, ангионевротический отек и редко – эксфолиативный и буллезный дерматит (включая эпидермальный некролиз и полиморфную эритему).

Такие реакции могут наблюдаться у пациентов с или без известной гиперчувствительности к кеторолаку или к другим НПВС. Они также могут наблюдаться у лиц, у которых в анамнезе был ангионевротический отек, бронхоспастическая реактивность (например бронхиальная астма и полипы в носу). Анафилактоидные реакции, такие как анафилаксия, могут иметь летальный исход.

Другие: послеоперационное кровотечение из раны, гематома, носовое кровотечение, увеличение продолжительности кровотечения, астения, отеки лица, голеней, пальцев, ступней, отек языка, нарушение вкуса, увеличение массы тела, повышенное потоотделение, повышенная температура тела.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке, по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).