Лопирел



Код АТХ:

- B01AC04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Клопидогрел

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 пленочной оболочкой розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "I" на одной стороне.

	1 таб.
клопидогрела гидросульфат	97.87 мг,
что эквивалентно содержанию клопидогрела основания	75 мг

Вспомогательные вещества: лактоза - 78.13 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 68.75 мг, кросповидон (типа А) - 13.75 мг, глицерил дибегенат - 8.25 мг, тальк - 8.25 мг, Opadry II 85 G34669 розовый ~ 8.25 мг (поливиниловый спирт - 3.63 мг, тальк - 1.65 мг, титана диоксид (Е171) - 1.63 мг, макрогол 3350 - 1.02 мг, лецитин (Е322) - 0.29 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.03 мг).

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гематотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиагрегантный препарат, специфический и активный ингибитор агрегации тромбоцитов. Оказывает коронародилатирующее действие. Избирательно уменьшает связывание АДФ с рецепторами на тромбоцитах и активацию рецепторов GPIIb/IIIa под действием АДФ, уменьшая, таким образом, агрегацию тромбоцитов. Уменьшает агрегацию тромбоцитов, вызванную другими агонистами, предотвращая их активацию освобожденным АДФ, не влияет на активность ФДЭ. Необратимо связывается с АДФ-рецепторами тромбоцитов, которые остаются невосприимчивыми к стимуляции АДФ на протяжении жизненного цикла (около 7 дней).

Торможение агрегации тромбоцитов наблюдается через 2 ч после приема (40% ингибирование) начальной дозы 400 мг. Максимальный эффект (60% подавление агрегации) развивается через 4-7 дней постоянного приема в дозе 50-100 мг/сут. Антиагрегантный эффект сохраняется весь период жизни тромбоцитов (7-10 дней).

При наличии атеросклеротического поражения сосуда препятствует развитию атеротромбоза независимо от локализации сосудистого процесса (цереброваскулярные, кардиоваскулярные или периферические поражения).

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция высокая, биодоступность высокая; концентрация в плазме низкая и через 2 ч после приема не достигает предела измерения (0.025 мкг/л).

Распределение

Связывание с белками плазмы - 94-98%.

Метаболизм

Метаболизируется в печени. Основной метаболит - неактивное производное карбоксиловой кислоты. После приема внутрь в повторных дозах 75 мг C_{max} метаболита в плазме крови составляет около 3 мг/л и достигается через 1 ч.

Выведение

Выводится почками – 50%, через кишечник - 46% (в течение 120 ч после введения). $T_{1/2}$ основного метаболита после разового и повторного приема составляет 8 ч. Концентрации выделяемых почками метаболитов - 50%.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

После приема препарата в дозе 75 мг/сут концентрация основного метаболита в плазме ниже у пациентов с тяжелыми заболеваниями почек (КК 5-15 мл/мин), по сравнению с пациентами с заболеваниями почек средней тяжести (КК от 30 до 60 мл/мин) и здоровыми лицами.

Показания к применению:

Профилактика атеротромбоза:

— у пациентов, перенесших инфаркт миокарда, ишемический инсульт, или с диагностированным заболеванием периферических артерий;

— у пациентов с острым коронарным синдромом без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия или инфаркт миокарда без зубца Q на ЭКГ), в комбинации с ацетилсалициловой кислотой, включая пациентов, у которых было проведено стентирование при чрескожном коронарном вмешательстве;

— у пациентов с острым коронарным синдромом с подъемом сегмента ST (острый инфаркт миокарда) в комбинации с ацетилсалициловой кислотой, получающих медикаментозное лечение с возможным применением тромболитической терапии.

Относится к болезням:

- Инсульт
- Инфаркт миокарда
- Ишемический инсульт
- Миокардит
- Стенокардия
- Тромбоз

Противопоказания:

— тяжелая печеночная недостаточность;

— геморрагический синдром;

— острое кровотечение (в т.ч. внутричерепное кровоизлияние) и заболевания, предрасполагающие к его развитию (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, неспецифический язвенный колит, туберкулез, опухоли легких, гиперфибринолиз);

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— неонатальный период;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— непереносимость галактозы, лактазная недостаточность или мальабсорбция глюкозы-галактозы (т.к. в состав препарата входит лактоза);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с умеренной печеночной и/или почечной недостаточностью, при травмах, в предоперационном периоде; одновременно с ацетилсалициловой кислотой, НПВС (включая ингибиторы ЦОГ-2), варфарином, тромболитическими средствами, гепарином, ингибиторами гликопротеина IIb/IIIa.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Пациентам, перенесшим инфаркт миокарда, ишемический инсульт, или с диагностированным заболеванием периферических артерий препарат назначают по 75 мг 1 раз/сут. Лечение следует начинать с первых дней до 35 дня у пациентов после инфаркта миокарда и от 7 дней до 6 месяцев - у пациентов после ишемического инсульта.

При *остром коронарном синдроме без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия, инфаркт миокарда без зубца Q на ЭКГ), включая пациентов, у которых было проведено стентирование при чрескожном коронарном вмешательстве,* лечение Лопирелом следует начать с однократного приема нагрузочной дозы 300 мг, а затем продолжать в дозе 75 мг 1 раз/сут (в сочетании с ацетилсалициловой кислотой). Поскольку применение ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах связано с увеличение риска кровотечений, рекомендуемая при этом показании доза ацетилсалициловой кислоты не превышает 100 мг. Максимальный благоприятный эффект наблюдается к 3 месяцу лечения. Курс лечения - до 1 года.

Пациентам с острым коронарным синдромом с подъемом сегмента ST (острый инфаркт миокарда) в комбинации с ацетилсалициловой кислотой, получающим медикаментозное лечение с возможным применением тромболитической терапии, Лопирел назначают однократно в дозе 75 мг 1 раз/сут с первоначальным однократным приемом нагрузочной дозы в комбинации с ацетилсалициловой кислотой и тромболитиками (или без тромболитиков). Комбинированную терапию начинают как можно раньше после появления симптомов и продолжают в течение, по крайней мере, 4 недель. У **пациентов старше 75 лет** лечение Лопирелом следует начинать без приема нагрузочной дозы.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: часто (>1/100, <1/10), иногда (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000).

Со стороны ЦНС: иногда - головная боль, головокружение, парестезия; очень редко - спутанность сознания, галлюцинации, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, боль в животе, диарея; иногда - тошнота, гастрит, метеоризм, запор, рвота, язва желудка и двенадцатиперстной кишки; очень редко - колит (в т.ч. язвенный или лимфоцитарный), панкреатит.

Со стороны гепато-билиарной системы: очень редко - гепатит, повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны системы кроветворения: иногда - лейкопения, уменьшение количества нейтрофильных и эозинофильных гранулоцитов, снижение количества тромбоцитов; очень редко - тяжелая тромбоцитопения (количество тромбоцитов $\leq 30 \times 10^9$/л), гранулоцитопения, агранулоцитоз, анемия и апластическая анемия/панцитопения.

Со стороны свертывающей системы крови: иногда - увеличение времени кровотечения; очень редко - тромботическая тромбоцитопеническая пурпура (1 случай на 200 000 больных); часто - кровотечения различной локализации и интенсивности. Большинство случаев кровотечения отмечали в течение 1-го месяца лечения (особенно внутричерепные, желудочно-кишечные и ретроперитонеальные кровотечения); тяжелые случаи кожных кровотечений (пурпура), кровоизлияния в суставы и мягкие ткани (гемартроз, гематома), глазные кровотечения (конъюнктивальные, окулярные, ретинальные), носовые кровотечения, из респираторного тракта (кровохарканье, легочное кровотечение), гематурия и кровотечения из операционной раны.

Дерматологические реакции: иногда - сыпь и зуд; очень редко - буллезная сыпь (многоформная эритема), эритематозная сыпь, плоский лишай.

Аллергические реакции: очень редко - крапивница, анафилактоидные реакции.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - васкулит, артериальная гипотензия.

Со стороны дыхательной системы: очень редко - бронхоспазм.

Со стороны костно-мышечной системы: очень редко - артралгия, артрит.

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - гломерулонефрит, повышение уровня креатинина в сыворотке крови.

Прочие: очень редко - лихорадка.

Передозировка:

Симптомы: возможно увеличение времени кровотечения.

Лечение: при необходимости быстрой коррекции увеличенного времени кровотечения эффект клопидогрела может быть устранен переливанием тромбоцитарной массы. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении клопидогрела с варфарином возможно усиление интенсивности кровотечения (данная комбинация не рекомендуется).

Ацетилсалициловая кислота не изменяет ингибирующий эффект клопидогрела на АДФ-индуцированную агрегацию тромбоцитов, однако клопидогрел потенцирует действие ацетилсалициловой кислоты на агрегацию тромбоцитов, индуцированную коллагеном. Тем не менее, одновременное применение ацетилсалициловой кислоты в дозе 500 мг 2 раза/сут не вызывало никакого значимого увеличения времени кровотечения, удлиненного вследствие приема клопидогрела. Безопасность длительного одновременного применения ацетилсалициловой кислоты и клопидогрела не установлена, однако клопидогрел и ацетилсалициловую кислоту можно применять одновременно до одного года.

По данным клинического исследования, проведенного на здоровых добровольцах, одновременное применение клопидогрела и гепарина не требует коррекции дозы последнего и не влияет на антиагрегантное действие клопидогрела, однако безопасность такой комбинации еще не установлена (при данной комбинации требуется осторожность).

Безопасность одновременного применения клопидогрела с тромболитиками в настоящее время не установлена (при данной комбинации требуется осторожность).

В клиническом исследовании, проведенном с участием здоровых добровольцев, при совместном применении клопидогрела и напроксена наблюдалось увеличение количества скрытых желудочно-кишечных кровотечений. Однако из-за отсутствия клинических исследований взаимодействия препарата с другими НПВС в настоящее время не установлено, существует ли повышенный риск развития желудочно-кишечных кровотечений при применении других препаратов этой группы (при комбинации клопидогрела и НПВС требуется осторожность).

Клинически значимого фармакодинамического взаимодействия при применении клопидогрела совместно с атенололом и/или нифедипином не выявлено.

Фармакодинамическая активность Лопирела практически не изменяется при одновременном применении с фенобарбиталом, циметидином или эстрогенами.

Фармакокинетические свойства дигоксина или теофиллина не изменяются при совместном применении с клопидогрелом.

Антацидные средства не изменяют абсорбцию клопидогрела.

Данные, полученные в ходе исследований с микросомами печени человека, свидетельствуют о том, что клопидогрел может ингибировать активность изофермента CYP2C9. В результате этого возможно повышение концентраций в плазме крови некоторых лекарственных средств, таких как фенитоин и толбутамид, поскольку они метаболизируются посредством CYP2C9. Результаты исследования CAPRIE свидетельствуют о безопасности применения фенитоина и толбутамида совместно с клопидогрелом.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с острым инфарктом миокарда с повышением сегмента ST лечение клопидогрелом не следует начинать в течение первых нескольких дней после инфаркта миокарда.

Ввиду отсутствия клинических данных клопидогрел не рекомендуется применять при остром ишемическом инсульте (менее 7 дней).

При развитии кровотечения во время лечения препаратом необходимо немедленно провести клинический анализ крови (АЧТВ, количество тромбоцитов, тесты функциональной активности тромбоцитов) и функциональной активности печени.

Подобно другим антитромботическим препаратам, клопидогрел следует применять с осторожностью у больных с повышенным риском кровотечений (особенно желудочно-кишечных и внутриглазных) вследствие травмы, оперативных вмешательств или патологических состояний, а также в случае комбинированного применения клопидогрела с ацетилсалициловой кислотой, НПВС, гепарином, ингибиторами гликопротеина IIb/IIIa или тромболитиками.

Отмечены тяжелые случаи кровотечения у пациентов, принимавших клопидогрел одновременно с ацетилсалициловой кислотой или с ацетилсалициловой кислотой и гепарином.

Клопидогрел увеличивает время кровотечения, поэтому пациентов следует предупредить о том, что поскольку для остановки возникающего на фоне применения препарата (как в качестве монотерапии, так и в комбинации с ацетилсалициловой кислотой) кровотечения требуется длительное время, необходимо сообщать врачу о каждом случае кровотечения. Больные также должны информировать врача и стоматолога о приеме препарата в случае предстоящего оперативного вмешательства или если врач назначает новое для пациента лекарственное средство.

В случае оперативных вмешательств, если антиагрегантное действие нежелательно, курс лечения клопидогрелом следует прекратить за 7 дней до операции.

Необходим тщательный контроль состояния пациентов для выявления признаков кровотечения, включая скрытые кровотечения, особенно в течение первых недель лечения и/или после инвазивных кардиологических процедур или хирургического вмешательства.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат не оказывает влияния на способность к управлению автотранспортом и не снижает скорость психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с умеренной почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с умеренной печеночной недостаточностью.

Препарат противопоказан к применению при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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