

РОЗАКЕТ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Торговое название

Розакет

Международное непатентованное наименование

Кеторолак

Лекарственные формы

Диспергируемые таблетки

Состав

Каждая диспергируемая таблетка содержит

Активное вещество:

Кеторолака трометамин USP 10 мг

Вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза (PH-112), лактоза моногидрат, диоксид кремния коллоидный безводный, кроскармеллоза натрия, натрия крахмал гликолят (Тип-А), кукурузный крахмал, краситель хинолиновый желтый, аспартам, очищенный тальк, магния стеарат, ароматизатор фруктовая смесь.

Описание

Непокрытые диспергируемые таблетки светло-желтого цвета, круглые, плоские, с риской на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные и противоревматические препараты. Производные уксусной кислоты и родственные соединения.

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 является торможение биосинтеза простагландинов - модуляторов болевой чувствительности, терморегуляции и воспаления. Кеторолак представляет собой рацемическую смесь [-]S и [+]R энантиомеров, при этом обезболяющее 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 (С_{max}) в плазме крови (0,7-1,1 мкг/мл) достигается через 40 мин после приема натощак 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 С_{max} в молоко 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 r-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 внутрь 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

Болевой синдром умеренной и сильной выраженности, в т.ч. в послеоперационном периоде (после полостных, гинекологических, ортопедических, урологических и др. операций), болевой синдром при травмах (вывих, перелом, разрывы и растяжения связок), болевой синдром при остеоартрозе, остеохондрозе, ревматических заболеваниях, миалгии, артралгии, радикулите, невралгии, боль при онкологических заболеваниях, зубная боль, боль после стоматологических вмешательств, при перикороните, пульпите, боль в спине и мышцах.

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 кроветворения.

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; холестазит; 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

В виде таблеток Розакет применяют внутрь 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.

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.), холестагическая 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 - экфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Местные реакции: менее часто - жжение или боль в месте введения.

Аллергические реакции: редко - анафилаксия или анафилактические 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

Передозировка препарата Розакет при однократном или повторном применении обычно проявляется болями в области живота, тошнотой, рвотой, возникновением пептических язв желудка или эрозивного гастрита, нарушением функции почек, гиперемией. В этих случаях рекомендуется промывание желудка, введение адсорбентов (активированный уголь) и проведение симптоматической терапии. Розакет 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, глюкокортикостероидами, этанолом, кортикостероидом может привести к образованию язв желудочно-кишечного тракта и развитию желудочно-кишечных кровотечений.

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).

Пробенидид 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.

Антацидные средства не влияют на полноту всасывания лекарства.

Повышает 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 свертываемости 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 блистере.

10 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения

Хранить в сухом и защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска

По рецепту.

Владелец торговой марки и регистрационного удостоверения:

Vegapharm LLP

Unit 18, 53 Norman Road, Greenwich Centre Business Park,
London, England, SE10 9QF, Великобритания



Vegapharm

Производитель:

UNIMAX LABORATORIES

Plot No. 7, Sector 24, Faridabad-121 005,

Haryana, Индия

Адрес организации, принимающей на территории Кыргызской Республики претензии от потребителей по качеству продукта:

ОсОО «Аман Фарм» г. Бишкек, Республика Кыргызстан, ул. Тыныстанова дом 4А, кв. 11,

E-mail: aman.pharm12@gmail.com