Ацекардол



Код АТХ:

- B01AC06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ацетилсалициловая кислота

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

◊ ***Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой*** белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - один слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
ацетилсалициловая кислота	50 мг

Вспомогательные вещества: повидон низкомолекулярный - 3.3 мг, крахмал кукурузный - 17 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг, магния стеарат - 1 мг, тальк - 3 мг, лактозы моногидрат - до 95 мг.

Состав кишечнорастворимой оболочки: целлацефат - 4 мг, титана диоксид - 0.5 мг, касторовое масло - 0.5 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

◊ ***Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой*** белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - один слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
ацетилсалициловая кислота	100 мг

Вспомогательные вещества: повидон низкомолекулярный - 6.6 мг, крахмал кукурузный - 34 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, магния стеарат - 2 мг, тальк - 6 мг, лактозы моногидрат - до 190 мг.

Состав кишечнорастворимой оболочки: целлацефат - 8 мг, титана диоксид - 1 мг, касторовое масло - 1 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

◊ ***Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой*** белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - один слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
ацетилсалициловая кислота	300 мг

Вспомогательные вещества: повидон низкомолекулярный - 19.8 мг, крахмал кукурузный - 102 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 60 мг, магния стеарат - 6 мг, тальк - 18 мг, лактозы моногидрат - до 570 мг.

Состав кишечнорастворимой оболочки: целлацефат - 24 мг, титана диоксид - 3 мг, касторовое масло - 3 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

В основе механизма антиагрегантного действия ацетилсалициловой кислоты (АСК) лежит необратимое ингибирование циклооксигеназы (ЦОГ-1), в результате чего блокируется синтез тромбоксана A_2 и подавляется агрегация тромбоцитов. Антиагрегантный эффект развивается даже после применения малых доз препарата и сохраняется в течение 7 суток после однократного приема. Считается, что АСК имеет и другие механизмы подавления агрегации тромбоцитов.

В высоких дозах АСК (свыше 300 мг/сут) также оказывает противовоспалительное, жаропонижающее и анальгезирующее действие.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь АСК быстро и полностью всасывается из ЖКТ. АСК частично метаболизируется во время абсорбции. Во время и после всасывания АСК превращается в главный метаболит – салициловую кислоту, которая метаболизируется, главным образом, в печени под влиянием ферментов с образованием таких метаболитов, как фенилсалицилат, салициловой кислоты глюкуронид и салицилуровая кислота, обнаруживаемых во многих тканях и в моче. У женщин процесс метаболизма проходит медленнее (меньшая активность ферментов в сыворотке крови).

C_{max} АСК в плазме крови достигается через 10-20 мин после приема внутрь, C_{max} салициловой кислоты – через 0.3-2 ч.

Вследствие того, что таблетки покрыты кислотоустойчивой оболочкой, АСК высвобождается не в желудке (оболочка эффективно блокирует растворение препарата в желудке), а в щелочной среде двенадцатиперстной кишки. Таким образом, абсорбция АСК в форме таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой, замедлена на 3-6 ч по сравнению с обычными (без такой оболочки) таблетками.

Распределение

АСК и салициловая кислота связываются с белками плазмы крови (от 66% до 98% в зависимости от дозы) и быстро распределяются в организме. Салициловая кислота проникает через плаценту и в грудное молоко.

Выведение

Выведение салициловой кислоты является дозозависимым, поскольку ее метаболизм ограничен возможностями ферментативной системы. $T_{1/2}$ составляет от 2-3 ч при применении АСК в низких дозах и до 15 ч при применении препарата в высоких дозах (обычные дозы АСК в качестве анальгезирующего и жаропонижающего средства). В отличие от других салицилатов, при многократном приеме препарата негидролизированная АСК не накапливается в сыворотке крови. Салициловая кислота и ее метаболиты выводятся почками. У пациентов с нормальной функцией почек 80-100% разовой дозы препарата выводится почками в течение 24-72 ч.

Показания к применению:

— профилактика острого инфаркта миокарда при наличии факторов риска (например, сахарный диабет, гиперлипидемия, артериальная гипертензия, ожирение, курение, пожилой возраст);

— профилактика повторного инфаркта миокарда;

— нестабильная стенокардия;

— профилактика ишемического инсульта (в т.ч. у пациентов с преходящим нарушением мозгового кровообращения);

— профилактика тромбоэмболии после операций и инвазивных вмешательств на сосудах (например, аортокоронарное шунтирование, эндартерэктомия сонных артерий, артериовенозное шунтирование, ангиопластика и стентирование коронарных артерий, ангиопластика сонных артерий);

— профилактика тромбоза глубоких вен и тромбоэмболии легочной артерии и ее ветвей (в т.ч. при длительной иммобилизации в результате обширного хирургического вмешательства).

Относится к болезням:

- Ангина
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Инсульт
- Миокардит
- Ожирение
- Сахарный диабет
- Стенокардия
- Тромбоз
- Тромбоэмболия

Противопоказания:

— эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения);

— желудочно-кишечное кровотечение;

— геморрагический диатез;

— бронхиальная астма, индуцированная приемом салицилатов, полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости АСК;

— выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин);

— выраженная печеночная недостаточность (класс В и С по шкале Чайлд-Пью);

— хроническая сердечная недостаточность (III-IV функционального класса по классификации NYHA);

— одновременный прием метотрексата в дозе 15 мг/неделю и более;

— I и III триместры беременности;

— период лактации;

— детский возраст до 18 лет;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к АСК.

С *осторожностью* при*:*

— подагре, гиперурикемии, т.к. АСК в низких дозах снижает экскрецию мочевой кислоты; следует иметь в виду, что АСК в низких дозах может спровоцировать развитие подагры у предрасположенных пациентов (имеющих сниженную экскрецию мочевой кислоты);

— язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки или желудочно-кишечных кровотечениях (в анамнезе);

— нарушении функции печени (класс А по шкале Чайлд-Пью);

— нарушении функции почек (КК более 30 мл/мин);

— бронхиальной астме, хронических заболеваниях органов дыхания, сенной лихорадке, полипозе носа, лекарственной аллергии;

— одновременном приеме метотрексата в дозе менее 15 мг/неделю;

— сопутствующей терапии антикоагулянтами;

— II триместр беременности;

— предполагаемом хирургическом вмешательстве (включая небольшие, например, экстракцию зуба), т.к. АСК может вызывать склонность к развитию кровотечений в течение нескольких дней после приема препарата.

Способ применения и дозы:

Таблетки следует принимать перед едой, запивая большим количеством жидкости, 1 раз/сут. Ацекардол предназначен для длительного применения. Длительность терапии определяется врачом.

Профилактика при подозрении острого инфаркта миокарда: 100 мг/сут ежедневно или 300 мг через день (первую таблетку необходимо разжевать для более быстрого всасывания).

Профилактика впервые возникшего острого инфаркта миокарда при наличии факторов риска: 100 мг/сут ежедневно или 300 мг через день.

Профилактика повторного инфаркта миокарда и нестабильная стенокардия: 100-300 мг/сут ежедневно.

Профилактика ишемического инсульта и преходящего нарушения мозгового кровообращения: 100-300 мг/сут ежедневно.

Профилактика тромбоэмболии после операций и инвазивных вмешательств на сосудах: 100-300 мг/сут ежедневно.

Профилактика тромбоза глубоких вен и тромбоэмболии легочной артерии и ее ветвей: 100 мг/сут или 300 мг через день.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, изжога, рвота, боли в животе; язвы слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки; перфоративные язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, желудочно-кишечные кровотечения, преходящие нарушения функции печени с повышением активности печеночных трансаминаз.

Со стороны системы кроветворения: назначение АСК сопровождается повышенным риском кровотечений вследствие ингибирующего действия АСК на агрегацию тромбоцитов, анемия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, отек Квинке, ринит, отек слизистой оболочки носа, кардиореспираторный дистресс-синдром, а также тяжелые реакции, включая анафилактический шок.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм.

Со стороны ЦНС: головокружение, снижение слуха, головная боль, шум в ушах.

Передозировка:

Передозировка маловероятна вследствие низкого содержания АСК в препарате. Превышение дозы АСК сопряжено с риском желудочно-кишечного кровотечения. Передозировка особенно опасна у пациентов пожилого возраста.

Симптомы передозировки от легкой до средней степени тяжести: головокружение, шум в ушах, ухудшение слуха, повышенное потоотделение (в т.ч. профузное), тошнота, рвота, головная боль, спутанность сознания, тахипноэ, гипервентиляция, респираторный алкалоз.

Лечение: желудочный лаваж, многократный прием активированного угля, форсированный щелочной диурез, восстановление водно-электролитного баланса и кислотно-основного состояния.

Симптомы передозировки от средней до тяжелой степени:

— респираторный алкалоз с компенсаторным метаболическим ацидозом;

— гиперпирексия (крайне высокая температура тела);

— нарушения дыхания: гипервентиляция, некардиогенный отек легких, угнетение дыхания, асфиксия;

— нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: нарушения ритма сердца, снижение АД, угнетение сердечной деятельности;

— нарушения водно-электролитного баланса: дегидратация, нарушение функции почек от олигурии вплоть до развития почечной недостаточности, характеризующееся гипокалиемией, гипернатриемией, гипонатриемией;

— нарушение метаболизма глюкозы: гипергликемия, гипогликемия (особенно у детей), кетоацидоз;

— шум в ушах, глухота;

— желудочно-кишечные кровотечения;

— гематологические нарушения: от ингибирования агрегации тромбоцитов до коагулопатии, удлинение протромбинового времени, гипопротромбинемия;

— неврологические нарушения: токсическая энцефалопатия и угнетение функции ЦНС (сонливость, спутанность сознания, кома, судороги).

Лечение: немедленная госпитализация в специализированные отделения для проведения экстренной терапии - желудочный лаваж, многократный прием активированного угля, форсированный щелочной диурез, гемодиализ, восстановление водно-электролитного баланса и кислотно-основного состояния, симптоматическая терапия. При проведении щелочного диуреза необходимо добиться значений pH между 7.5 и 8. Форсированный щелочной диурез следует проводить, когда концентрация салицилатов в плазме составляет более 500 мг/л (3.6 ммоль/л) у взрослых и 300 мг/л (2.2 ммоль/л) у детей.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение салицилатов в больших дозах в первые 3 месяца беременности ассоциируется с повышенной частотой дефектов развития плода (расщепленное небо, пороки сердца). Назначение салицилатов в I триместре беременности противопоказано.

Во II триместре беременности салицилаты можно назначать только с учетом строгой оценки риска для плода и пользы для матери, предпочтительно в дозах не выше 150 мг/сут и непродолжительно.

В III триместре беременности салицилаты в высокой дозе (более 300 мг/сут) вызывают ослабление родовой деятельности, преждевременное закрытие артериального протока у плода, повышенную кровоточивость у матери и плода, а назначение непосредственно перед родами может вызвать внутричерепные кровоизлияния, особенно у недоношенных детей. Назначение салицилатов в III триместре беременности противопоказано.

Салицилаты и их метаболиты в небольших количествах проникают в грудное молоко, поэтому в период лактации следует отменить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

АСК при одновременном применении усиливает действие следующих лекарственных средств:

— метотрексата за счет снижения почечного клиренса и вытеснения его из связи с белками плазмы; также сочетание ацетилсалициловой кислоты с метотрексатом сопровождается повышенной частотой развития побочных эффектов со стороны органов кроветворения;

— гепарина и непрямых антикоагулянтов за счет нарушения функции тромбоцитов и вытеснения непрямых антикоагулянтов из связи с белками плазмы;

— тромболитических средств и антиагрегантов;

— дигоксина вследствие снижения его почечной экскреции;

— гипогликемических средств (инсулина и производных сульфонилмочевины) за счет гипогликемических свойств самой АСК в высоких дозах и вытеснения производных сульфонилмочевины из связи с белками плазмы;

— вальпроевой кислоты за счет вытеснения ее из связи с белками плазмы.

Сочетание АСК с антикоагулянтами, тромболитиками и антиагрегантами сопровождается повышенным риском развития кровотечения.

При одновременном приеме АСК с алкоголем наблюдается усиление токсического действия алкоголя на центральную нервную систему, повышается риск повреждения слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и удлинения времени кровотечения.

АСК при одновременном применении ослабляет действие следующих лекарственных средств:

— урикозурических препаратов - бензбромарона (снижение урикозурического эффекта вследствие конкурентного подавления почечной канальцевой экскреции мочевой кислоты);

— ингибиторов АПФ (отмечается дозозависимое снижение скорости клубочковой фильтрации в результате ингибирования простагландинов, обладающих сосудорасширяющим действием, и соответственно наблюдается ослабление гипотензивного действия);

— диуретиков (при совместном применении с АСК в высоких дозах отмечается снижение скорости клубочковой фильтрации в результате снижения синтеза простагландинов в почках).

Усиливая элиминацию салицилатов, системные ГКС ослабляют их действие.

Особые указания и меры предосторожности:

АСК может провоцировать бронхоспазм, а также вызывать приступы бронхиальной астмы и другие реакции повышенной чувствительности. Факторами риска являются наличие бронхиальной астмы в анамнезе, сенной лихорадки, полипоза носа, хронических заболеваний дыхательной системы, а также аллергических реакций на другие препараты (например, кожные реакции, зуд, крапивница).

Ингибирующее действие АСК на агрегацию тромбоцитов сохраняется в течение нескольких дней после приема, в связи с чем возможно повышение риска кровотечений в ходе оперативного вмешательства или в послеоперационном периоде. При необходимости абсолютного исключения кровоточивости в ходе оперативного вмешательства необходимо, по возможности, полностью отказаться от применения АСК в предоперационном периоде.

АСК в низких дозах может спровоцировать развитие подагры у предрасположенных лиц (имеющих сниженную экскрецию мочевой кислоты).

При сочетанном применении ГКС и салицилатов следует помнить, что во время лечения концентрация салицилатов в крови снижена, а после отмены ГКС возможна передозировка салицилатов.

Превышение дозы АСК сопряжено с риском желудочно-кишечного кровотечения.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время приема препарата Ацекардол следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами, механизмами и при выполнении других потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженной почечной недостаточности (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин).

С осторожностью при нарушении функции почек (КК более 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженной печеночной недостаточности (класс В и С по шкале Чайлд-Пью).

С осторожностью при нарушении функции печени (класс А по шкале Чайлд-Пью).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

Источник: http://drugs.thead.ru/Acekardol