Ангиокс



Код АТХ:

- B01AE06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бивалирудин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Гематотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный прямой ингибитор тромбина. Связывается с каталитическим участком тромбина, а также с анион-связывающим участком как свободного, так и связанного с фибрином тромбина. Тромбин играет главную роль в процессе тромбообразования, расщепляя фибриноген с образованием мономеров фибрина и активируя фактор свертывания XIII с образованием активного фактора свертывания XIIIa, который способствует образованию ковалентных поперечных связей между молекулами фибрина, что приводит к образованию устойчивого тромба. Тромбин также активирует факторы свертывания V и VIII, способствуя дальнейшему образованию тромбина, и активирует тромбоциты, стимулируя агрегацию и высвобождение гранул. Бивалирудин ингибирует каждый из этих эффектов тромбина.

При в/в введении бивалирудин вызывает измеряемое антикоагулянтное действие уже через несколько минут.

Связывание бивалирудина с тромбином является обратимым.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры носят линейный характер.

Биодоступность бивалирудина при в/в введении полная. Бивалирудин быстро распределяется между плазмой и внеклеточной жидкостью. Vd в равновесном состоянии составляет 0.1 л/кг. Бивалирудин не связывается с белками плазмы крови (за исключением тромбина) или с эритроцитами. Метаболизируется под действием протеаз, включая тромбин. $T_{1/2}$ составляет 35-40 мин. Около 20% бивалирудина выводится в неизмененном виде с мочой.

Фармакокинетика бивалирудина у пациентов с нарушенной функцией печени не изучалась, но предполагается, что она не изменяется, поскольку бивалирудин не метаболизируется при участии печеночных ферментов. Системный клиренс бивалирудина снижается в зависимости от скорости клубочковой фильтрации. Бивалирудин подвергается

гемодиализу.

Показания к применению:

В качестве антикоагулянта при проведении чрескожного транслюминального коронарного вмешательства (ЧТКВ), в т.ч. при выполнении первичного ЧТКВ у пациентов с острым инфарктом миокарда с подъемом сегмента ST на ЭКГ.

При нестабильной стенокардии или остром инфаркте миокарда без повышения сегмента ST при показаниях для проведения срочного или раннего ЧТКВ.

Относится к болезням:

- Миокардит
- Стенокардия

Противопоказания:

— активное кровотечение или повышенный риск кровотечения из-за врожденных или приобретенных нарушений гемостаза;

— тяжелая неконтролируемая артериальная гипертензия;

— подострый бактериальный эндокардит;

— почечная недостаточность тяжелой степени (СКФ< 30 мл/мин), в т.ч. у пациентов, находящихся на диализе;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к бивалирудину;

— повышенная чувствительность к гирудину (к пиявкам);

Способ применения и дозы:

Вводят в/в струйно или капельно. Не вводить в/м.

При проведении ЧТКВ вводят в/в струйно в дозе 750 мкг/кг с последующим немедленным продолжением инфузии со скоростью 1.75 мг/кг/ч до окончания процедуры. При необходимости введение бивалирудина в этой же дозе может продолжаться еще в течение 4 ч после окончания ЧТКВ, а затем в последующие 4-12 ч – в дозе 250 мкг/кг/ч. После проведения ЧТКВ пациенты должны находиться под постоянным наблюдением для своевременного выявления симптомов ишемии миокарда.

При нестабильной стенокардии или остром инфаркте миокарда без повышения сегмента ST бивалирудин вводят в/в струйно в дозе 100 мкг/кг с последующей немедленной инфузией в дозе 250 мкг/кг/ч в течение не более 72 ч.

В случае планируемого ЧТКВ перед процедурой дополнительно струйно вводят бивалирудин в дозе 500 мкг/кг с последующей инфузией в дозе 1.75 мг/кг/ч до окончания процедуры. После окончания ЧТКВ введение можно продолжать в течение последующих 4-12 ч в дозе 250 мкг/кг/ч.

У пациентов с нарушением функции почек дозу/скорость инфузии необходимо корректировать.

Бивалирудин можно вводить через 30 мин после окончания в/в инфузии нефракционированного гепарина или через 8 ч после п/к инъекции низкомолекулярного гепарина.

Побочное действие:

Со стороны свертывающей системы крови: очень часто – незначительные кровотечения различной локализации, кровотечение в месте пункции сосуда, гематома в месте пункции с диаметром < 5 см; часто – значительные кровотечения различной локализации (включая случаи с летальным исходом), тромбоз (включая случаи с летальным исходом), тромбоз коронарного стента (включая случаи с летальным исходом), незначительные кровотечения, кровоподтек; нечасто – гематома в месте пункции с диаметром > 5 см, повышение МНО, внутричерепное кровотечение, тромбоз коронарных артерий, перикардиальное кровотечение, забрюшинное кровотечение, рвота кровью, желудочно-кишечное кровотечение, мелена, кровоточивость десен, легочное кровотечение, глоточное кровотечение, кровохарканье, носовое кровотечение; редко – кровотечение из уха, эзофагеальное кровотечение,

внутрибрюшинное кровотечение, забрюшинная гематома

Со стороны системы кроветворения: нечасто – тромбоцитопения, анемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто – стенокардия, желудочковая тахикардия, брадикардия, снижение АД, сосудистые аномалии; редко – сосудистая псевдоаневризма.

Аллергические реакции: реакции редко – крапивница, сыпь, анафилактические реакции и шок.

Прочие: нечасто – тошнота, одышка, гематурия, головная боль, боль в груди, боль в спине, боль в паховой области, боль в месте инъекции, реперфузионное повреждение (замедленный реперфузионный кровоток или его отсутствие); редко – реакции в месте введения.

Передозировка:

Известного антидота в отношении бивалирудина не существует, но его эффект быстро исчезает ($T_{1/2}$ составляет 35-40 мин).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не следует применять бивалирудин при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) за исключением случаев, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает возможный риск для плода или грудного ребенка.

Неизвестно, выделяется ли бивалирудин с грудным молоком у человека.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Комбинированное применение бивалирудина с антиагрегантами может сопровождаться повышением риска геморрагических осложнений.

Особые указания и меры предосторожности:

Бивалирудин рекомендуется применять одновременно с ацетилсалициловой кислотой и клопидогрелом.

С осторожностью следует применять бивалирудин при проведении бетабрахиотерапии, учитывая случаи тромбообразования при проведении гаммабрахиотерапии.

Эффективность и безопасность исключительно струйного введения бивалирудина не изучена, поэтому не рекомендуется даже для кратковременных процедур ЧТКВ.

Не вводить в/м.

При появлении симптомов кровотечения введение бивалирудина необходимо прекратить.

При нарушениях функции почек

Противопоказано: почечная недостаточность тяжелой степени (СКФ< 30 мл/мин), в т.ч. у пациентов, находящихся на диализе.

У пациентов с нарушением функции почек дозу/скорость инфузии необходимо корректировать.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет;

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