

РОЗАКЕТ

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

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 гликолат (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 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 (С_{max}) в плазме крови (0,7-1,1 мг/мл) достигается через 40 мин после приема натоцка 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 мг/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 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 (Т_{1/2}) у пациентов с нормальной функцией почек составляет в среднем 5,3 ч (2,4 - 9 ч после приема внутрь 10 мг). Т_{1/2} удлиняется у пожилых пациентов и укорачивается у молодых. Функция печени не оказывает влияния на Т_{1/2}. У пациентов с нарушением функции почек при концентрации креатинина в плазме крови 19-50 мг/л (168 - 442 мкмоль/л) Т_{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 других 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 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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).

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; нарушенная функция почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л); орталгия - бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани (одышка, затрудненное дыхание).