Инструкция по применению
Плагрил Таблетки 75 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Индия
Производитель: Др.Реддис
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Клопидогрел
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 75 мг
Срок годности: 24.0



Действующее вещество

Клопидогрел

Состав

Действующее вещество: Клопидогрел (Clopidogrel). Концентрация действующего вещества (мг): 75

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

Уменьшает агрегацию тромбоцитов, вызванную другими агонистами, предотвращая их активацию освобожденным АДФ, не влияет на активность фосфодиэстеразы (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). Агрегация тромбоцитов и время кровотечения возвращаются к исходному уровню, в среднем, через 5 дней после прекращения лечения. При наличии атеросклеротического поражения сосуда препятствует развитию атеротромбоза

независимо от локализации сосудистого процесса (цереброваскулярные, кардиоваскулярные или периферические поражения). Всасывание и распределение. Абсорбция и биодоступность высокая; концентрация в плазме низкая и через 2 ч после приема не достигает предела измерения (0,025 мкг/л). Клопидогрел и основной метаболит обратимо связываются с белками плазмы крови (98 и 94% соответственно). Метаболизм. Метаболизируется в печени. Основной метаболит - неактивное производное карбоксиловой кислоты, составляющее около 85% циркулирующего в плазме соединения. Tmax метаболита, после повторных пероральных доз клопидогрела 75 мг - через час (Cmax - около 3 мг/л). Клопидогрел является предшественником действующего вещества. Его активный метаболит, тиольное производное, образуется путем окисления клопидогрела в 2-оксо-клопидогрел и последующего гидролиза. Окислительный процесс регулируется, в первую очередь, изоферментами цитохрома P4502B6 и 3A4 и, в меньшей степени, - 1A1, 1A2 и 1C19. Активный тиольный метаболит быстро и необратимо связывается с тромбоцитарными рецепторами, подавляя, таким образом, агрегацию тромбоцитов. Этот метаболит в плазме не обнаруживается. Выведение. Выводится: почками - 50%, кишечником - 46% (в течение 120 ч после введения). T1/2 основного метаболита, после разового и повторного приема, - 8 ч. Концентрации выделяемых почками метаболитов - 50%. Фармакокинетика в особых клинических случаях. Концентрация основного метаболита в плазме, после приема клопидогрела в дозе 75 мг/сут, ниже у пациентов с тяжелыми заболеваниями почек (Cl креатинина 5–15 мл/мин) по сравнению с больными с заболеваниями почек средней тяжести (Cl креатинина от 30 до 60 мл /мин) и здоровыми людьми. Хотя ингибирующий эффект на АДФ-индуцированную агрегацию тромбоцитов оказался сниженным (25%) по сравнению с таким же эффектом у здоровых добровольцев, время кровотечения было удлинено в такой же мере, как и у здоровых добровольцев, получавших клопидогрел в дозе 75 мг/сут. У больных циррозом печени прием клопидогрела в суточной дозе 75 мг в течение 10 дней был безопасен и хорошо переносился. Cmax клопидогрела, как после приема однократной дозы, так и в равновесном состоянии, была во много раз выше у больных циррозом печени, чем у здоровых лиц.

Показания

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 формирования зубца Q), в т. ч. у больных, подвергшихся стентированию.

Способ применения и дозы

Таблетки принимают внутрь, независимо от приема пищи. Для профилактики ишемических нарушений у больных после перенесенного инфаркта миокарда, ишемического инсульта или на фоне диагностированных заболеваний периферических артерийвзрослым (в т. ч. пожилым пациентам) назначают в дозе 75 мг 1 разсут. Лечение следует начинать в сроки до 35 дней после перенесенного Q-образующего инфаркта миокарда и от 7 дней до 6 мес - после ишемического инсульта. При остром коронарном синдроме без подъема сегмента ST (нестабильная стенокардия или инфаркт миокарда без формирования зубца Q)лечение следует начинать с назначения однократной нагрузочной дозы 300 мг, затем продолжать применение препарата в дозе 75 мг 1 разсут (с одновременным приемом ацетилсалициловой кислоты в дозе 75-325 мгсут.). Поскольку применение ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах связано с большим риском кровотечений, рекомендуемая доза должна быть не выше 100 мг. Курс лечения - до 1 года. При остром коронарном синдроме с подъемом сегмента ST (острый инфаркт миокарда)препарат назначают в дозе 75 мг 1 разсут. с использованием начальной нагрузочной дозы в комбинации с ацетилсалициловой кислотой, в сочетании или без тромболитиков. Для пациентов в возрасте старше 75 лет лечение клопидогрелом должно осуществляться без использования нагрузочной дозы. Комбинированную терапию начинают как можно раньше после появления симптомов и продолжают в течение минимум 4 недель.

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 стадии обострения, НЯК, туберкулез, опухоли легких, гиперфибринолиз), беременность, период лактации (грудного вскармливания), детский возраст до 18 лет,повышенная чувствительность к компонентам препарата Плагрил. С осторожностью следует применять препарат при умеренной печеночной или почечной недостаточности, травмах, состояниях, повышающих риск развития кровотечения (в т. ч. травма, операции), при одновременном приеме ацетилсалициловой кислоты и других НПВС (включая ингибиторы ЦОГ-2), гепарина и ингибиторов гликопротеина IIbIIIa.

Применение при беременности и кормлении грудью

В качестве меры предосторожности прием клопидогрела противопоказан во время беременности из-за отсутствия клинических данных по его приему беременными женщинами, хотя исследования на животных не выявили ни прямые, ни косвенные неблагоприятные эффекты на течение беременности, эмбриональное развитие, роды и постнатальное развитие. Кормление грудью в случае лечения клопидогрелом следует прекратить, т. к. в исследованиях на крысах было показано, что клопидогрел и /или его метаболиты экскретируются в грудное молоко. Проникает ли клопидогрел в грудное молоко человека неизвестно. Фертильность. В исследованиях на животных не выявлено неблагоприятное влияние клопидогрела на фертильность.

Побочные действия

Со стороны свертывающей системы крови: часто - желудочно-кишечные кровотечения. иногда - геморрагический инсульт, удлинение времени кровотечения, носовые кровотечения. редко - гематомы, гематурия, и конъюнктивальные кровотечения. Со стороны системы кроветворения: иногда - тромбоцитопения, нейтропения, лейкопения, эозинофилия. очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, гранулоцитопения, агранулоцитоз, анемия и апластическая анемия. Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: иногда - головная боль, головокружение, парестезия. редко - вертиго. очень редко - спутанность сознания, галлюцинации. Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - васкулит, снижение АД. Со стороны дыхательной системы: очень редко - бронхоспазм, интерстициальный пневмонит. Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, диарея, абдоминальные боли. иногда - тошнота, гастрит, метеоризм, запор, рвота, изъязвление слизистой оболочки ЖКТ, обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. очень редко - колит (в т. ч. язвенный или лимфоцитарный колит), панкреатит, изменение вкусовых ощущений, стоматит, гепатит, острая печеночная недостаточность, повышение активности печеночных ферментов. Со стороны костно-мышечной системы: очень редко - артралгия, артрит, миалгия. Со стороны мочевыводящей системы: очень редко - гломерулонефрнт. Дерматологические реакции: иногда - зуд. очень редко - буллезная сыпь (многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз), эритематозная сыпь, экзема, плоский лишай. Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, крапивница, анафилактоидные реакции, сывороточная болезнь. Прочие: очень редко - повышение температуры тела, увеличение содержания сывороточного креатинина.

Передозировка

Симптомы: при разовом пероральном применении 600 мг клопидогрела (количество, эквивалентное 8 стандартным таблеткам 75 мг) у здоровых людей, побочных явлений не было. Время кровотечения было удлинено в 1,7 раза, что соответствует величине, зарегистрированной после приема терапевтической дозы (75 мг/сут). Лечение: переливание тромбоцитарной массы. Специфический антидот отсутствует.

Взаимодействие с другими препаратами

Усиливает антиагрегантный эффект ацетилсалициловой кислоты, гепарина, непрямых антикоагулянтов, НПВС, при совместном применении повышает риск развития кровотечений из ЖКТ. Ингибируя активность CYP2C9, повышает концентрацию ЛС, метаболизирующихся при ее участии CYP2C9 (фенитоин, толбутамид). Не отмечено клинически значимого фармакодинамического взаимодействия при применении клопидогрела совместно с атенололом, нифедипином, фенобарбиталом, циметидином, эстрогенами, дигоксином, теофиллином, толбутамидом, антацидными средствами.

Особые указания

В случае хирургических вмешательств, если антиагрегантное действие нежелательно, курс лечения следует прекратить за 7 дней до операции. Больных следует предупредить: поскольку остановка возникающего на фоне применения препарата кровотечения требует большего времени, они должны сообщать врачу о каждом случае необычного кровотечения. Больные должны также информировать врача о приеме препарата, если им предстоят оперативные вмешательства или если врач назначает новое для больного ЛС. В период лечения необходимо контролировать показатели системы гемостаза (АЧТВ, число тромбоцитов, тесты функциональной активности тромбоцитов); регулярно исследовать функциональную активность печени. При тяжелых нарушениях функции печени следует помнить о риске развития геморрагического диатеза. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Признаков ухудшения способности управления автомобилем или уменьшения психической работоспособности после приема обнаружено не было.

Условия хранения

Беречь от детей