

РОЗАКЕТ

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Розакет.

Международное непатентованное название: Кеторолак.

Лекарственная форма: таблетки диспергируемые.

Состав: каждая диспергируемая таблетка содержит:

Кеторолака трометамин USP 10 мг.

Фармакотерапевтическая группа: Нестероидное противовоспалительное средство - производное пирролизинкарбоксилевой кислоты.

Код АТХ: M01AB15.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика:

Кеторолак оказывает выраженное анальгетическое действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности фермента циклооксигеназы 1 и 2, главным образом, в периферических тканях, следствием чего являются торможение биосинтаза простагландинов – модуляторов болевой чувствительности, терморегуляции и воспаления. Кеторолак представляет собой рацемическую смесь [-]S и [+]-R энантиомеров, при этом обезболивающее действие обусловлено [-]S формой.

Препарат не влияет на опиоидные рецепторы, не угнетает дыхания, не вызывает лекарственной зависимости, не обладает седативным и анксиолитическим действием.

По силе анальгезирующего эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВП. После приема внутрь начало обезболивающего действия отмечается соответственно через 0,5 и 1 ч, максимальный эффект достигается через 1-2 ч.

Фармакокинетика:

После приема внутрь кеторолак хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте – максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови (0,7-1,1 мг/мл) достигается через 40 мин после приема натошак дозы 10 мг. Богатая жирами пища снижает максимальную концентрацию препарата в крови и задерживает ее достижение на 1 час.

99% препарата связывается с белками плазмы крови, и при гипоальбуминемии количество свободного вещества в крови увеличивается. Биодоступность – 80-100%. Время достижения равновесной концентрации (C_{ss}) при пероральном введении – 24 ч при назначении 4 раза в сутки и составляет 10 мг – 0,39 -0,79 мкг/мл. Объем распределения составляет 0,15-0,33 л/кг. У пациентов с почечной недостаточностью объем распределения препарата может увеличиваться в 2 раза, а объем распределения его R-энантиомера – на 20%.

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

Более 50% введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды, которые выводятся почками, и р-гидроксикеторолак. Выводится на 91% почками, 6% – через кишечник.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) у пациентов с нормальной функцией почек составляет в среднем 5,3 ч (2,4 -9 ч после приема внутрь 10 мг). $T_{1/2}$ удлиняется 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 крови 19-50 мг/л (168-442 мкмоль/л) $T_{1/2}$ составляет 10,3 – 10,8 ч, при

более выраженной почечной недостаточности – более 13,6 ч.

Общий клиренс составляет при приеме 10 мг – 0,025 л/кг/ч; при почечной недостаточности с концентрацией креатинина в плазме крови 19-50 мг/л при приеме внутрь 10 мг – 0,016 л/кг/ч. Не выводится в ходе гемодиализа.

Показания к применению:

Купирование умеренного и сильного болевого синдрома:

- в послеоперационном периоде (после общехирургических, гинекологических, ортопедических, урологических, стоматологических, отоларингологических оперативных вмешательств);
 - при травмах мышц, костей и мягких тканей (в т.ч. растяжениях, вывихах, переломах).
- Непродолжительное обезболивание при различных состояниях, включая:
- болевой синдром отмены опиоидных анальгетиков;
 - зубная боль (перикоронит, пульпит, кариес);
 - почечная или желчная колика (в комбинации со спазмолитиками);
 - отит;
 - фибромиалгия;
 - остеоартриты, остеоартроз;
 - боль при онкологических заболеваниях;
 - ишиалгия;
 - корешковый синдром;
 - остеохондроз.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к кеторолаку или другим нестероидным противовоспалительным средствам, «аспириновая» астма, бронхоспазм, ангионевротический отек, гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины), дегидратация;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в стадии обострения, пептические язвы, гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);
- печеночная и/или почечная недостаточность (креатинин плазмы выше 50 мг/л);
- геморрагический инсульт (подтвержденный или подозреваемый), геморрагический диатез, одновременный прием с другими НПВП, высокий риск развития или рецидива кровотечения (в том числе после операций), нарушение кровотока;
- беременность, роды и период лактации;
- детский возраст до 16 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- препарат не применяют для обезболивания перед и во время хирургических операций из-за высокого риска кровотечения, а также для лечения хронических болей.

С осторожностью – бронхиальная астма; холецистит; хроническая сердечная недостаточность; артериальная гипертензия; нарушение функции почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); холестаз; активный гепатит; сепсис; системная красная волчанка; пожилой возраст (старше 65 лет); полипы слизистой оболочки носа и носоглотки.

Способ применения и дозы:

Внутри. Препарат в форме диспергируемых таблеток следует принимать в конце или после приема пищи.

Принимать однократно или повторно в зависимости от тяжести болевого синдрома. Однократная доза – 10 мг, при повторном приеме рекомендуется принимать по 10 мг до 4-х раз в сутки в зависимости от выраженности боли; максимальная суточная доза не должна превышать 40 мг.

При приеме внутрь продолжительность курса не должна превышать 5 дней.

При переходе с парентерального введения препарата на его прием внутрь суммарная суточная

доза обеих лекарственных форм в день перевода не должна превышать 90 мг для пациентов до 65 лет и 60 мг – для пациентов старше 65 лет или с нарушенной функцией почек. При этом доза препарата в таблетках в день перехода не должна превышать 30 мг.

Перед приемом 1 таблетку растворяют в 5 мл (1 чайная ложка) воды.

Побочные действия:

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

Со стороны пищеварительной системы: часто (особенно у пожилых пациентов старше 65 лет, имеющих в анамнезе эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта) – гастралгия, диарея; менее часто – стоматит, метеоризм, запор, рвота, ощущение переполнения желудка; редко – тошнота, эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в т.ч. с перфорацией и/или кровотечением – абдоминальная боль, спазм или жжение в эпигастриальной области, мелена, рвота 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 с или без гематурии и/или азотемии, гемолитический уремический 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 т.ч. нечеткость зрительного восприятия).

Со стороны дыхательной системы: редко – бронхоспазм или диспноэ, ринит, 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 АД; редко – отек легких, 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 или повторном применении обычно проявляется болями в области живота, тошнотой, рвотой, возникновением пептических язв желудка или эрозивного гастрита, нарушением функции почек, гипервентиляцией.

Лечение: рекомендуется промывание желудка, введение адсорбентов (активированный уголь) и проведение симптоматической терапии. Препарат не выводится в достаточной степени с помощью диализа.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение кеторолака с ацетилсалициловой кислотой или другими нестероидными противовоспалительными препаратами, препаратами кальция, глюкокортикостеро-

идами, этанолом, кортикотропином может привести к образованию язв желудочно-кишечного тракта и развитию желудочно-кишечных крово-течений. Совместное назначение с парацетамолом повышает нефротоксичность, с метотрексатом – гепато- и нефротоксичность. Совместное назначение кеторолака и метотрексата возможно только при использовании низких доз последнего (контролировать концентрацию метотрексата в плазме крови).

Пробеницид уменьшает плазменный клиренс и объем распределения кеторолака, повышает его концентрацию в плазме крови и увеличивает период его полувыведения. На фоне применения кеторолака возможно уменьшение клиренса метотрексата и лития и усиление токсичности этих веществ. Одновременное назначение с непрямыми антикоагулянтами, гепарином, тромболитиками, антиагрегантами, цефоперазоном, цефотетаном и пентоксифиллином повышает риск возникновения кровотечения. Снижает эффект гипотензивных и диуретических препаратов (понижается синтез простагландинов в почках). При комбинировании с опиоидными анальгетиками дозы последних могут быть существенно снижены.

Антагонисты средств не влияют на полноту всасывания лекарства.

Повышается гипогликемическое действие инсулина и пероральных гипогликемических препаратов (необходим перерасчет дозы). Совместное назначение с вальпроатом натрия вызывает нарушение агрегации тромбоцитов. Повышает концентрацию в плазме крови верапамила и нифедипина.

При назначении с другими нефротоксическими лекарственными средствами (в т.ч. с препаратами золота) повышается риск развития нефротоксичности. Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, снижают клиренс кеторолака и повышают его концентрацию в плазме крови.

Особые указания:

Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 часов. Гиповолемия повышает риск развития побочных реакций со стороны почек. При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками. Розакет не рекомендуется применять в качестве средства для премедикации, поддерживающей анестезии и обезболивания в акушерской практике. Не использовать одновременно с парацетамолом более 5 дней.

Пациентам с нарушением свертывания крови назначают препарат только при постоянном контроле числа тромбоцитов, что особенно важно в послеоперационном периоде, когда требуется тщательный контроль гемостаза. Поскольку у значительной части пациентов при назначении препарата Розакет развиваются побочные эффекты со стороны центральной нервной системы (сонливость, головокружение, головная боль), рекомендуется избегать выполнения работ, требующих повышенного внимания и быстрой реакции (вождение автотранспорта, работа с механизмами и пр.).

Форма выпуска:

10 диспергируемых таблеток в каждом блистере. 10 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C и в местах недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.

Произведено для:
Vegapharm LLP
Лондон, Великобритания
Производитель:
Юнимакс Лабораторис
Индия



Vegapharm