

INFORMACION PARA PRESCRIBIR AMPLIA

I P P - A

1. DENOMINACIÓN DISTINTIVA

TOLORAN

2. DENOMINACIÓN GENÉRICA

(Ketorolaco Trometamina)

3. FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN

Forma Farmacéutica: Solución Inyectable

Formulación: Cada ml contiene:

Ketorolaco Trometamina	30.00 mg
Vehículo c.b.p.	1.00 ml

4. INDICACIONES TERAPÉUTICAS

Analgésico no narcótico, indicado en el tratamiento de corto plazo, del dolor moderado a severo.

5. FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA EN HUMANOS

Por vía intramuscular, su efecto se inicia en 10 minutos y es máximo en 1 a 3 h; por esta vía, es capaz de aliviar el dolor de moderado a grave.

Por la vía endovenosa, tras la administración de 30 mg en bolo, se alcanza la concentración máxima (2.4 mcg/ml) a los 5,4 min en promedio.

El Ketorolaco Trometamina es un analgésico antiinflamatorio no esteroideo, estructuralmente relacionado con la indometacina y con el tolmetin. Al igual que otros miembros de este grupo, inhibe la actividad de la ciclooxigenasa (sintetasa de prostaglandina) y en consecuencia, impide la formación de prostaglandinas y tromboxanos a partir del ácido araquidónico. Como en el caso de otros agentes del grupo, sus efectos terapéuticos y tóxicos están estrechamente relacionados con su capacidad de disminuir las concentraciones tisulares de prostaglandinas. En este producto destacan sus propiedades analgésicas. Por vía oral se absorbe en forma rápida y completa con una concentración plasmática máxima de 0.87 mcg/ml, que se presenta a los 44 minutos después de una dosis de 10 mg. La vida media plasmática es de 5.3 horas, en los adultos jóvenes y de 6.1 horas en los sujetos de edad avanzada. Es posible que su mecanismo de acción analgésico también guarde relación con su efecto sobre otros mediadores que aumentan la sensibilidad de los receptores del dolor a estímulos mecánicos o químicos. El Ketorolaco Trometamina también inhibe la agregación plaquetaria; en contraste con la aspirina, este efecto es transitorio y la función plaquetaria se recupera de 1 a 2 días después de suspender su administración. El Ketorolaco Trometamina se absorbe en forma rápida y completa en los depósitos intramusculares y alcanza concentraciones

significativas en la leche materna. Se metaboliza parcialmente (50%) en el hígado, donde se forman metabolitos inactivos, y se excreta en la orina (90%) y en menor proporción en la bilis. Su vida media de eliminación es de aproximadamente 5 h, la cual se prolonga en los ancianos (7 h) y en casos de insuficiencia renal (10 h).

6. CONTRAINDICACIONES

TOLORAN está contraindicado en casos de hipersensibilidad al Ketorolaco Trometamina o a los analgésicos antiinflamatorios no esteroideos, úlcera péptica activa, colitis ulcerativa, sangrado gastrointestinal, hepatitis activa durante el embarazo, trabajo de parto y lactancia. Su contraindicación es relativa en casos de asma, alcoholismo activo, tabaquismo intenso, hemofilia, insuficiencia renal o hepática, insuficiencia cardiaca congestiva, hipertensión. Se investigarán cuidadosamente los antecedentes de reacciones alérgicas, asociadas a fármacos del tipo de la aspirina, ya que en estos casos la administración de Ketorolaco Trometamina desencadena reacciones anafilactoides graves. Si se presentan reacciones de hipersensibilidad, suspéndase de inmediato su administración. El riesgo más grave con la administración de este producto es la ulceración, el sangrado y la perforación gastrointestinal, que ocurre en cualquier momento y en ocasiones sin sintomatología previa; por tanto las precauciones deberán ser extremas en pacientes con antecedentes de enfermedad gastrointestinal.

7. PRECAUCIONES GENERALES.

El ketorolaco es un analgésico para utilizarse en tiempo corto. Por lo anterior, solamente se recomienda en procesos dolorosos agudos o agudización de procesos crónicos. Conviene no asociarlo a otros AINES.

Conviene vigilar estrechamente al paciente en tratamiento con ketorolaco trometamina para suspender el medicamento en caso de sangrado del aparato digestivo.

En pacientes con alteraciones de la coagulación, se deberá estar al tanto de sus pruebas sanguíneas, ya que disminuye la adhesividad plaquetaria.

En algunos pacientes se llega a observar somnolencia, por lo que se debe advertir al enfermo sobre el riesgo al manejar vehículos o maquinaria peligrosa.

En pacientes mayores de 65 años la posología debe adecuarse, ya que la vida media del ketorolaco se prolonga (Ver Farmacocinética).

8. PRECAUCIONES O RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA.

No existen estudios bien controlados en humanos que demuestren que el Ketorolaco Trometamina pueda utilizarse con seguridad en estas etapas. No se ha demostrado que impida la fertilidad en ratones, ratas o conejos que hayan recibido hasta 6 veces la dosis humana. Otros estudios en animales han demostrado que cuando se administra el Ketorolaco Trometamina en la etapa final del embarazo, se puede presentar gestación prolongada, distocia y parto prolongado, probablemente por la disminución de la contractilidad uterina secundaria debido a la inhibición de las prostaglandinas del útero.

9. REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS

Aparato Digestivo: Dolor abdominal, anorexia, estreñimiento, diarrea, dispepsia, eructos, flatulencia, sensación de plenitud, gastritis, hematemesis, náuseas, esofagitis,

pancreatitis, úlcera gastroduodenal, perforación gastrointestinal, estomatitis, vómitos, rectorragia y melena.

SNC: Sueños anormales, alteración del pensamiento, ansiedad, meningitis aséptica, convulsiones, depresión, mareo, somnolencia, sequedad de boca, dispepsia, polidipsia, cefalalgia, disminución de la capacidad de concentración, insomnio, mialgia, nerviosismo, parestesias, sudoración, vértigo.

Aparato urinario: insuficiencia renal aguda, dolor en las fosas renales acompañado de azotemia y hematuria, síndrome hemolítico urémico, hiperpotasemia, hiponatremia, polaquiuria, retención urinaria, nefritis intersticial, síndrome nefrótico, oliguria, elevación de los niveles séricos de urea y creatinina.

10. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO

El uso concomitante con glucocorticoides, ACTH y alcohol puede aumentar el riesgo de efectos indeseables gastrointestinales incluyendo úlcera y hemorragia. Su asociación con anticoagulantes cumarínicos o heparina, así como agentes trombolíticos, puede potencializar su acción por desplazamiento de su unión a proteínas y provocar hemorragias, por lo tanto en éstos casos debe vigilarse estrechamente el tiempo de protombina y coagulación y deben hacerse ajustes a la posología. Con los agentes trombolíticos y con otros agentes antiinflamatorios no esteroideos se puede aumentar, por adición, la incidencia y gravedad de las reacciones adversas. El probenecid reduce la depuración de Ketorolaco Trometamina lo cual aumenta la concentración plasmática (triplica el área bajo la curva) así como la vida media aproximadamente al doble.

11. ALTERACIONES DE PRUEBAS DE LABORATORIO

El tiempo de sangrado puede prolongarse con el uso de Ketorolaco Trometamina. También puede presentarse aumento sérico en los niveles de nitrógeno ureico, creatinina y potasio. La depuración renal de creatinina, potasio y sodio pueden estar disminuídas.

La actividad de las transaminasas puede elevarse cuando se esté usando este medicamento.

12. PRECAUCIONES Y RELACION CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD

El Ketorolaco Trometamina no se recomienda como analgésico obstétrico, ya que inhibe la actividad uterina y puede provocar cierre prematuro del conducto arterioso, también puede precipitar la aparición de insuficiencia renal aguda, sobre todo en pacientes con volumen circulante disminuído.

13. DOSIS Y VIA DE ADMINISTRACION

Duración del tratamiento: En los adultos, el tratamiento con inyecciones en bolos I.V. o I.M. no debe superar los 4 días, pues los efectos secundarios aumentan con su uso prolongado. En los niños, el tratamiento con inyecciones en bolo I.V., o I.M. no debe superar en total los 2 días.

Cuando se administra el ketorolaco en bolo I.V., la aplicación debe durar como mínimo 15 segundos. La inyección I.M. debe aplicarse en forma lenta y profunda.

Dado que pueden producirse reacciones alérgicas (desde broncospasmo hasta choque anafiláctico), es necesario tener a la mano las necesarias medidas terapéuticas cuando se administre la primera dosis parenteral de ketorolaco (véase Contraindicaciones y Precauciones generales).

No se recomienda administrar ketorolaco por vía parenteral a niños menores de 3 años, pues apenas se dispone de experiencia en este grupo de edad.

Adultos:

-Pacientes menores de 65 años: La dosis diaria máxima no debe superar los 120 mg.

Administración I.M.: La dosis recomendada es de 30 mg cada 4-6 horas, sin sobrepasar la dosis diaria máxima de 120 mg.

Administración I.V.:

Inyección rápida: 30 mg cada 6 horas, sin sobrepasar la dosis diaria máxima de 120 mg.

Infusión continua: Dosis inicial de 30 mg, seguida de una infusión 5 mg/h durante 24 horas, sin sobrepasar la dosis diaria máxima de 120 mg y de 4 días de duración.

-Pacientes mayores de 65 años o con insuficiencia renal: La dosis diaria máxima no debe superar los 60 mg.

Administración I.M.: La dosis recomendada es de 15 mg cada 4-6 horas, sin sobrepasar la dosis diaria máxima de 60 mg.

Administración I.V.:

Inyección rápida: 15 mg cada 6 horas, sin sobrepasar la dosis diaria máxima de 60 mg.

La infusión continua no se recomienda, pues apenas se dispone de experiencia en estos grupos de pacientes.

Niños mayores de 3 años: Dosis inicial de 1.0 mg/kg por vía I.M. o 0.5-1.0 mg/kg por vía I.V., seguida de 0.5 mg/kg cada 6 horas por vía I.V.

El ketorolaco Inyectable es compatible con solución salina, dextrosa al 5%, solución de Ringer y solución de Ringer lactato o soluciones Plasmalyte.

Es compatible también con aminofilina, clorhidrato de lidocaína, sulfato de morfina, clorhidrato de meperidina, clorhidrato de dopamina e insulina humana regular, cuando se mezclan en soluciones para administración I.V. contenidas en frascos o bolsas comunes.

Transferencia de ketorolaco inyectable a ketorolaco oral: En los pacientes que han recibido ketorolaco parenteral y que son transferidos a las tabletas orales, la dosis diaria combinada de ketorolaco no deberá exceder de 120 mg al día en pacientes menores de 65 años y de 60 mg en pacientes mayores de 65 años, con daño renal o con peso inferior a 50 kg. La dosis oral total no deberá exceder de 40 mg al día. Los analgésicos opiáceos (por ejemplo, morfina, meperidina) pueden ser usados concomitantemente si se desea un mayor alivio del dolor, o bien los efectos ansiolíticos y/o sedantes de los opiáceos.

14. MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL.

Pueden aparecer los siguientes síntomas: dolor abdominal, náuseas, vómito, hiperventilación, úlcera gastroduodenal, gastritis erosiva y disfunción renal. En tales casos, deberá retirarse el uso del medicamento. La diálisis no asegura eliminar el ketorolaco de la sangre.

15.- PRESENTACIONES.

Caja con 3 ampollitas de 30 mg/ml para Venta al Público, Exportación y Mercado de Genéricos Intercambiables.

16.-RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO.

Consérvese a temperatura ambiente a no más de 30° C.

17.- LEYENDAS DE PROTECCIÓN.

Literatura exclusiva para médicos.

Su venta requiere receta médica

No se deje al alcance de los niños.

Protéjase de la luz.

No se use durante el embarazo, lactancia, ni en pacientes menores de 16 años.

No se administre si la solución no es transparente, si contiene partículas en suspensión o sedimentos.

Si no se administra todo el producto deséchese el sobrante.

18.- NOMBRE Y DOMICILIO DEL LABORATORIO.

FARMACÉUTICOS RAYERE, S.A.

Emiliano Zapata 72

México, D.F. 03300

19.-NÚMERO DE REGISTRO DEL MEDICAMENTO E IPP

Reg. N° 123 M 2000 SSA IV

Clave IPP: DEAR-07330060100145/RM 2007