

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КЕТОЛОНГ-ДАРНИЦЯ®
(KETOLONG-DARNITSA)

Склад:

Діюча речовина: ketorolac; 1 таблетка містить кеторолаку (у вигляді кеторолаку трометаміну) 10 мг;
допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.
Код АТС. M01A B15.

Клінічні характеристики.

Показання.

Гострий больовий синдром високої і середньої інтенсивності: при травмах, зубний біль, болі в післяродовому та післяопераційному періоді, при онкологічних захворюваннях, міалгії, артралгії, невралгії, радикуліті, вивихах, розтягненнях, ревматичних захворюваннях.

Протипоказання.

Гіперчутливість до компонентів препарату. Непереносимість ацетилсаліцилової кислоти та лікарських засобів, похідних піразолону. Гіповолемія (незалежно від причини, що її викликала). Ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту у стадії загострення. Гіпокоагуляція (зокрема гемофілія). Внутрішні та зовнішні кровотечі або високий ризик їх розвитку. Тяжка ниркова недостатність (креатинін плазми вище 50 мг/л). Печінкова недостатність.

Спосіб застосування та дози.

Пацієнтам віком від 16 до 65 років з масою тіла менше 50 кг або пацієнтам з нирковою недостатністю – 10 мг в перший прийом, а далі по 10 мг до 4 разів на добу.

Пацієнтам від 16 до 65 років з масою тіла, що перевищує 50 кг, рекомендована доза складає 20 мг в перший прийом, далі по 10 мг до 3 разів на добу, але не більше 40 мг/добу.

Максимальна добова доза при пероральному застосуванні складає 40 мг. Можливий курс застосування препарату до 5 днів.

Побічні реакції.

З боку травної системи: гастралгія, діарея (частота виникнення більше 3 %); стоматит, метеоризм, запор, блювання, відчуття переповнювання шлунку (частота виникнення до 3 %); зниження апетиту, нудота, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту з перфорацією і/або кровотечею, біль в животі, спазм або печіння в епігастральній ділянці, кров у калі або мелена, блювання з кров'ю або за типом "кавової гущі", нудота, печія, холестатична жовтяниця, гепатит, гепатомегалія, гострий панкреатит (частота виникнення до 1 %).

З боку сечовивідної системи: гостра ниркова недостатність, біль у попереку, гематурія, азотемія, гемолітикоуремічний синдром (гемолітична анемія, ниркова недостатність, тромбоцитопенія, пурпура), почастішання сечовипускання, підвищення або зниження об'єму сечі, нефрит, набряки ниркового генезу (частота виникнення менше 1 %).

З боку ЦНС: головний біль, запаморочення, сонливість, рідко – асептичний менінгіт (гарячка, сильний головний біль, судоми, ригідність м'язів ший і/або спини), гіперактивність (зміна настрою, неспокій), галюцинації, депресія, психоз, непритомні стани (частота виникнення більше 3 %).

З боку ССС: підвищення артеріального тиску (частота виникнення до 3 %).

З боку органів кровотворення: анемія, лейкопенія, еозинофілія (частота виникнення до 1 %).

З боку шкірних покривів: шкірні висипання (включаючи макуло-папульозний висип), пурпура (частота виникнення від 1 до 3 %); ексфоліативний дерматит (гарячка з ознобом або без, гіперемія, ущільнення або лущення шкіри, збільшення і/або хворобливість піднебінних мигдалин), кропив'янка, злаякісна ексудативна еритема (синдром Стівенса-Джонсона), токсичний епідермальний некроліз синдром Лайелла (частота виникнення до 1 %).

З боку органів чуття: зниження слуху, дзвін у вухах, порушення зору, нечіткість зорового сприйняття (частота виникнення до 1 %).

З боку системи гемостаза: кровотеча з післяопераційної рани, носова кровотеча, ректальна кровотеча (частота виникнення до 1 %).

Алергічні реакції: анафілаксія або анафілактоїдні реакції (зміна кольору шкіри обличчя, шкірні висипання, кропив'янка, свербіж шкіри, тахіпноє або диспноє, набряки вік, періорбітальний набряк, задишка, утруднене дихання, тяжкість в грудній клітці, дихання зі свистом (частота виникнення до 1 %).

Інші: набряки обличчя, гомілок, пальців, ступенів, набряк язика, підвищення маси тіла (частота виникнення до 3 %); підвищене потовиділення, гарячка (частота виникнення до 1 %).

Передозування. *Симптоми:* біль у животі, нудота, блювання, ерозивно–виразкові ураження шлунково–кишкового тракту, порушення функції нирок, метаболічний ацидоз.

Лікування: симптоматичне (підтримка життєво важливих функцій організму). Діаліз – малоефективний.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат протипоказаний вагітним (можливе передчасне закриття Боталової протоки) та жінкам в період годування груддю.

Діти. Ефективність і безпека препарату у дітей не встановлена. Препарат протипоказаний дітям до 16-річного віку.

Особливості застосування.

Перед призначенням препарату необхідно з'ясувати питання про попередню алергію на препарат або інші нестероїдні протизапальні засоби.

З обережністю препарат призначають хворим на бронхіальну астму, наявність чинників, що підвищують шлунково–кишкову токсичність: алкоголізм, тютюнопаління і холецистит. Особливу увагу при призначенні препарату приділяють хворим в післяопераційному періоді, з хронічною серцевою недостатністю, набряковим синдромом, артеріальною гіпертензією, порушенням функції нирок (креатинін плазми вище 50 мг/л), холестазом, активним гепатитом, сепсисом, системним червоним вовчаком, що одночасно приймають нестероїдні протизапальні засоби, особам літнього віку.

Гіповолемія підвищує ризик розвитку нефротоксичних побічних реакцій.

Не рекомендується застосовувати як лікарський засіб для премедикації, підтримки анестезії.

При сумісному прийомі з іншими нестероїдними протизапальними засобами можуть спостерігатися затримка рідини, декомпенсація серцевої діяльності, підвищення артеріального тиску. Вплив на агрегацію тромбоцитів припиняється через 24–48 год. Не використовувати одночасно з парацетамолом більше 5 діб.

Хворим з порушенням згортання крові призначають тільки при постійному контролі кількості тромбоцитів, особливо важливо для післяопераційних хворих, що вимагають ретельного контролю гемостаза.

Ризик розвитку лікарських ускладнень зростає при продовженні лікування (у хворих з хронічними болями) і підвищенні пероральної дози препарату більше 40 мг/добу.

Для зниження ризику розвитку гастропатії, викликаної кеторолаком, призначаються антацидні лікарські засоби, мізопростол, омепразол.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

У період лікування необхідно дотримуватись обережності при керуванні автотранспортом і заняттях іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші форми взаємодій.

Сумісне призначення з парацетамолом підвищує нефротоксичність кеторолаку.

При необхідності можна призначати в комбінації з наркотичними анальгетиками, що призводить до посилення анальгетичного ефекту та зниження дози препарату.

Одночасний прийом з іншими нестероїдними лікарськими засобами, глюкокортикостероїдами, етанолом, кортикотропіном, препаратами Ca^{2+} збільшує ризик виразки слизової оболонки шлунково-кишкового тракту та розвитку шлунково-кишкових кровотеч.

Одночасне призначення з антикоагулянтними лікарськими засобами – похідними кумарину та індандіону, гепарином, тромболітиками (алтеплаза, стрептокіназа, урокіназа), антиагрегантними лікарськими засобами, цефалоспоринами, вальпроєвою кислотою та ацетилсаліциловою кислотою підвищує ризик розвитку кровотеч.

Знижує ефект гіпотензивних та діуретичних лікарських засобів, за рахунок зниження синтезу простагландинів в нирках.

Сумісне призначення з метотрексатом підвищує гепато- та нефротоксичність (сумісне їх призначення можливе тільки при використанні низьких доз останнього і контролі його концентрації в плазмі).

При призначенні з іншими нефротоксичними лікарськими засобами і препаратами золота підвищується ризик розвитку нефротоксичності.

Лікарські засоби, блокуючі каналцеву секрецію, знижують кліренс кеторолаку і підвищують його концентрацію в плазмі.

Підвищує ефективність наркотичних анальгетиків.

Мієлотоксичні лікарські засоби підсилюють прояви гематотоксичності препарату.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Кетолонг-Дарниця – нестероїдний протизапальний засіб на основі кеторолаку трометаприму. Має виражену анальгезуючу активність, що значно перевершує інші нестероїдні протизапальні засоби, порівняльною з анальгезуючою активністю морфіну. Жарознижуюча та протизапальна дія виражена значно слабше. Механізм дії пов'язаний з неселективною блокадою ЦОГ-1 та ЦОГ-2, що каталізують утворення простагландинів з арахідонової кислоти, є головними чинниками розвитку болю. Препарат повністю купує біль низької та середньої інтенсивності, а біль високої інтенсивності переводить в низький.

Дія препарату починається через одну годину, досягає максимуму через 2–3 години і продовжується від 8 до 12 годин.

Фармакокінетика. Швидко всмоктується з шлунково-кишкового тракту. Біодоступність – 80–100 %.

Час досягнення максимальної концентрації (T_{Cmax}) – 10-78 хв. Максимальна концентрація в крові (C_{max}) після перорального прийому 10 мг – 0,82-1,46 мкг/мл. Зв'язок з білками плазми – 99 %.

Час досягнення C_{ss} після перорального прийому 10 мг – 0,39–0,79 мкг/мл – 24 год при призначенні 4 рази на добу

Об'єм розподілу – 0,15–0,33 л/кг. У хворих з нирковою недостатністю об'єм розподілу препарату може збільшуватися в 2 рази, а об'єм розподілу його R-енантіомера – на 20 %.

Проникає в грудне молоко: при прийомі матір'ю 10 мг кеторолаку (C_{max}) в молоці досягається через 2 год після прийому першої дози і складає 7,3 нг/мл, через 2 год після застосування наступної дози кеторолаку (при використанні препарату 4 рази на добу) – 7,9 нг/л. Больше 50 % прийнятої дози метаболізується в печінці з утворенням фармакологічно неактивних метаболітів. Головними метаболітами є глюкуроніди, які виводяться нирками, і р-гідрокскеторолак. Виводиться на 91 %

нирками, 6 % – через кишечник.

Період напіввиведення ($T_{1/2}$) у пацієнтів з нормальною функцією нирок – в середньому 2,4–9 год після перорального прийому 10 мг. $T_{1/2}$ зростає у немолодих пацієнтів і зменшується у молодих. Функція печінки не спричиняє впливу на $T_{1/2}$. У пацієнтів з порушенням функції нирок при концентрації креатиніну в плазмі 19–50 мг/л (168 – 442 мкмоль/л) $T_{1/2}$ – 10,3–10,8 год, при більш вираженій нирковій недостатності – більше 13,6 год.

Загальний кліренс складає при пероральному прийомі 10 мг – 0,025 л/год на кг маси тіла; у пацієнтів з нирковою недостатністю при концентрації креатиніну в плазмі 19–50 мг/л – 0,016 л/год на кг маси тіла.

Не виводиться шляхом гемодіалізу.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі таблетки білого кольору зі слабким жовтуватим відтінком плоско циліндричної форми, з фаскою.

Несумісність. Препарат небажано змішувати з іншими лікарськими засобами.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці, в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці, по 1 контурній чарунковій упаковці у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ЗАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження. Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.