

Инструкция по применению препарата

Тромбопол®

РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР: ЛСР-006548/09

ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ ПРЕПАРАТА: Тромбопол®

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ ИЛИ ГРУППИРОВОЧНОЕ НАЗВАНИЕ:
ацетилсалициловая кислота

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА: таблетки кишечнорастворимые, покрытые оболочкой

СОСТАВ:

1 таблетка (75 мг) содержит:

Активное вещество: ацетилсалициловая кислота 75,00 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза 14,50 мг, крахмал кукурузный 9,50 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип С) 1,00 мг.

Оболочка: гипромеллоза 2,00 мг, триэтилцитрат 0,80 мг, Акрилиз белый (кишечнорастворимое покрытие): метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] 4,75 мг, тальк 1,19 мг, титана диоксид 1,08 мг, натрия лаурилсульфат 0,04 мг, кремния диоксид коллоидный 0,07 мг, натрия гидрокарбонат 0,07 мг.

1 таблетка (150 мг) содержит:

Активное вещество: ацетилсалициловая кислота 150,00 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза 29,00 мг, крахмал кукурузный 19,00 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип С) 2,00 мг.

Оболочка: гипромеллоза 4,00 мг, триэтилцитрат 1,60 мг, Акрил-из белый (кишечнорастворимое покрытие): метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] 9,50 мг, тальк 2,38 мг, титана диоксид 2,16 мг, натрия лаурилсульфат 0,08 мг, кремния диоксид коллоидный 0,14 мг, натрия гидрокарбонат 0,14 мг.

ОПИСАНИЕ:

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП)

КОД АТХ: N02BA01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

В основе механизма антиагрегантного действия ацетилсалициловой кислоты лежит необратимое ингибирование циклооксигеназы (ЦОГ-1), в результате чего блокируется синтез тромбоксана A₂ и подавляется агрегация тромбоцитов. Антиагрегантный эффект развивается даже после применения малых доз препарата и сохраняется в течение 7 суток после однократного приема. Эти свойства ацетилсалициловой кислоты используются в профилактике и лечении инфаркта миокарда, ишемической болезни сердца, осложнений варикозной болезни.

Ацетилсалициловая кислота (АСК) также оказывает противовоспалительное, жаропонижающее и анальгезирующее действие.

Таблетки ТРОМБОПОЛ® имеют кишечнорастворимую оболочку, благодаря которой растворяются и выделяют активное вещество в более щелочной среде двенадцатиперстной кишки, уменьшая раздражающее действие ацетилсалициловой кислоты на слизистую оболочку желудка.

Фармакокинетика

Абсорбция ацетилсалициловой кислоты из таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой, начинается через 3-4 часа от момента приема препарата, подтверждая, что оболочка эффективно блокирует растворение препарата в желудке.

Максимальная концентрация в плазме наблюдается примерно через 2-3 часа и составляет в среднем 12,7 мкг/мл для таблеток 150 мг и 6,72 мкг/мл для таблеток 75 мг.

Наличие пищи в желудочно-кишечном тракте замедляет абсорбцию препарата.

Скорость системной абсорбции (AUC) составляет 56,42 мкг х час/мл для таблеток 75 мг и 108,08 мкг х час/мл для таблеток 150 мг.

Распределение

Ацетилсалициловая кислота быстро и в значительной степени проникает в большинство тканей и биологические жидкости организма.

Относительное распределение составляет около 0,15-0,2 л/кг и увеличивается одновременно с повышением концентрации препарата в сыворотке крови. Степень связи препарата с белками плазмы крови зависит от концентрации; у здоровых лиц уменьшается одновременно с уменьшением этой концентрации.

При почечной недостаточности, при беременности и у новорожденных салицилаты могут вытеснять билирубин из связи с альбумином и способствовать развитию билирубиновой энцефалопатии.

Метаболизм

Ацетилсалициловая кислота частично метаболизируется во время абсорбции. Этот процесс происходит под влиянием ферментов, главным образом, в печени с образованием таких метаболитов, как фенолсалицилат, глюкуронида салицилат и салицилуровой кислоты, обнаруживаемых во многих тканях и моче.

У женщин процесс метаболизма проходит медленнее (меньшая активность ферментов в сыворотке крови).

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) ацетилсалициловой кислоты из плазмы крови составляет около 15-20 минут.

В отличие от других салицилатов, при многократном приеме препарата негидролизованная ацетилсалициловая кислота не накапливается в сыворотке крови.

Только 1% принятой внутрь дозы ацетилсалициловой кислоты выводится почками в виде негидролизованной ацетилсалициловой кислоты, остальная часть выводится в виде салицилатов и их метаболитов.

У больных с нормальной функцией почек 80-100% разовой дозы препарата выводится почками в течение 24-72 час.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Профилактика острого инфаркта миокарда при наличии факторов риска (например, сахарный диабет, гиперлипидемия, артериальная гипертензия, ожирение, курение, пожилой возраст) и повторного инфаркта миокарда;
- нестабильная стенокардия;
- профилактика инсульта (в том числе, у пациентов с преходящим нарушением мозгового кровообращения);
- профилактика преходящего нарушения мозгового кровообращения;
- профилактика тромбозов после операций и инвазивных вмешательств на сосудах (например, аорто-коронарное шунтирование, эндартерэктомия сонных артерий, артерио-венозное шунтирование, ангиопластика сонных артерий);
- профилактика тромбоза глубоких вен и тромбозов легочной артерии и ее ветвей (в том числе, при длительной иммобилизации в результате обширного хирургического вмешательства).

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Повышенная чувствительность к ацетилсалициловой кислоте, вспомогательным веществам препарата и другим НПВП;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения);
- желудочно-кишечное кровотечение;
- геморрагический диатез;
- бронхиальная астма, индуцированная приемом салицилатов и НПВП; сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости АСК;
- сочетанное применение с метотрексатом в дозе 15 мг в неделю и более;
- беременность (I и III триместр) и период лактации;
- возраст до 18 лет.

С осторожностью: при подагре, гиперурикемии, язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки или желудочно-кишечных кровотечениях (в анамнезе), почечной/печеночной недостаточности, бронхиальной астме, хронических заболеваниях органов дыхания, сенной лихорадке, полипозе носа, лекарственной аллергии, одновременном приеме метотрексата в дозе менее 15 мг/нед, сопутствующей терапии антикоагулянтами, беременности (II триместр).

Применение при беременности

Применение салицилатов в I триместре беременности приводит к развитию расщепления верхнего неба, порокам сердца; в III триместре вызывает торможение родовой деятельности, преждевременное закрытие артериального протока у плода, повышенную кровоточивость у матери и плода, а назначение непосредственно перед родами может вызвать внутричерепные кровоизлияния, особенно у недоношенных детей – применение салицилатов в этих триместрах противопоказано.

Во II триместре беременности салицилаты можно назначать только с учетом строгой оценки риска и пользы.

Применение во время кормления грудью

Салицилаты и их метаболиты в небольших количествах проникают в грудное молоко. Случайный прием салицилатов в период лактации не сопровождается развитием побочных реакций у ребенка и не требует прекращения грудного вскармливания. Однако при длительном применении препарата или назначении его в высокой дозе кормление грудью следует немедленно прекратить.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Таблетки следует принимать независимо от приема пищи, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды.

Препарат предназначен для длительного применения. Длительность терапии определяется врачом.

Профилактика при подозрении острого инфаркта миокарда:

75 мг или 150 мг в сутки.

Профилактика впервые возникшего острого инфаркта миокарда при наличии факторов риска:

75 мг или 150 мг в сутки.

Профилактика повторного инфаркта миокарда. Нестабильная стенокардия. Профилактика инсульта и преходящего нарушения мозгового кровообращения. Профилактика тромбозмембральных осложнений после хирургических операций или инвазивных исследований:

75 мг или 150 мг в сутки.

Профилактика тромбоза глубоких вен и тромбозмембральной легочной артерии и ее ветвей:

75 мг или 150 мг в сутки.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Желудочно-кишечный тракт: тошнота, изжога, рвота, болевые ощущения в области живота, диарея, язвы слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки, в том числе перфоративные, желудочно-кишечные кровотечения, повышение активности «печеночных» ферментов.

Дыхательная система: бронхоспазм.

Центральная нервная система: головокружение, шум в ушах.

Система кроветворения: повышенная кровоточивость, анемия (редко).

Аллергические реакции: крапивница, отек Квинке.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Первыми симптомами передозировки ацетилсалициловой кислоты являются: тошнота, рвота, шум в ушах и учащенное дыхание.

Могут наблюдаться также такие симптомы, как: потеря слуха, расстройство зрения, головные боли, двигательное возбуждение, сонливость, судороги, гипертермия. При тяжелой интоксикации может развиваться нарушение кислотно-щелочного и водно-электролитного баланса (метаболический ацидоз и обезвоживание).

Симптомы легкой и среднетяжелой интоксикации развиваются после применения ацетилсалициловой кислоты в дозе 150-300 мг/кг. Симптомы тяжелой передозировки развиваются при дозе 300-500 мг/кг. Потенциально смертельная доза АСК составляет более 500 мг/кг.

Лечение: специфический антидот отсутствует.

В случае передозировки ацетилсалициловой кислоты необходимо:

- вызвать рвоту и промыть желудок (с целью уменьшения абсорбции препарата). Такие действия дают

эффект в течение 3-4 часов после приема препарата, а в случае приема очень большой дозы – до 10 часов;

- для уменьшения абсорбции АСК необходимо принять активированный уголь в виде водной суспензии (доза для взрослых – 50-100 г, для детей – 30-60 г);
- необходимо внимательно наблюдать за нарушением водно-электролитного баланса и восполнять его;
- с целью ускорения выведения АСК через почки и при лечении ацидоза необходимо внутривенно ввести натрия бикарбонат. Необходимо поддерживать рН в пределах 7,0-7,5;
- при очень тяжелой интоксикации необходимо провести гемодиализ или перитонеальный диализ;
- в связи с возможностью развития дыхательного ацидоза запрещается принимать препараты, угнетающие центральную нервную систему, например, барбитураты;
- пациентам с нарушением дыхания необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей и доступ кислорода. В случае необходимости выполнить интратрахеальную интубацию и обеспечить искусственную вентиляцию легких.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

При одновременном применении АСК усиливает действие следующих лекарственных средств:

- метотрексата, за счет снижения почечного клиренса и вытеснения его из связи с белками;
- гепарина и непрямых антикоагулянтов, за счет нарушения функции тромбоцитов и вытеснения непрямых антикоагулянтов из связи с белками;
- тромболитических препаратов и ингибиторов агрегации тромбоцитов (тиклопидина);
- дигоксина, вследствие снижения его почечной экскреции;
- гипогликемических средств (инсулина и производных сульфонилмочевины), за счет гипогликемических свойств самой АСК в высоких дозах и вытеснения производных сульфонилмочевины из связи с белками;
- вальпроевой кислоты, за счет вытеснения ее связи с белками;
- НПВП;
- сульфаниламидов (в том числе, ко-тримоксазола);
- барбитуратов;
- соединений лития.

Аддитивный эффект наблюдается при одновременном приеме АСК с алкоголем.

АСК ослабляет действие:

- противовоспалительных препаратов, увеличивающих выделение мочевой кислоты (пробенецид, сульфинпирозон, бензбромарон), вследствие конкурентной тубулярной элиминации мочевой кислоты;
- антигипертензивных средств, включая ингибиторы ангиотензин-превращающего фермента;
- антагонистов альдостерона (например, спиронолактона);
- «петлевых» диуретиков (например, фуросемида);

Усиливая элиминацию салицилатов, системные глюкокортикостероиды ослабляют их действие.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

АСК может провоцировать бронхоспазм, а также вызывать приступы бронхиальной астмы и другие реакции повышенной чувствительности. Факторами риска являются наличие бронхиальной астмы в анамнезе, сенной лихорадки, полипоза носа, хронических заболеваний дыхательной системы, а также аллергических реакций на другие препараты (например, кожные реакции, зуд, крапивница). АСК может вызывать кровотечения различной степени выраженности во время и после хирургических вмешательств. Прием препарата необходимо прекратить за 5-7 дней до предполагаемой операции. Сочетание АСК с антикоагулянтами, тромболитическими препаратами и ингибиторами агрегации тромбоцитов сопровождается повышенным риском развития кровотечений.

АСК в низких дозах может спровоцировать развитие подагры у предрасположенных лиц (имеющих сниженную экскрецию мочевой кислоты).

Сочетание АСК с метотрексатом сопровождается повышенной частотой развития побочных эффектов со стороны органов кроветворения.

Высокие дозы АСК оказывают гипогликемический эффект, что необходимо иметь в виду при назначении ее пациентам с сахарным диабетом, получающим гипогликемические средства.

При сочетанном назначении глюкокортикостероидов (ГКС) и салицилатов следует помнить, что во время лечения уровень салицилатов в крови снижен, а после отмены ГКС возможна передозировка салицилатов.

Не рекомендуется сочетание АСК с ибупрофеном, поскольку он снижает эффективность препарата ТРОМБОПОЛ® и, вследствие этого, может снижать продолжительность жизни.

Превышение дозы АСК сопряжено с риском желудочно-кишечного кровотечения.

При сочетании АСК с этанолом повышен риск повреждения слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и удлинения времени кровотечения.

Передозировка особенно опасна у пожилых людей. Пациенты старше 65 лет из-за пониженной работоспособности почек и более частого возникновения побочных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта должны принимать АСК в меньших дозах.

Влияние на способности к концентрации внимания и скорость психомоторных реакций

Данных об отрицательном воздействии на способности к управлению автомобилем или работу с механизмами нет.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые оболочкой, 75 мг или 150 мг.

По 10 таблеток в блистер из фольги Ал/ПВХ/ПВДХ.

По 3, 5 или 6 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

2 года.

Не применять препарат после истечения срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Без рецепта.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Фармацевтический завод «ПОЛЬФАРМА» АО

ул. Пельплиньска 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польша

ОРГАНИЗАЦИЯ, ПРИНИМАЮЩАЯ ПРЕТЕНЗИИ ПОТРЕБИТЕЛЕЙ

ОАО «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»

142450, Московская область, Ногинский район, г. Старая Купавна, ул. Кирова, 29

Тел. (495) 702 95 06;

факс (495) 702 95 03