

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

кеторолак (триметаминовая соль (\pm)-5-бензоил-2,3-дигидро-1 Н-пирролизин-1-карбоновой кислоты) — обезболивающее, противовоспалительное, жаропонижающее средство. Механизм действия кеторолака обусловлен торможением биосинтеза простагландинов путем угнетения ЦОГ-1, а также уменьшением образования других медиаторов боли и воспаления. Не влияет на опиоидные рецепторы, не вызывает угнетения дыхательного центра, не оказывает седативного и анксиолитического действия. Препарат не вызывает медикаментозной зависимости и симптомов отмены. Тормозит агрегацию тромбоцитов и может увеличивать время кровотечения.

При приеме внутрь кеторолак быстро и полностью адсорбируется, связываясь с белками плазмы крови более чем на 99%. Максимальная концентрация в крови достигается через 40–50 мин после приема. Одновременный прием с пищей уменьшает скорость, но не влияет на степень всасывания кеторолака. Обезболивающий эффект развивается через 30–40 мин и продолжается до 4–6 ч после перорального приема препарата .

Обезболивающее действие после в/в и в/м введения наступает примерно через 30 мин, максимальный эффект развивается через 1–2 ч, продолжительность действия составляет 4–6 ч. После в/м введения максимальная концентрация кеторолака в крови достигается через 40–50 мин.

Связывание с белками плазмы крови составляет более 99%. Кеторолак метаболизируется в организме в основном путем конъюгирования с глюкуроновой кислотой. Выведение кеторолака осуществляется почками (до 90%), в том числе в неизменной форме (~58%), в форме практически неактивного метаболита *p*-гидроксикеторолака (~11%) и других метаболитов, возможно, конъюгатов (~31%). Период полувыведения составляет 4–6 ч. У пациентов пожилого возраста (старше 65 лет), а также при почечной недостаточности плазменный клиренс кеторолака уменьшается, а период полувыведения увеличивается. Препарат не кумулирует в организме.

ПОКАЗАНИЯ

купирование острой боли средней и сильной интенсивности (преимущественно в послеоперационный период и после травм).

ПРИМЕНЕНИЕ

Таблетки

Режим дозирования устанавливают индивидуально с учетом интенсивности болевого синдрома. Взрослым обычно назначают по 1 таблетке (10 мг) каждые 4–6 ч, при выраженном болевом синдроме разовую дозу можно повысить до 20 мг. Максимальная суточная доза — 90 мг. Курс лечения — не более 5 дней.

Пациентам в возрасте старше 65 лет или с массой тела менее 50 кг, а также больным с нарушением функции почек препарат назначают в более низких дозах, максимальная суточная доза составляет 60 мг.

Р-р для инъекций

Препарат предназначен для кратковременного применения. Препарат вводят в/в струйно или в/м медленно, глубоко в ягодичную мышцу. Режим дозирования устанавливают индивидуально с учетом выраженности болевого синдрома.

Взрослым в возрасте до 65 лет в/м вводят 10–30 мг (0,3–1 мл), затем — по 10–30 мг каждые 4–6 ч. При в/в струйном введении (в течение не менее 15 с) начальная доза составляет 10–30 мг, затем по необходимости — по 10–30 мг каждые 6 ч.

Высшая разовая доза: при в/в введении — 30 мг, при однократном в/м введении — 60 мг, при многократном в/м введении — 30 мг.

Высшая суточная доза при любом пути введения не должна превышать 90 мг. Максимальная продолжительность терапии — 5 дней.

Больным в возрасте старше 65 лет или пациентам с нарушением функции почек (уровень креатинина в сыворотке крови — 170–442 мкмоль/л) в/м или в/в струйно вводят по 10–15 мг (0,3–0,5 мл), при необходимости инъекции повторяют каждые 4–6 ч. Высшая суточная доза при обоих путях введения у этих больных не должна превышать 60 мг.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, нарушение функции почек (уровень креатинина в сыворотке крови выше 442 мкмоль/л), гиповолемия, дегидратация, БА, бронхоспазм, нарушения свертывания крови, высокий риск развития послеоперационного кровотечения, возможность или наличие желудочно-кишечных и/или черепно-мозговых кровотечений и нарушений гемостаза, период беременности и кормления грудью, возраст младше 16 лет, повышенная индивидуальная чувствительность к кеторолаку и другим НПВП.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

Со стороны пищеварительного тракта: диспепсия, тошнота, боль в эпигастральной области, в единичных случаях — метеоризм, отрыжка, рвота, запор, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, нарушение функции печени.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, сонливость, бессонница, депрессия, нервозность, нарушение сна, возбуждение, нарушение концентрации внимания, сухость во рту.

Со стороны мочевыделительной системы: учащение мочеиспускания, олигурия, гематурия, описаны случаи ОПН, нефротический синдром, гломерулонефрит.

Со стороны системы свертывания крови: образование гематом, послеоперационные кровотечения, носовые кровотечения, увеличение времени кровотечения.

Аллергические реакции: кожный зуд, крапивница, отек гортани, бронхоспазм.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

необходимо соблюдать осторожность при назначении препарата больным в возрасте старше 65 лет, пациентам с нарушениями функции печени и почек, хронической сердечной недостаточностью, АГ, БА и бронхообструктивным синдромом, а также во время деятельности, требующей повышенного внимания и скорости психомоторных реакций.

При необходимости препарат можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками, при этом их доза может быть снижена. Не рекомендуется применять для премедикации, поддерживающей анестезии и для обезболивания в акушерской практике. Препарат не показан для лечения при хроническом болевом синдроме.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

сочетанное применение с пентоксифиллином, антикоагулянтами и препаратами декстрана повышает риск развития кровотечений. Одновременное применение с ингибиторами АПФ может повысить риск развития нарушений функции почек (особенно у больных с гиповолемией). Повышает токсичность метотрексата, циклоспорина, гастротоксичность НПВП и ГКС.

При сочетанном применении с солями лития возможно уменьшение экскреции лития с мочой и повышение его концентрации в плазме крови. Пробенецид повышает концентрацию кеторолака в плазме крови и удлиняет период его полувыведения.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

при передозировке возможны боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенные повреждения желудка, гипервентиляция, нарушения функции почек.

Лечение: отмена препарата, промывание желудка (при передозировке таблеток), симптоматическая терапия.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

в сухом, защищенном от света месте при температуре 15–25 °С.