Плогрель



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 белого или почти белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской, без запаха или почти без запаха; на поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

	1 таб.
клопидогрела гидросульфат	100.8 мг,
что соответствует содержанию клопидогрела	75 мг

Вспомогательные вещества: повидон К30 - 6 мг, кроскармеллоза натрия - 5 мг, лактозы моногидрат - 50.2 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 50 мг, масло касторовое гидрогенизированное - 2 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай белый - 3 мг (титана диоксид - 12%, гипромеллоза - 32%, тальк - 39%, макрогол - 17%), титана диоксид - 3 мг.

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиагрегант. Избирательно уменьшает связывание аденозиндифосфата (АДФ) с рецепторами на тромбоцитах и активацию рецепторов гликопротеина IIb/IIIa под действием АДФ, ослабляя агрегацию тромбоцитов.

Уменьшает агрегацию тромбоцитов, вызванную другими агонистами, предотвращая их активацию свободным 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).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После однократного приема и при курсовом приеме внутрь в дозе 75 мг/сут клопидогрел быстро всасывается. Абсорбция и биодоступность - высокая. Однако концентрация исходного вещества в плазме низкая и через 2 ч после приема не достигает предела измерения (0.025 мкг/л).

Связывание с белками плазмы - 98-94%.

Является пролекарством.

Метаболизм

Клопидогрел быстро метаболизируется в печени. Активный метаболит в крови не обнаруживается. Основной определяемый метаболит - неактивное производное карбоксиловой кислоты, время достижения C_{max} которого после повторного приема внутрь в дозе 75 мг достигается через 1 ч, C_{max} - около 3 мг/л.

Выведение

Около 50% препарата выводится почками и приблизительно 46% кишечником 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

Концентрация основного метаболита в плазме после приема в дозе 75 мг/сут ниже у пациентов с тяжелой хронической почечной недостаточностью тяжелой степени (КК 5-15 мл/мин) по сравнению с больными с хронической почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК от 30 до 60 мл/мин) и здоровыми лицами.

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;

— в комбинации с ацетилсалициловой кислотой для профилактики тромботических осложнений при остром коронарном синдроме без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия или инфаркт миокарда без зубца Q), в т.ч. у больных, подвергающихся стентированию.

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— тяжелая печеночная недостаточность;

— острое кровотечение (в т.ч. пептическая язва или внутричерепное кровоизлияние);

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;

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

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при умеренной печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности, патологических состояниях, повышающих риск развития кровотечения (в т.ч. травма, операции), склонности к кровотечениям, одновременном приеме ацетилсалициловой кислоты, варфарина, НПВС (включая ингибиторы ЦОГ-2), гепарина, ингибиторов гликопротеина IIb/IIIa, наследственном снижении функции изофермента CYP2C19.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Для *профилактики тромботических осложнений у пациентов с инфарктом миокарда, ишемическим инсультом или окклюзией периферических артерий* назначают по 75 мг 1 раз/сут. У больных с инфарктом миокарда лечение можно начинать с первых дней по 35-й день инфаркта миокарда, а у больных с ишемическим инсультом - в сроки от 7 дней до 6 месяцев после ишемического инсульта.

Для *профилактики тромботических осложнений при остром коронарном синдроме без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия, инфаркт миокарда без зубца Q)* начинают с однократного приема нагрузочной дозы 300 мг, а затем принимают по 75 мг/сут (в сочетании с ацетилсалициловой кислотой в дозах 75-325 мг/сут, рекомендуемая доза - 100 мг/сут). Максимальный благоприятный эффект наступает через 3 мес. Курс лечения - до 1 года.

Для *профилактики тромботических осложнений при остром коронарном синдроме с подъемом сегмента ST (острый инфаркт миокарда с подъемом сегмента ST)* назначают по 75 мг/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 клопидогрелом должно начинаться без приема его нагрузочной дозы.

У пациентов с генетически обусловленным снижением функции изофермента CYP2C19 возможно уменьшение эффекта клопидогрела. Оптимальный режим дозирования у таких пациентов не установлен.

Опыт применения у **пациентов с хронической почечной недостаточностью или умеренной степенью печеночной недостаточности** ограничен.

Побочное действие:

Кровотечение - наиболее частая реакция, которая встречается на протяжении первого месяца приема препарата. Случаи сильного кровотечения зарегистрированы у пациентов, принимающих клопидогрел одновременно с ацетилсалициловой кислотой или клопидогрел с ацетилсалициловой кислотой и гепарином.

Частота побочных эффектов определена согласно следующим критериям: очень часто (>1/10), часто (>1/100 и <1/10), нечасто (>1/1000 и <1/100), редко (>1/10 000 и <1/1000), очень редко (<1/10 000, включая единичные случаи). В пределах каждого класса частот нежелательные эффекты представлены в порядке уменьшения степени тяжести.

Со стороны органов кроветворения: нечасто - тромбоцитопения, лейкопения, эозинофилия; редко - нейтропения, в т.ч. выраженная; очень редко - тромботическая тромбоцитопеническая пурпура, анемия в т.ч. апластическая, панцитопения, агранулоцитоз, тяжелая тромбоцитопения, гранулоцитопения.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль, головокружение, парестезии, внутричерепное кровотечение, в т.ч. с летальным исходом; очень редко - спутанность сознания, галлюцинации.

Со стороны органов чувств: нечасто - кровоизлияние в конъюнктиву, сетчатку глаза; редко - вертиго; очень редко - нарушение вкуса.

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

Со стороны свертывающей системы крови: часто - гематома; очень редко - тяжелые кровотечения, кровотечение из операционной раны.

Со стороны дыхательной системы: очень часто - носовое кровотечение; очень редко - бронхоспазм, интерстициальный пневмонит, легочное кровотечение, кровохарканье.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, боль в животе, диспепсия, кровотечение из ЖКТ; нечасто - язва желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, рвота, тошнота, запор, метеоризм; редко - забрюшинное кровотечение; очень редко - панкреатит, колит, в т.ч. язвенный или лимфоцитарный, стоматит, острая печеночная

недостаточность, гепатит, нарушение функциональных проб печени, кровотечение из ЖКТ с летальным исходом.

Дерматологические реакции: часто - подкожные кровоизлияния; нечасто - кожная сыпь, зуд, пурпура; очень редко - эритематозная сыпь, многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, экзема, красный плоский лишай.

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

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - гематурия; очень редко - гломерулонефрит, гиперкреатининемия.

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, крапивница, анафилактические реакции, сывороточная болезнь.

Со стороны лабораторных показателей: нечасто - удлинение времени кровотечения, нарушения функциональных проб печени, повышение концентрации креатинина крови.

Прочие: очень редко - повышение температуры тела.

Передозировка:

Симптомы: удлинение времени кровотечения и последующие геморрагические осложнения.

Лечение: при обнаружении кровотечения проводят симптоматическую гемостатическую терапию. Не обнаружено антидотов фармацевтической активности клопидогрела. Если необходима быстрая коррекция удлинившегося времени кровотечения, рекомендуется переливание тромбоцитарной массы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ввиду отсутствия данных не следует применять клопидогрел при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием варфарина с клопидогрелом может увеличить интенсивность кровотечений, поэтому применение этой комбинации не рекомендуется.

Назначение ингибиторов гликопротеина IIb/IIIa, ацетилсалициловой кислоты, гепарина совместно с клопидогрелом повышает риск развития кровотечений.

При одновременном применении с НПВС может повышаться риск кровотечений.

Одновременный прием с ингибиторами изофермента CYP2C19 (например, омепразол) не рекомендуется.

Активный метаболит клопидоргела ингибирует активность изофермента CYP2C9, в результате чего могут повышаться концентрации фенитоина, толбутамида и НПВС в плазме.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения необходимо контролировать показатели системы гемостаза (АЧТВ, число тромбоцитов, тесты функциональной активности тромбоцитов); регулярно исследовать функциональную активность печени.

Клопидогрел следует применять с осторожностью у пациентов с риском выраженного кровотечения при травме, хирургическом вмешательстве, у пациентов, имеющих повреждения, склонные к кровотечению (особенно желудочно-кишечные и внутриглазные), а также у пациентов, получающих ацетилсалициловую кислоту, НПВС (в т.ч. ингибиторы ЦОГ-2), гепарин или ингибиторы гликопротеина IIb/IIIa. За пациентами необходимо тщательно наблюдать для выявления любых признаков кровотечения, в т.ч. скрытого, особенно на протяжении первых недель применения препарата и/или после инвазивных процедур на сердце или хирургических операций. Одновременное применение клопидогрела и варфарина не рекомендуется, так как оно может усилить кровотечение.

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

Больных следует предупредить о том, что поскольку остановка возникающего на фоне применения клопидогрела (в сочетании с ацетилсалициловой кислотой или без нее) кровотечения требует большего времени, они должны сообщать врачу о каждом случае кровотечения. Больные должны также информировать врача о приеме препарата,

если им предстоят оперативные вмешательства.

После приема клопидогрела тромботическая тромбоцитопеническая пурпура обнаруживалась очень редко, иногда после кратковременного применения. Это состояние характеризуется тромбоцитопенией и микроангиопатической гемолитической анемией в сочетании с неврологическими признаками, нарушением функции почек или лихорадкой.

Тромботическая тромбоцитопеническая пурпура - потенциально смертельное состояние, требующее немедленного лечения, в т.ч. с применением плазмафереза.

Из-за отсутствия данных клопидогрел нельзя рекомендовать при острых (менее 7 дней) ишемических инсультах.

Опыт применения клопидогрела у пациентов с нарушением функции почек ограничен, поэтому этим больным клопидогрел следует назначать с осторожностью.

При тяжелых нарушениях функции печени следует помнить о риске развития геморрагического диатеза, опыт применения препарата у пациентов с умеренным нарушением функции печени, ограничен, поэтому этим пациентам клопидогрел следует назначать с осторожностью.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Клопидогрел может вызвать побочные эффекты со стороны нервной системы (головная боль, головокружение, системное головокружение, спутанность сознания, галлюцинации), которые могут повлиять на способность управлять транспортными средствами и на занятия другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат при умеренной печеночной недостаточности. Противопоказание: тяжелая печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов старше 75 лет** лечение клопидогрелом должно начинаться без приема его нагрузочной дозы.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения не установлены).

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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