

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
КЕТОПРОФЕН

Регистрационный номер ЛП-005449

Торговое наименование Кетопрофен

Международное непатентованное наименование

Кетопрофен

Лекарственная форма Суппозитории ректальные

Состав на один суппозиторий:

Действующее вещество: кетопрофен – 100 мг.

Вспомогательные вещества: жир твердый (Витепсол Н-15)

– 1850 мг; глицерил каприлокапрат (Миглиол 812) – 200 мг.

Описание Суппозитории белого или почти белого цвета, торпедообразной формы. На продольном срезе – однородные, допускается наличие воздушного стержня.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AE03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Кетопрофен является нестероидным противовоспалительным препаратом, обладающим противовоспалительным, анальгезирующим и жаропонижающим действием. Подавляет активность циклооксигеназ I и II типа, регулирующих синтез простагландинов. Анальгезирующее действие обусловлено, как центральным, так и периферическими механизмами. Обладает антибрадикалининовой активностью, стабилизирует лизосомальные мембраны и задерживает высвобождение из них ферментов, способствующих разрушению тканей при хроническом воспалении.

Фармакокинетика

Абсорбция. Кетопрофен легко абсорбируется из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) при приеме внутрь. Время достижения максимальной концентрации (ТС_{max}) при ректальном введении - 1,4-4 ч. Биодоступность препарата составляет 90 %. Прием пищи не влияет на общую биодоступность кетопрофена, но уменьшает скорость всасывания.

Распределение. Кетопрофен на 99 % связан с белками плазмы крови, в основном с альбуминовой фракцией. Объем распределения составляет 0,1 л/кг. Кетопрофен проникает в синовиальную жидкость и достигает там концентрации, равной 30 % концентрации в плазме крови. Плазменный клиренс кетопрофена составляет приблизительно 0,08 л/кг/ч. Эффективные концентрации кетопрофена определяются в крови даже через 24 ч после его приема. Метаболизм и выведение. Кетопрофен подвергается интенсивному метаболизму при действии микросомальных ферментов печени, период полувыведения составляет менее 2 ч. Кетопрофен связывается с глюкуроновой кислотой и выводится из организма в виде глюкуронида. Активных метаболитов кетопрофена нет. До 80 % кетопрофена выводится почками в течение 24 ч, в основном в форме глюкуронида кетопрофена. При применении препарата в дозировке 100 мг и более выведение почками может быть затруднено.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью большая часть препарата выделяется через кишечник. При приеме высоких доз печеночный клиренс также увеличивается. Через кишечник выводится до 40 % препарата.

У пациентов с печеночной недостаточностью плазменная концентрация кетопрофена увеличена в два раза (вероятно, за счет гипоальбуминемии, и вследствие этого высокого уровня несвязанного активного кетопрофена); таким пациентам необходимо назначать препарат в минимальной терапевтической дозе.

У пациентов с почечной недостаточностью клиренс кетопрофена снижен, однако коррекция доз требуется только в случае тяжелой почечной недостаточности.

У пациентов пожилого возраста метаболизм и выведение кетопрофена протекают медленнее, что имеет клиническое значение только для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью.

Показания к применению Воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата:

- ревматоидный артрит;
- серонегативные артриты: анкилозирующий спондилит (болезнь Бехтерева), псориатический артрит, реактивный артрит (болезнь Рейтера);
- остеоартроз;
- тендинит,
- бурсит,
- миалгия,
- невралгия,
- радикулит;

Болевой синдром:

- головная боль;
- зубная боль;
- посттравматический и послеоперационный болевой синдром;
- болевой синдром при онкологических заболеваниях;
- альгодисменорея.

Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к кетопрофену или другим

компонентам препарата;

- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВП (в том числе в анамнезе);
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;
- язвенный колит (обострение), болезнь Крона в фазе обострения;
- пептическая язва;
- гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;
- подтвержденная гиперкалиемия;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- активное заболевание печени;
- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина < 30 мл/мин);
- прогрессирующие заболевания почек;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- периперационный период после аортокоронарного шунтирования;
- хроническая диспепсия;
- желудочно-кишечные, цереброваскулярные и другие кровотечения (или подозрение на кровотечение);
- воспалительные заболевания кишечника, в том числе проктит, дивертикулит;
- детский возраст до 15 лет;
- беременность (III триместр) и период грудного вскармливания.

С осторожностью

Анемия, бронхиальная астма, алкоголизм, табакокурение, алкогольный цирроз печени, гипербилирубинемия, хроническая печеночная недостаточность, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в анамнезе, воспалительные заболевания кишечника (в том числе язвенный колит, болезнь Крона) вне обострения, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, тяжелые соматические заболевания, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, дегидратация, сепсис, хроническая сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, отеки, артериальная гипертензия, заболевания крови (в том числе лейкопения), стоматит, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, длительное использование НПВП, одновременный прием пероральных глюкокортикостероидов (в том числе преднизолона), антикоагулянтов (в том числе варфарина), антиагрегантов (в том числе клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в том числе циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), пожилой возраст, беременность (I, II триместр). Пациентам с воспалительными заболеваниями прямой кишки не следует применять кетопрофен в лекарственной форме свечи. В случае ухудшения состояния пациента следует прекратить лечение препаратом. Если у Вас одно из перечисленных заболеваний, перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение кетопрофена в III триместре беременности противопоказано. В I и II триместрах беременности назначение препарата возможно только в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При приеме препарата в период грудного вскармливания следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Применение кетопрофена может влиять на женскую фертильность, поэтому пациенткам с бесплодием (в т.ч. проходящим обследование) не рекомендуется применять препарат. Ингибирование синтеза простагландинов может оказать нежелательное влияние на течение беременности и/или на эмбриональное развитие. Данные, полученные в ходе эпидемиологических исследований при применении ингибиторов синтеза простагландина на ранних сроках беременности, подтверждают повышение риска самопроизвольного аборта и формирования пороков сердца (~1-1,5 %). Противопоказано применение кетопрофена у беременных женщин во время III триместра беременности из-за возможности развития слабости родовой активности матки и/или преждевременного закрытия артериального протока, возможного увеличения времени кровотечения, маловодия и почечной недостаточности.

Способ применения и дозы Ректально. Суппозитории вводят глубоко в прямую кишку. Пациентам назначают по 1 суппозиторию 100 мг 1-2 раза в сутки. Максимальная суточная доза препарата не должна превышать 200 мг.

Побочное действие

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы редко: геморрагическая анемия; частота неизвестна: агранулоцитоз, тромбоцитопения, нарушение функции костного мозга.

Нарушения со стороны иммунной системы

частота неизвестна: анафилактические реакции (включая анафилактический шок);

Нарушения со стороны кожных покровов

нечасто: кожная сыпь, кожный зуд;

частота неизвестна: фотосенсибилизация, алопеция, крапивница, ангионевротический отек, эритема, буллезная

сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Нарушения со стороны психики

частота неизвестна: эмоциональная лабильность.

Нарушения со стороны нервной системы

нечасто: головная боль, головокружение, сонливость; редко: парестезия;

частота неизвестна: судороги, нарушение вкусовых ощущений.

Нарушения со стороны органа зрения

частота неизвестна: нечеткость зрения

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения

частота неизвестна: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

частота неизвестна: сердечная недостаточность

Нарушения со стороны сосудов

частота неизвестна: повышение артериального давления, вазодилатация.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов рудной клетки и средостения

редко: обострение бронхиальной астмы;

частота неизвестна: бронхоспазм (в особенности, у пациентов с гиперчувствительностью к НПВП), ринит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

часто: тошнота, рвота, диспепсия, боль в области живота; нечасто: запор, диарея, вздутие живота, гастрит; редко: пептическая язва, стоматит;

очень редко: обострение язвенного колита или болезни Крона, желудочно-кишечное кровотечение, перфорация.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей
редко: гепатит, повышение уровня «печеночных» трансаминаз и билирубина.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

очень редко: острая почечная недостаточность, интерстициальный нефрит, нефритический синдром, нефротический синдром, аномальные значения показателей функции почек.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

нечасто: отеки;

редко: увеличение массы тела;

частота неизвестна: повышенная утомляемость.

Передозировка

Симптомы: возможно появление сонливости, тошноты, рвоты, боли в животе, кровотечений, нарушений функции печени и почек.

Лечение: симптоматическая терапия. При случайном проглатывании – промывание желудка и/или активированный уголь и/или другие сорбенты.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами
Антикоагулянты и антиагреганты:

Необходимо с осторожностью применять кетопрофен с препаратами этих групп из-за риска развития кровотечений. Следует тщательно наблюдать пациентов, получающих одновременное лечение данными лекарственными препаратами.

Литий:

Кетопрофен может повышать содержание лития в плазме крови. Рекомендуется контроль содержания лития в сыворотке крови.

Другие НПВП, в частности, селективные ингибиторы ЦОГ-2 и ацетилсалициловая кислота: следует избегать одновременного применения двух и более препаратов из группы НПВП из-за возможного увеличения риска возникновения побочных эффектов, особенно со стороны ЖКТ (развитие эрозивно-язвенного поражения и перфораций).

Метотрексат:

Следует соблюдать осторожность при применении кетопрофена менее чем за 24 часа до или через 24 часа после приема метотрексата, так как в таких случаях может повышаться концентрация метотрексата в крови и усиливаться его токсическое действие.

Мифепристон:

Прием НПВП следует начать не ранее, чем через 8-12 дней после приема мифепристона, поскольку НПВП могут снижать эффективность мифепристона.

Пентоксифиллин:

Существует повышенный риск развития кровотечения. При совместном применении с кетопрофеном требуется более частый клинический мониторинг и мониторинг времени кровотечения.

Диуретические и гипотензивные средства:

При одновременном применении с диуретиками и гипотензивными препаратами (например, бета-адреноблокаторам и ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента - АПФ) кетопрофен может снижать их гипотензивное действие. В связи с вышесказанным у пациентов, особенно пожилого возраста, при одновременном применении кетопрофена и диуретиков или гипотензивных средств следует регулярно измерять АД, контролировать функцию почек и степень гидратации (вследствие повышения риска нефротоксичности).

Сердечные гликозиды:

Одновременное назначение НПВП и сердечных гликозидов может привести к усугублению сердечной недостаточности, снижению скорости клубочковой фильтрации и увеличению концентрации сердечных гликозидов в плазме крови.

Циклоспорин:

Увеличение риска нефротоксичности при одновременном

назначении НПВП и циклоспорина, особенно у пожилых пациентов.

Глюкокортикостероиды:

Повышенный риск образования язв ЖКТ и желудочно-кишечного кровотечения.

Антибиотики хинолонового ряда:

У пациентов, получающих совместное лечение НПВП и антибиотиками хинолонового ряда, возможно увеличение риска возникновения судорог.

Циклоспорин:

Увеличение риска нефротоксичности при одновременном назначении НПВП и циклоспорина, особенно у пожилых пациентов.

Антикоагулянты и тромболитические препараты:

НПВП могут усиливать эффект антикоагулянтов, в частности, варфарина и тромболитических препаратов.

Пробенецид:

Совместный прием кетопрофена и пробенецида может заметно снизить плазменный клиренс кетопрофена.

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина
Одновременное применение кетопрофена с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина повышает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Зидовудин:

Одновременное применение НПВП и зидовудина может привести к повышению гематотоксичности. Имеются данные о повышенном риске возникновения гемартроза и гематом у ВИЧ-положительных пациентов с гемофилией, получавших совместное лечение зидовудином и кетопрофеном.

Особые указания

Во время лечения лекарственным препаратом Кетопрофен необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени и почек в особенности у пациентов старше 65 лет, а также необходимо проводить анализ кала на скрытую кровь. При нарушении функции почек и печени необходимо снижение дозы и тщательное наблюдение. Следует соблюдать осторожность при назначении препарата больным с язвенными заболеваниями желудочно-кишечного тракта в анамнезе. Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

При необходимости определения 17-кетостероидов препарат следует отменить за 48 ч до исследования.

При одновременном применении кетопрофена и варфарина, а также кумариновых антикоагулянтов или солей лития пациенты должны находиться под строгим наблюдением врача.

Прием лекарственного препарата Кетопрофен может маскировать признаки инфекционного заболевания.

При развитии нарушений со стороны органов зрения необходима консультация офтальмолога.

Необходимо соблюдать осторожность и чаще контролировать артериальное давление при применении кетопрофена для лечения пациентов, страдающих артериальной гипертензией, сердечно-сосудистыми заболеваниями, которые приводят к задержке жидкости в организме.

При наличии в анамнезе противопоказаний со стороны ЖКТ (кровотечения, перфорация, язвенная болезнь), проведении длительной терапии и применении высоких дозировок кетопрофена пациент должен находиться под тщательным наблюдением врача.

Клинические исследования НПВП (селективных к ЦОГ-2 и неселективных) показали повышение риска развития серьезных сердечно-сосудистых тромботических явлений, включая инфаркт миокарда и инсульт. Возрастание риска более часто наблюдалось при применении высоких доз.

Влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения кетопрофеном возможно снижение скорости психических и двигательных реакций. Кроме того, на фоне применения препарата могут возникнуть сонливость, головокружение или другие неприятные ощущения со стороны нервной системы, включая нарушение зрения, поэтому необходимо воздерживаться от вождения транспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска Суппозитории ректальные, 100 мг.

По 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 суппозитория в контурной ячейковой упаковке из двухслойной пленки или из пленки из полимерных материалов ПВХ/ПЭ или из пленки ПВХ/ПЭ белой комбинированной или из пленки поливинилхлоридной.

По 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению препарата помещают в пачку картонную.

Условия хранения
В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности 5 лет. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска Отпускают по рецепту.

Производитель/Организация, принимающая претензии:
ООО «Тульская фармацевтическая фабрика»
Россия, 300004, г. Тула, Торховский проезд, д. 10

Тел./факс: (4872)41-04-73