

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ЕМОДОЛ
EMODOL

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: кеторолак; (\pm)-5-бензоїл-2,3-дигідро-1H-піролізин-1-карбонова кислота, з'єднана з 2-аміно-2-гідроксиметил-1,3-пропан-діолом (1:1);

основні фізико-хімічні властивості: білі, круглі, опуклі таблетки, вкриті оболонкою;

склад: 1 таблетка містить кеторолаку трометаміну 10 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, лактоза, крохмаль кукурудзяний, повідон, титану діоксид, тальк очищений, гідроксипропілметилцелюлоза, магнію стеарат, опадри білий, віск карнаубський.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Кеторолак має виражену анагетичну, протизапальну та помірну жарознижувальну дію. Механізм дію пов'язаний з неселективним пригніченням активності ферменту ЦОГ-1 та ЦОГ-2, головним чином в периферичних тканинах, наслідком цього є гальмування біосинтезу простагландинів - модуляторів больової чутливості, терморегуляції та запалення. Кеторолак - рацемічна суміш -S та +R. енантіомерів, при цьому анагезуюча дія зумовлена -S енантіомером.

Як і інші нестероїдні протизапальні лікарські засоби (НПЗП), кеторолак пригнічує агрегацію тромбоцитів, спричинену арахідоною кислотою і колагеном, але не впливає на АТФ-індуковану агрегацію. Кеторолак збільшує середній період кровотечі, не впливаючи на кількість тромбоцитів, протромбіновий час або активований частковий тромбoplastиновий час. На відміну від наркотичних анагетиків, кеторолак не пригнічує дихальний центр і на відміну від морфіну не спричиняє зростання рСО₂. Кеторолак не впливає на показники стану серцевого м'язу і не спричиняє гемодинамічних порушень, не впливає на психомоторні функції, на відміну від інших анагетиків центральної дії — морфіну, петидину і бупренорфіну.

Ефективність кеторолаку як при внутрішньом'язовому, так і пероральному застосуванні була доведена при різних больових синдромах: післяопераційний біль, кістково-м'язовий біль, зубний біль, біль при онкологічних захворюваннях.

Фармакокінетика.

Після перорального прийому Кеторолак повністю і швидко всмоктується. Максимальна концентрація в плазмі досягається через 30-40 хв після прийому. Прийом їжі практично не впливає на всмоктування препарату. Їжа та антациди зменшують швидкість, але не ступінь всмоктування кеторолаку. Після перорального застосування препарату у дозі 10 мг максимальна концентрація у плазмі дорівнює 0,87 мг/л. Після призначення препарату в терапевтичних дозах концентрація у плазмі збільшується у лінійній залежності, тобто подвоєння дози спричиняє подвоєння концентрації. Кумуляція препарату не настає навіть при багаторазовому застосуванні. Зв'язування кеторолаку з білками плазми становить 99%. Кеторолак накопичується у вогнищі запалення. У дослідженнях на здорових добровольцях його концентрація в усіх тканинах, крім нирок, була значно нижча, ніж у плазмі. Біодоступність кеторолаку дуже висока (80-100%),

оскільки він не піддається метаболізму першого проходження. Кеторолак не метаболізується значною мірою у печінці, основні метаболічні зміни препарату відбуваються у нирках з утворенням неактивного глюкуроніду. Таким чином, половина дози виводиться з сечею у незміненому вигляді, а інша половина - у вигляді метаболітів. Період напіввиведення кеторолаку

- 4-6 год, він збільшується у хворих з нирковою недостатністю. Значний період напіввиведення кеторолаку забезпечує тривалість дії не менше 6 год., а іноді 8-12 год.

У хворих з нирковою недостатністю виведення кеторолаку повільне, про що свідчить зниження загального кліренсу плазми, а термін напіввиведення збільшується (з 9,62 до 9,91 год), що вказує на необхідність корекції дози. За даними досліджень, кеторолак надходить із материнського кровообігу в кровообіг плоду (співвідношення 0,116), також виділяється з молоком матері (співвідношення до концентрації в плазмі 0,015:0,037).

Показання для застосування. Для короткочасного застосування з метою знеболювання при помірному та сильному болю, такому як:

- післяопераційний біль після порожнинних, гінекологічних, ортопедичних операцій;
- гострий больовий синдром при розтягненнях, вивихах, переломах та ушкодженнях м'яких тканин (фіброміалгія, несуглобовий больовий синдром при хронічній патології м'яких тканин), остеоартрози, ішіалгії;
- зубний біль, у тому числі після стоматологічних втручань;
- біль при онкологічних захворюваннях.

Спосіб застосування та дози. Режим дозування встановлюють індивідуально з урахуванням інтенсивності больового синдрому. Дорослим і дітям віком старше 16 років, звичайно, призначають по 1 таблетці (10 мг) кожні 4 - 6 год, при вираженому больовому синдромі разову дозу можна збільшити до 20 мг. Максимальна добова доза - 90 мг. Курс лікування повинен становити не більше 5 днів. Пацієнтам віком старше 65 років або з масою тіла менше 50 кг, а також хворим з порушенням функції нирок препарат призначають у нижчих дозах, максимальна добова доза - 60 мг.

Протипоказання. Гіперчутливість до кеторолаку або інших нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП), алергічні реакції на ацетилсаліцилову кислоту чи інгібітори синтезу простагландинів, синдром назального поліпозу (повний або частковий), ангіоневротичний набряк, бронхоспазм на ацетилсаліцилову кислоту або інші НПЗП, бронхіальна астма. Стан дегідратації і гіповолемії будь-якого походження. Наявність пептичних виразок, порушень згортання крові в анамнезі, хворі з підозрою чи явною шлунково-кишковою кровотечею, церебро-васкулярними порушеннями. Стан ниркової недостатності середнього чи тяжкого ступеня. Періоди вагітності, пологів, лактації. Дитячий вік до 16 років. Хворі з геморагічним діатезом, у післяопераційний період при високому ризику чи наявності порушеного гемостазу, на тлі відповідної антикоагулянтної терапії.

Побічна дія. Нудота, блювання, диспепсія, абдомінальний біль, сонливість, пітливість, набряки, порушення концентрації уваги, депресія, ейфорія, еозинофілія, зміни смаку і зору, бронхоспазм, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, кровотеча, перфорація виразки, нефротичний синдром, алергічні й токсико-алергічні реакції (кропив'янка, синдром Стівенса-Джонсона, пухирчатка), диспное, олігурія, дизурія, діарея. Головний біль, запаморочення, тривожність, сухість у роті, сильна спрага, астеничний синдром, міалгія, підвищення активності печінкових трансаміназ.

Передозування.

Симптоми: біль у ділянці живота, нудота, блювання, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, порушення функції нирок, прискорення дихання.

Лікування: рекомендовано промивання шлунка з подальшим призначенням активованого вугілля або інших адсорбентів. Рекомендовано симптоматичну терапію. У разі ниркової недостатності можливе призначення діалізу, хоча при діалізі кеторолак видаляється з плазми незначною мірою.

Особливості застосування. ЕМОДОЛ показаний для короткочасного застосування. В осіб похилого віку елімінація кеторолаку уповільнена, тому препарат призначають під наглядом лікаря та в менших дозах. У хворих з серцевою недостатністю, артеріальною гіпертензією, препарат необхідно

застосовувати з обережністю. Також необхідне спостереження за хворими з порушеннями згортання крові. Кеторолак не є агоністом або антагоністом наркотиків, оскільки не має центральної опіатопоподібної дії.

Серед побічних реакцій при призначенні Кеторолаку слід зазначити пригнічення агрегації тромбоцитів (до 2-х діб після відміни препарату), яке спричиняє порушення механізмів тромбоцитарного гемостазу, що підвищує ризик виникнення спонтанних кровотеч, особливо при одночасному застосуванні з будь-якими антиагрегантами у хворих з ішемічною хворобою серця. У період лікування необхідно утримуватися від занять потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При комбінованому призначенні пробенециду та ЕМОДОЛУ спостерігається збільшення концентрації кеторолаку в плазмі крові та подовження періоду напіввиведення його з організму. При комбінованому призначенні метотрексату та ЕМОДОЛУ слід зазначити, що нестероїдні протизапальні препарати зменшують кліренс метотрексату і тим самим збільшують його токсичність.

ЕМОДОЛ не впливає на здатність дигоксину зв'язуватись з білками плазми. При комбінованому прийомі ЕМОДОЛУ і саліцилатів (при концентрації їх у плазмі 300 мкг/мл) зв'язування ЕМОДОЛУ з білками плазми зменшується з 99% до 97%.

Клінічні випробування не виявили істотних взаємодій ЕМОДОЛУ і варфарину або гепарину, але призначення кеторолаку та препаратів, які впливають на гемостаз, у тому числі антикоагулянтів та декстринів, може збільшити ризик виникнення кровотечі.

Варфарин, парацетамол, фенітоїн, ібупрофен, напроксен, піроксикам не впливають на зв'язування кеторолаку з білками плазми.

ЕМОДОЛ знижує діуретичний ефект фуросеміду у хворих з нормоволемією. При одночасному застосуванні з інгібіторами АПФ зростає ймовірність порушення функції нирок.

Умови зберігання. Зберігати у сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі 15° - 25 °С. Термін придатності - 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 20 або 50 таблеток у блістерах.

Виробник. Джейсон Фармасьютикалс Лтд.

Адреса. 28 Пурана Палтан, Дакка -1000, Бангладеш.