

Клопирел



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#) [Википедия](#)
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от розового до розовато-оранжевого цвета, круглые, гладкие, двояковыпуклые; на поперечном разрезе ядро от белого до почти белого цвета.

	1 таб.
клопидогрела гидросульфат	97.875 мг,
что соответствует содержанию клопидогрела	75 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 30 мг, лактозы моногидрат - 27.096 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 77.125 мг, метилпарагидроксибензоат натрия - 0.425 мг, тальк - 3.6 мг, магния стеарат - 7 мг, макрогол 6000 - 7 мг, кремния диоксид коллоидный - 2 мг.

Состав оболочки: этилцеллюлоза - 0.27 мг, касторовое масло - 0.6 мг, титана диоксид - 0.6 мг, краситель оксид железа красный - 0.75 мг, тальк - 0.36 мг, краситель оксид железа желтый - 0.2 мг.

10 шт. - блистеры из Полиамид/Алюминия/ПВХ-Алюминия (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры из Полиамид/Алюминия/ПВХ-Алюминия (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор агрегации тромбоцитов. Селективно ингибирует связывание аденозиндифосфата (АДФ) с рецепторами тромбоцитов и активацию комплекса GPIIb/IIIa, угнетая, таким образом, агрегацию тромбоцитов. Также ингибирует агрегацию тромбоцитов, вызванную другими агонистами, путем блокады повышения активности тромбоцитов освобожденным АДФ. Не влияет на активность ФДЭ.

Клопидогрел необратимо изменяет рецепторы АДФ на тромбоцитах, поэтому тромбоциты остаются нефункциональными на протяжении всей "жизни", а восстановление нормальной функции происходит по мере их обновления (приблизительно через 7 дней).

Фармакокинетика

После приема внутрь в дозе 75 мг клопидогрел быстро абсорбируется из ЖКТ. Однако концентрация в плазме крови повышается незначительно и через 2 ч после приема не достигает уровня, поддающегося определению (0.025 мкг/л).

Интенсивно метаболизируется в печени. Основной метаболит является неактивным производным карбоксилевой кислоты и составляет около 85% циркулирующего в плазме исходного вещества. C_{max} данного метаболита в плазме крови после повторных приемов клопидогрела составляет около 3 мг/л и наблюдается приблизительно через 1 ч после приема.

Фармакокинетика основного метаболита характеризуется линейной зависимостью в диапазоне доз клопидогрела 50-150 мг.

Клопидогрел и основной метаболит необратимо связываются с белками плазмы крови *in vitro* (98% и 94% соответственно). Данная связь остается ненасыщаемой *in vitro* в широких пределах концентраций.

После приема внутрь ¹⁴C-меченного клопидогрела около 50% принятой дозы выделяется с мочой и приблизительно 46% с калом в течение 120 ч. T_{1/2} основного метаболита составляет 8 ч.

По сравнению с здоровыми добровольцами молодого возраста концентрация в плазме крови основного метаболита значительно выше у пожилых пациентов (в возрасте 75 лет и старше), при этом не отмечается изменений агрегации тромбоцитов и времени кровотечения.

При тяжелых заболеваниях почек (КК 5-15 мл/мин) концентрации основного метаболита в плазме крови более низкие, чем при заболеваниях почек средней тяжести (КК 30-60 мл/мин) и у здоровых добровольцев. Хотя ингибирующий эффект на АДФ-индуцированную агрегацию тромбоцитов уменьшался по сравнению с таковым у здоровых добровольцев, время кровотечения увеличивалось в такой же степени, как и у здоровых добровольцев.

Показания к применению:

Профилактика тромботических осложнений у пациентов с инфарктом миокарда, ишемическим инсультом или окклюзией периферических артерий. В комбинации с ацетилсалициловой кислотой для профилактики тромботических осложнений при остром коронарном синдроме: с подъемом сегмента ST при возможности проведения тромболитической терапии; без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия, инфаркт миокарда без зубца Q), в т.ч. у пациентов, подвергающихся стентированию.

Профилактика тромботических и тромбоэмболических осложнений, включая инсульт, при фибрилляции предсердий (мерцательной аритмии) при наличии, как минимум, одного фактора риска развития сосудистых осложнений, отсутствии возможности приема непрямых антикоагулянтов и наличии низкого риска развития кровотечения (в комбинации с ацетилсалициловой кислотой).

Относится к болезням:

- [Аритмия](#)
- [Инсульт](#)
- [Инфаркт миокарда](#)
- [Ишемический инсульт](#)
- [Миокардит](#)
- [Окклюзия](#)
- [Стенокардия](#)
- [Тромбоз](#)
- [Тромбоэмболия](#)
- [Фибрилляция предсердий](#)
- [Фиброз](#)

Противопоказания:

Острое кровотечение (в т.ч. при пептической язве или внутричерепное кровоизлияние), тяжелая печеночная недостаточность, беременность, период лактации (грудное вскармливание), детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к клопидогрелу.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь 1 раз/сут.

Начальная и поддерживающая доза - 75 мг/сут. Нагрузочная доза - 300 мг/сут.

Схема применения зависит от показаний и клинической ситуации.

Побочное действие:

Со стороны свертывающей системы крови: часто - кровотечения; нечасто - увеличение времени кровотечения.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - желудочно-кишечное кровотечение, диарея, боли в животе, диспепсия; нечасто - язва желудка и двенадцатиперстной кишки, рвота, тошнота, запор, вздутие живота; редко - забрюшинное кровоизлияние; очень редко - желудочно-кишечное кровотечение и забрюшинное кровоизлияние со смертельным исходом, панкреатит, колит (включая неспецифический язвенный колит или лимфоцитарный колит), стоматит, острая печеночная недостаточность, гепатит, отклонение от нормы показателей функции печени.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - тромбоцитопения, лейкопения, эозинофилия; редко - нейтропения, включая тяжелую нейтропению; очень редко - тромбоцитарная тромбоцитопеническая пурпура, апластическая анемия, панцитопения, агранулоцитоз, тяжелая тромбоцитопения, гранулоцитопения, анемия.

Со стороны нервной системы: нечасто - внутричерепное кровоизлияние (было сообщено о нескольких случаях со смертельным исходом), головная боль, парестезия, головокружение; очень редко - нарушения вкусового восприятия, галлюцинации, спутанность сознания.

Со стороны органов чувств: нечасто - глазные кровоизлияния (конъюнктивальные, в ткани и сетчатку глаза); редко - вертиго.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - васкулит, снижение АД.

Со стороны дыхательной системы: часто - носовое кровотечение; очень редко - кровотечение из дыхательных путей (кровохарканье, легочное кровотечение), бронхоспазм, интерстициальная пневмония.

Со стороны иммунной системы: очень редко - сывороточная болезнь, анафилактические реакции.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - подкожные кровоподтеки; нечасто - сыпь, зуд, пурпура (подкожное кровоизлияние); очень редко - буллезный дерматит (токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона, многоформная эритема) ангионевротический отек, эритематозная сыпь, крапивница, экзема, плоский лишай.

Со стороны костно-мышечной системы: очень редко - кровоизлияния в мышцы и суставы, артрит, артралгия, миалгия.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - гематурия; очень редко - гломерулонефрит, увеличение концентрации креатина в крови.

Прочие: часто - кровотечение из места пунктирования сосудов; очень редко - лихорадка.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения клопидогрела при беременности не проводилось. Применение возможно только в случаях крайней необходимости.

Неизвестно, выделяется ли клопидогрел с грудным молоком у человека. При необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

В экспериментальных исследованиях на животных при применении клопидогрела в дозах 300-500 мг/кг/сут не выявлено тератогенного действия и отрицательного влияния на фертильность и на развитие плода. Установлено, что клопидогрел и его метаболиты выделяются с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с НПВС (в т.ч. напроксеном) повышается риск возникновения желудочно-кишечных кровотечений.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой возможно усиление антиагрегантного действия.

Поскольку клопидогрел может ингибировать активность изофермента CYP2C9, при одновременном применении с препаратами, метаболизирующимися при участии данного изофермента (в т.ч. с фенитоином, толбутамином) нельзя исключить повышение их концентраций в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Диагнозы

- Бессонница
- Болезнь Альцгеймера
- Болезнь Паркинсона (паркинсонизм)

Клопирел

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

- Боли в спине

Источник: <http://drugs.thead.ru/Klopirel>