Тиклид



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
тиклопидина гидрохлорид	250 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, повидон К30 (поливидон К30), лимонная кислота безводная, крахмал кукурузный, магния стеарат, стеариновая кислота.

Состав оболочки: опадрай белый (гипромеллоза, титана диоксид, макрогол, полисорбат 80).

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Тиклопидин является ингибитором агрегации тромбоцитов. Он вызывает дозозависимое подавление агрегации тромбоцитов и высвобождение некоторых тромбоцитарных факторов, а также удлинение времени кровотечения.

Препарат не обладает значительной активностью *in vitro* , а только *in vivo* . Не было идентифицировано активно циркулирующих метаболитов тиклопидина.

Тиклопидин подавляет агрегацию тромбоцитов в результате ингибирования АДФ-зависимого связывания фибриногена с мембраной тромбоцитов. В отличие от ацетилсалициловой кислоты, он не ингибирует циклооксигеназу. Циклический АМФ тромбоцитов, по-видимому, не играет роли в этом механизме действия.

После отмены препарата у большинства больных время кровотечения и другие функции тромбоцитов возвращаются к нормальным значениям в течение одной недели. Подавление агрегации тромбоцитов наступает в течение 2 дней с начала применения тиклопидина 2 раза/сут.

Максимальный эффект достигается на 5-8 день лечения при дозе 250 мг 2 раза/сут. В терапевтической дозе тиклопидин подавляет АДФ-индуцированную (2.5 мкмоль/л) агрегацию тромбоцитов на 50-70%. Более низкие дозы вызывают пропорционально меньшее подавление агрегации тромбоцитов.

Фармакокинетика

После приема внутрь одноразовой стандартной дозы тиклопидина наблюдается быстрая абсорбция, с достижением C_{max} в плазме через 2 ч после приема. Абсорбция практически полная. Назначение тиклопидина после еды улучшает биодоступность.

Устойчивые уровни препарата в плазме достигаются после 7-10 дней введения 250 мг 2 раза/сут. Средний T

тиклопидина при устойчивых уровнях составляет приблизительно 30-50 ч. Однако, подавление агрегации тромбоцитов не зависит от уровня концентрации препарата в плазме.

Тиклопидин метаболизируется в печени. После приема внутрь препарата, меченого радиоактивным изотопом, 50-60% было обнаружено в моче, 23-30% — в кале.

Пожилые больные:

Основные клинические испытания проводились с участием группы больных среднего возраста 64 года. Фармакокинстика тиклопидина у пожилых больных модифицирована, но его фармакологическая и терапевтическая активность при дозировке 500 мг/сут не зависит от возраста.

Показания к применению:

— профилактика артериальных тромботических осложнений (инсульт, инфаркт миокарда, смерть от сосудистого заболевания) у больных, перенесших ишемический инсульт, вызванный атеросклерозом сосудов головного мозга;

— профилактика ишемических осложнений, особенно коронарных, у больных с ИБС и у больных с хроническими заболеваниями артерий нижних конечностей (перемежающаяся хромота);

— профилактика повторного тромбоза при хроническом гемодиализе.

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— геморрагические диатезы;

— заболевания со склонностью к кровотечениям (язвенная болезнь желудка или двенадцатиперстной кишки, геморрагический инсульт);

— заболевания крови с удлинением времени кровотечения;

— гематологические нарушения (лейкопения, тромбоцитопения или агранулоцитоз в анамнезе);

— тяжелая печеночная недостаточность;

— беременность и период лактации;

— аллергия к тиклопидину в анамнезе.

С осторожностью применять у больных с нарушением функции печени, с почечной недостаточностью, при оперативных вмешательствах, травмах и других патологических состояниях с риском развития кровотечения.

Эффективность и безопасность применения тиклопидина у детей не установлена.

Способ применения и дозы:

Только для **взрослых**. Для приема внутрь.

При *всех показаниях* препарат назначают в дозе 250 мг 2 раза/сут, во время или после еды. Максимальная суточная доза может составлять 1 г (может назначаться только в течение короткого периода времени).

При **хронической почечной недостаточности** необходимо снижение дозы.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: лейкопения (нейтропения, агранулоцитоз), панцитопения, аплазия костного мозга (особенно выражена у пациентов пожилого возраста) гемолитическая анемия, тромбоцитопения (изолированная, так и сопряженная с гемолитической анемией). Очень редко возникает тромботическая тромбоцитопеническая пурпура.

Со стороны системы гемостаза: геморрагические проявления.

Со стороны ЖКТ: тошнота, диарея, боли в области желудка, редко цитолитический и/или холестатический гепатит. Изолированное или сочетанное повышение уровня щелочной фосфатазы, трансаминаз, а также билирубина в течение первых 4 мес лечения.

Со стороны кожи: полиморфные кожные высыпания, часто сопровождающиеся зудом. В очень редких случаях отмечалась мультиформная эритема.

Аллергические реакции: в очень редких случаях отмечались различные формы иммуно-алллергических реакций; крайне редко - анафилактическая реакция, ангионевротический отек, артралгия, васкулит, синдром волчанки, аллергические нефропатия и пневмонит. Описаны крайне редкие случаи высокой температуры.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, шум в ушах, астения.

Уровень липидов в крови: в течение 1-4 мес лечения тиклопидином может наблюдаться повышение уровня ЛПВП, ЛПНП, ЛПОНП и триглицеридов в сыворотке на 8-10%. При продолжении лечения дальнейшего увеличения не наблюдается. Пропорция между субфракциями липопротеинов (особенно между ЛПВП и ЛПНП) остается неизменной. Данные клинических экспериментов показали, что этот эффект не зависит от возраста, пола, потребления алкоголя или присутствия сахарного диабета и не влияет на сердечно-сосудистый риск.

Передозировка:

На основании результатов экспериментов на животных передозировка препарата может вызывать тяжелую желудочно-кишечную непереносимость.

Необходим тщательный контроль за функцией жизненно-важных органов и показателей гемостаза (время кровотечения). При передозировке рекомендуется промывание желудка и применение общих поддерживающих мер.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказание: беременность и период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Некоторые препараты могут взаимодействовать с тиклопидином благодаря их антитромбоцитарным свойствам. Это такие вещества, как ацетилсалициловая кислота и другие НПВС, клопидогрел, тирофибан, эптифибатид, абциксимаб и илопрост. Одновременное применение нескольких, ингибирующих агрегацию тромбоцитов средств, а также их комбинирование с гепарином, пероральными антикоагулянтами и тромболитиками может существенно увеличивать риск кровотечения, поэтому должен проводиться регулярный клинический и лабораторный контроль.

Комбинации, требующие особой осторожности:

*Теофиллин (основание и соли) и аминофиллин**:***

Повышение уровня теофиллина в плазме с риском передозировки (снижение плазменного клиренса теофиллина). Требуется клинический контроль, а также измерение уровней теофиллина в плазме. Дозировку теофиллина следует при необходимости модифицировать в ходе лечения тиклопидином и после его окончания.

Фенитоин:

Повышенные уровни фенитоина в плазме с признаками передозировки (подавление метаболизма фенитоина). Требуется клинический контроль и измерение уровней фенитоина в плазме.

Циклоспорин:

Концентрации циклоспорина в крови понижаются. Следует увеличить дозу циклоспорина при контроле его концентрации. После отмена тиклопидина доза должна быть снижена.

Дигоксин:

Совместное применение с дигоксином снижает на 15% концентрацию последнего в плазме крови.

Прочие взаимодействия: антациды, уменьшая всасывание, снижают концентрацию тиклопидина в плазме крови на 18%; одновременный прием с циметидином, может приводит к замедлению выведения тиклопидина; миелотоксичеекие лекарственные средства повышают риск угнетения костномозгового кроветворения.

Особые указания и меры предосторожности:

Тиклопидин может вызывать гематологические или геморрагические побочные эффекты.

Гематологические нарушения в основном связаны с лейкоцитами. В подавляющем большинстве случаев эти побочные эффекты проявляются в течение первых 3 месяцев лечения. Иногда встречаются тяжелые случаи (тяжелая нейтропения, агранулоцитоз), которые могут приводить к летальному исходу.

Тяжелые исходы гематологических или геморрагических побочных эффектов чаще встречаются при следующих условиях:

— несоблюдение контрольных мер, запоздалый диагноз и неадекватное терапевтическое вмешательство;

— совместное применение антикоагулянтов или ингибиторов агрегации тромбоцитов, таких как ацетилсалициловая кислота и НПВС.

Гематологический контроль

В начале лечения должен быть проведен дифференцированный клинический анализ крови (в том числе подсчет тромбоцитов), а затем его следует повторять каждые 2 недели в течение первых 3 месяцев терапии. Если лечение прекращено в ходе первых 3 месяцев, в течение 2 недель после прекращения лечения, необходим контроль за нейтрофилами и тромбоцитами.

В случае нейтропении (<1500 нейтрофилов/мм^3) или тромбоцитопении (<100000 тромбоцитов/мм^3) лечение следует прервать, а контрольные анализы крови с подсчетом тромбоцитов и других элементов крови - проводить до получения нормальных результатов.

Контроль гемостаза

Тиклопидин следует применять с осторожностью при риске кровотечения.

Если больному предстоит хирургическое вмешательство, в случае нежелательности эффекта подавления тромбоцитов, лечение следует прекратить как минимум за десять дней до хирургического вмешательства.

В случае *срочной хирургической операции* для сокращения риска кровотечений и уменьшения времени кровотечения можно использовать 3 метода, совместно или по отдельности:

1) введение 0.5-1.0 мг/кг метилпреднизолона в/в, которое может быть повторено;

2) введение десмопрессина в дозе 0.2-0.4 мкг/кг;

3) трансфузия свежих тромбоцитов в форме концентрата тромбоцитной единицы.

Клинический контроль

Всех больных, принимающих тиклопидин, следует поставить в известность о том, что появление повышенной температуры, болей в горле, изъязвлений в полости рта, длительных или необычных кровотечений, кровоподтеков, кровавой рвоты и стула (мелены) требует от больного немедленного обращения к врачу.

Клинический диагноз тромботической тромбоцитопенической пурпуры (ТТП) может быть поставлен при наличии тромбоцитопении, гемолитической анемии, неврологических симптомов, дисфункции почек и высокой температуры. Начало может быть неожиданным. Большинство случаев были зафиксированы в первые 8 недель после начала терапии. Прогноз очень серьезный (известны смертельные случаи от ТТП).

Препарат следует применять с осторожностью у больных с нарушенной функцией печени, а в случае развития гепатита или желтухи нужно прекратить лечение.

При тяжелой диарее лечение следует приостановить.

Влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами

Не обнаружено.

При нарушениях функции почек

При **хронической почечной недостаточности** необходимо снижение дозы.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять у больных с нарушением функции печени, при тяжелой печеночной недостаточности - противопоказано.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность применения тиклопидина у детей не установлена.

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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