

# Кеторол

Латинское название: Ketorol

Действующее вещество: кеторолак

Код АТХ: M01AB15

Производитель: Д-р Редди`с Лабораторис Лтд. (Индия)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 3 года

## Введение в тему

«Кеторол» – лекарственное средство из группы нестероидных противовоспалительных препаратов, которое оказывает обезболивающие, жаропонижающие и противовоспалительные эффекты. Препарат используется в форме таблеток и в виде инъекционного раствора для лечения болей различных причин. Наиболее распространенные потенциальные нежелательные эффекты включают изменения настроения, расстройство желудка и кожные реакции. Как и другие НПВП, кеторолак может вызывать серьезные побочные эффекты – желудочно-кишечные язвы, сердечно-сосудистые заболевания и болезни почек.

## Состав и форма выпуска

Действующее вещество:

- Кеторолак трометамин.

Вспомогательные вещества:

- Молочный сахар
- Крахмал
- Электролиты.

«Кеторол» выпускается в виде таблеток с пленочным покрытием по 0,01 г активного вещества для перорального применения. Также «Кеторол» выпускается в ампулах для парентерального введения.

## Фармакологические свойства

«Кеторол» обладает болеутоляющими, противовоспалительными и жаропонижающими свойствами. В отличие от опиатов, анальгетики действуют исключительно на периферическую ткань.

Периферические анальгетики и опиоиды не являются взаимозаменяемыми, даже если реклама этого предлагает. Однако может оказаться полезным объединить их вместе (например, при боли в результате метастазов в кости), чтобы достичь достаточного обезболивающего эффекта.

Кеторолак является производным индоловой кислоты и структурно связан с толметином, который больше не доступен в настоящее время. Препарат находится в форме трометамин и поэтому должен быть особенно растворимым.

Как и другие нестероидные противовоспалительные препараты, кеторолак ингибирует циклооксигеназу и, следовательно, образование простагландина. Соответственно он обладает обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Он также ингибирует

агрегацию тромбоцитов и, таким образом, увеличивает среднее время кровотечения. В моделях на животных кеторолак оказывал более сильное обезболивающее действие, чем, например, фенилбутазон или индометацин.

Кеторолак быстро и полностью всасывается после перорального и внутримышечного введения. Максимальные концентрации в плазме крови достигаются через 30–45 минут. Биодоступность после перорального приема составляет около 100%.

Период полураспада кеторолака в плазме у здоровых молодых людей составляет от 4 до 6 часов. Помимо кеторолака, в плазме может быть обнаружен только один (неактивный) метаболит. Около 60% дозы препарата обнаружено в неизмененном виде, а остальное количество составляет метаболиты в моче. Пожилые люди и пациенты с почечной недостаточностью имеют более длительный период полураспада кеторолака.

#### Показания к применению

Ряд исследований свидетельствует об анальгетической эффективности кеторолака. В частности, при боли в результате операции или после рождения новое лекарственное средство сравнивалось с опиоидами, в меньшей степени с другими противовоспалительными средствами.

Эффект однократной внутримышечной дозы кеторолака был протестирован, например, в двойном слепом исследовании с участием 241 пациента с болью после операции. Как 0,03 г, так и 0,01 г кеторолака имели анальгетический эффект, сравнимый с 12 мг морфина, и значительно превосходили дозу 6 мг морфина. Самое сильное уменьшение боли было достигнуто при дозе кеторолака 0,09 г.

Внутримышечные инъекции кеторолака испытывали среди других в многоцентровом двойном слепом исследовании. 542 пациента с послеоперационной болью получали кеторолак или морфин (6 мг или 12 мг), которые можно повторять при необходимости каждые два часа, максимум до 20 доз.

Пациентов просили оценить интенсивность боли или облегчение боли и (в конце лечения) общий эффект с числом от 0 до 5. Также в этом исследовании было обнаружено, что кеторолак столь же эффективен, как и морфин.

В швейцарском исследовании 100 человек получали перорально кеторолак или пентазоцин после оперативных (в основном ортопедических) операций до 4 раз/сут в течение 3 дней. Два препарата имели сходный анальгетический эффект.

Пероральный кеторолак был проверен во многих других исследованиях. Научные работы были опубликованы лишь частично в деталях. Они предполагают, что 0,01 г кеторолака по анальгетической эффективности соответствуют, например, 650 мг ацетилсалициловой кислоты, 500 мг парацетамола или 400 мг ибупрофена.

В контролируемом длительном исследовании у пациентов с хронической болью – например, из-за артроза – кеторолак (до 4 раз в день) оказался лучше, чем ацетилсалициловая кислота. Однако менее половины из тех, кто проходил лечение в обеих группах, завершили 52-недельное исследование, частично из-за побочных эффектов.

#### Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, производитель рекомендует разовые дозы 0,01 г (перорально) и максимальные суточные дозы 0,04 и 0,120 г. Поскольку кеторолак приблизительно одинаково биодоступен перорально и внутримышечно, и равные дозы показали одинаковые эффекты в нескольких исследованиях.

Большая разница между дозами, рекомендованными для перорального и парентерального введения, необъяснима. От чего помогает «Кеторол» расскажет врач.

Ожидается, что длительное введение препарата внутримышечно увеличивает риск развития побочных эффектов. Поэтому применение препарата в таблетках или ампулах не рекомендуется дольше 5 дней. В информации о продукте нет четких указаний на то, что кеторолак следует вводить внутримышечно. От чего помогают «Кеторол уколы» также расскажет специалист.

Противопоказания, побочные эффекты, передозировка, лекарственное взаимодействие

Абсолютные противопоказания к применению:

- Язва желудка
- Аллергия на НПВП
- Тяжелая дисфункция печени
- Тяжелая почечная дисфункция
- Острое кровотечение.

Как и с другими нестероидными противовоспалительными препаратами, желудочно-кишечные побочные эффекты являются значительными. Боль в животе, тошнота и диспепсия наблюдаются более чем у 3% из тех, кого лечат.

Язвы желудка, желудочно-кишечные кровотечения или перфорация возможны, но редки. Также редким, но опасным побочным действием является острое ухудшение функции почек, которое может быть особенно распространенным у людей с уже существующим заболеванием почек.

Довольно часто пациенты жалуются на сонливость, головные боли и отеки. После внутримышечной инъекции около 2% сообщают о локальной боли. При кратковременном парентеральном введении кеторолак имеет немного больше побочных эффектов, чем опиоиды.

После операции, по сравнению с опиоидами, он имеет то преимущество, что не оказывает депрессивного действия на дыхательную, кровеносную и центральную нервную системы. Интересно, однако, что в отдельных исследованиях с кеторолаком наблюдалось больше сонливости, чем при опиоидах. Имеет ли кеторолак больше или меньше побочных эффектов, чем, например, диклофенак или ибупрофен не было тщательно изучено.

При одновременном приеме высоких доз салицилата в плазме увеличивается количество несвязанного кеторолака, поэтому следует соблюдать осторожность. Хотя это еще не наблюдалось, возможно взаимодействие с антикоагулянтами, литием и метотрексатом.