

KETOROLAC (CETOROLACO DE TROMETAMINA)

Ações terapêuticas

Analgésico, antiinflamatório.

Propriedades

O cetorolaco é um antiinflamatório não esteróide, com ações analgésicas, antiinflamatórias e antipiréticas, cujo mecanismo de ação está relacionado com sua capacidade inibitória da síntese de prostaglandinas e um efeito analgésico periférico. Nenhum efeito sobre os receptores opióides foi demonstrado. É absorvido com rapidez após a administração oral e intramuscular, com um pico de concentração plasmática entre 1 e 2 horas. A meia-vida de eliminação em jovens varia entre 4 e 6 horas e, em idosos, entre 5 e 8½; mais de 99% do cetorolaco unem-se às proteínas plasmáticas. Em geral, quando administrado a cada 6 horas, o platô de concentração plasmática é alcançado em 24 horas, razão pela qual 1 dose de carga (o dobro da de manutenção) pode ser requerida para encurtar o período em que um importante efeito analgésico é alcançado. A principal via de eliminação do cetorolaco trometamina e seus metabólitos (parahidroxilados ou conjugados) é a urinária (92%), excretando-se o resto (6%) pelas fezes. Em pacientes com creatininemias entre 1,9 e 5mg%, a depuração de cetorolaco reduz-se, aproximadamente, à metade da normal. A diminuição da albumina sérica (por exemplo, na cirrose hepática) poderia também mudar sua depuração, mas, não se observou correlação entre concentração plasmática de albumina e depuração de cetorolaco em pacientes com cirrose hepática. Não atravessa a barreira hematoencefálica.

Indicações

Oral: tratamento a curto prazo da dor moderada a grave. Parenteral: tratamento da dor pós-operatória aguda moderada a grave.

Posologia

A dose diária deverá ser individualizada conforme a intensidade da dor, aceitando-se como dose máxima 90mg/dia. Via oral, dose inicial – 10mg. Dose de manutenção: de 10 a 20mg a cada 6 horas; o tratamento não deve superar 5 dias. Via parenteral, dose inicial – 10mg. Doses subseqüentes: de 10 a 30mg a cada 8 horas, com duração máxima de 2 dias de tratamento. Os tratamentos prolongados foram associados com efeitos adversos, em alguns casos graves.

Reações adversas

A freqüência de reações adversas após um uso de curto prazo de AINE é, em geral, a metade de uma décima parte da freqüência de efeitos adversos após o uso crônico. Os efeitos colaterais mais freqüentes (1%) incluem náuseas, dispepsia, epigastria, diarreia, sonolência, enjoos, cefaléia, sudorese e dor no local da injeção após a administração de várias doses. Os efeitos menos freqüentes (1%) incluem astenia, mialgia, palidez, vasodilatação, constipação, flatulência, anormalidades no funcionamento hepático, melena, úlcera péptica, hemorragia renal, estomatite, púrpura, secura na boca, nervosismo, parestesias, depressão, euforia, sede excessiva, insônia, vertigem, dispnéia, asma, alterações de paladar e visão, polaciúria, oligúria. O cetorolaco não é um

narcótico e, portanto, não tem demonstrado ação aditiva nem dependência física.

Precauções

Recomenda-se seu uso em curto prazo, dado que, em pacientes tratados cronicamente (3 meses), o risco de úlcera gastroduodenal, hemorragia e perfuração aumenta acentuadamente. Os pacientes idosos ou debilitados toleram menos que os mais jovens as ulcerações e hemorragias, tendo sido constatados mais acidentes gastrintestinais fatais neste grupo etário. Deve ser usado com cuidado em insuficiência hepática, renal ou em pacientes com antecedentes de doenças hepáticas ou renais. Assim como com outros AINE, sua administração prolongada pode provocar necrose renal papilar. No homem foram observadas, após o uso crônico por via oral, hematúria e proteinúria. Outro tipo de toxicidade renal foi observado em situações nas quais ocorre uma redução do volume sangüíneo ou do fluxo sangüíneo renal, em que as prostaglandinas renais desempenham um papel fundamental na manutenção da perfusão renal. A administração de AINE pode causar uma redução dependente da dose da formação de prostaglandinas renais e precipitar uma insuficiência renal aguda. Deve ser usado com cuidado em insuficiência cardíaca e hipertensão. As modificações das enzimas hepáticas (aumento de TGO-AST e TGP-ALT) podem ou não ser transitórias e, portanto, nestes casos os pacientes devem ser monitorados com freqüência. O cetorolaco inibe a agregação plaquetária e pode prolongar o tempo de sangramento, porém a incidência de hemorragias pós-operatórias é muito baixa (0,4% contra 0,2% - controle). Deve ser usado com precaução no pré-operatório. Não se recomenda seu uso em maiores de 65 anos e também não se recomenda em analgesia obstétrica, porque seu efeito inibidor da síntese de prostaglandinas pode diminuir as contrações uterinas e modificar a circulação fetal.

Interações

Não administrar a pacientes tratados com altas doses de salicilatos. Assim como com outros AINE, pode aumentar os níveis sanguíneos de lítio, quando administrado de forma conjunta. Com a administração de cetorolaco e metotrexato, pode diminuir a depuração do metotrexato e aumentar sua concentração plasmática. Devido à ação do cetorolaco sobre a agregação plaquetária, não é conveniente sua associação com heparina ou anticoagulantes orais.

Contra-indicações

Hipersensibilidade ao cetorolaco. Gravidez, parto e lactação. Menores de 16 anos. Insuficiência hepática grave. Insuficiência renal ou creatininemia superior a 5mg%. Úlcera gastroduodenal em evolução ou antecedentes de úlcera ou hemorragia digestiva. Pacientes com suspeita ou confirmação de hemorragia cerebrovascular, diátese hemorrágica ou anomalias da hemostasia. Pacientes com hipovolemia ou desidratação aguda. Síndrome de polipo nasal parcial ou completo, angiodema, reação broncospástica à aspirina ou outro antiinflamatório não esteróide.

Referência Bibliográfica

P.R. Vade-mécum 2004/2005