

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ПОЛОКАРД
(POLOCARD)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: *acetylsalicylic acid*;

основні фізико-хімічні властивості: круглі, двоопуклі, злегка шорсткі таблетки, вкриті оболонкою, розчинюються у кишечнику, рожевого кольору, діаметром 6 мм (таблетки по 75 мг) та 8 мм (таблетки по 150 мг);

склад: 1 таблетка містить ацетилсаліцилової кислоти 75 мг або 150 мг;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, целюлоза порошкоподібна, натрію крохмальгліколят, гіпромелоза, суміш для покриття таблетки (кислота метакрилова, тальк, титану діоксид, триетилцитрат, кошеніль лак червоний, кремній колоїдний безводний, натрію бікарбонат, натрію лаурилсульфат).

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою, кишковорозчинні.

Фармакотерапевтична група. Протитромботичні засоби. Ацетилсаліцилова кислота.
Код АТС В01А С06.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.*

Полокард містить ацетилсаліцилову кислоту, яка інгібує агрегацію тромбоцитів та має жарознижувальну, знеболювальну та протизапальну дію.

Механізм інгібування агрегації тромбоцитів ацетилсаліциловою кислотою полягає в інгібуванні циклооксигенази у клітинах крові, яка перетворює арахідонову кислоту на пероксиди (PGG₂ та PGH₂) – попередники простагландинів тромбоцитів та тромбоксану.

Агрегація інгібується навіть після застосування невеликих доз препарату, і цей ефект зберігається протягом кількох днів після прийому одноразової дози.

Такі особливості ацетилсаліцилової кислоти використовуються для попередження та лікування тромбозних ускладнень та для попередження інфаркту міокарда та ішемічної хвороби серця.

Полокард, таблетки, вкриті оболонкою, кишковорозчинні, є фармацевтичною формою, яка не розпадається у шлунку, і таким чином знижується ризик прямого контакту ацетилсаліцилової кислоти зі слизовою оболонкою шлунка та її ушкодження. Розпадання таблетки та вивільнення діючої речовини відбувається лише у середовищі дванадцятипалої кишки.

Фармакокінетика.

Абсорбція

З таблеток, вкритих оболонкою, що розчинюються у кишечнику, ацетилсаліцилова кислота абсорбується інакше, ніж з інших таблетованих форм.

Абсорбція починається через 3 - 4 години після прийому препарату.

Максимальна концентрація у сироватці досягається приблизно через 6 годин та становить в середньому 12,7 мкг/мл для таблеток по 150 мг та 6,72 мкг/мл для таблеток по 75 мг.

Наявність їжі у травному тракті пригнічує абсорбцію препарату.

Крива „концентрація – час” (AUC) дорівнює 56,42 мкг x год./мл для таблеток по 75 мг та 108,08 мкг x год./мл для таблеток по 150 мг.

Розподіл

Ацетилсаліцилова кислота швидко розподіляється у більшості тканин та рідин організму.

Відносний об'єм розподілу становить приблизно 0,15 – 0,2 л/кг та підвищується з підвищенням концентрації у сироватці.

Приблизно 33% препарату зв'язується з білками, якщо концентрація в сироватці сягає 120 мкг/мл.

Ступінь зв'язування препарату з білками залежить від концентрації альбуміну; у здорових осіб вона знижується із зниженням концентрації останнього.

У випадку ниркової недостатності, вагітності та у малюків зв'язування ацетилсаліцилової кислоти з білками сироватки знижується не лише з причини гіпоальбумінемії, а й також внаслідок акумуляції ендогенних факторів, які витісняють препарат із місць зв'язування з протеїнами.

Метаболізм

Ацетилсаліцилова кислота частково метаболізується під час абсорбції. Цей процес відбувається під впливом естерази, головним чином у печінці, а й також у сироватці крові, еритроцитах та синовіальній рідині.

Виведення

$T_{0,5}$ виведення ацетилсаліцилової кислоти у сироватці становить приблизно 15 - 20 хвилин. На відміну від інших саліцилатів негідролізована ацетилсаліцилова кислота не акумулюється в сироватці крові після багаторазового прийому.

Лише приблизно 1% пероральної дози ацетилсаліцилової кислоти виділяється з сечею у вигляді негідролізованої речовини, залишок виділяється у вигляді саліцилатів та їх метаболітів.

У пацієнтів з нормальною функцією нирок 80-100% одноразової дози препарату виділяються з сечею протягом 24 - 72 годин.

Показання для застосування.

Профілактика інфаркту міокарда, стабільної та нестабільної ішемічної хвороби серця, профілактика тромбозу та емболії кровоносних судин.

Спосіб застосування та дози.

Зазвичай призначають 1 - 2 таблетки по 75 мг або 1 таблетку по 150 мг на день під час або після прийому їжі. Тривалість курсу лікування визначається лікарем індивідуально.

Таблетки треба ковтати цілими, запиваючи невеликою кількістю води.

Побічна дія.

Після застосування ацетилсаліцилової кислоти спостерігались такі побічні дії:

Травний тракт

Порушення травлення, печія, відчуття тяжкості у епігастральній ділянці, нудота, блювання, діарея, відсутність апетиту, біль у шлунку, кровотеча, ушкодження слизової шлунка, загострення виразкової хвороби шлунка та дванадцятипалої кишки. У 15% пацієнтів, які застосовували ацетилсаліцилову кислоту протягом довгого часу, виникали виразки шлунка.

Печінка

Гостре, тимчасове ушкодження печінки, фокальний некроз клітин печінки, болісність та збільшення печінки, особливо у пацієнтів, які страждають на ювенільний ревматоїдний артрит, системний червоний вовчак, ревматичну хворобу або мають ушкодження печінки в анамнезі; підвищення активності амінотрансфераз в сироватці, лужної фосфатази, концентрації білірубину, зниження концентрації тромбоксану.

Слух

Шум у вухах, тимчасова втрата слуху.

Шум та дзвін у вухах є першими симптомами отруєння саліцилатами.

Нирки

Альбумінурія, наявність лейкоцитів та еритроцитів у сечі, нефропатія з некрозом ниркових сосочків.

У випадку передозування: значне зниження кліренсу креатиніну або гострий некроз ниркових каналців з порушенням функції нирок.

Шкіра

Різні види висипу на шкірі, у рідких випадках – пухирі або пурпура, кровотеча зі слизових оболонок та навіть токсичний коліквацийний епідермічний некроз.

Кров

Лейкопенія, тромбоцитопенія, апластична анемія, агранулоцитоз, еозінопенія, пурпура, дисеміноване внутрішньосудинне згортання крові.

Система кровообігу

Набряк легенів екстраміокардіального походження, який головним чином виникає при хронічному або гострому отруєнні.

Реакції гіперчутливості

Кропив'янка, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм, риніт, слезотеча, шок. У 0,3% населення та 20% пацієнтів, які страждають на бронхіальну астму або хронічну кропив'янку, розвивається гіперчутливість до ацетилсаліцилової кислоти. У випадках гіперчутливості небажані явища можуть розвинути у межах 3 годин після прийому таблетки.

Інші

Порушення зору.

Протипоказання.

- Гіперчутливість до препарату або алергічні реакції (кропив'янка, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм, тяжкий риніт, шок) після прийому інших протизапальних лікарських засобів в анамнезі;
- виразки шлунка або дванадцятипалої кишки та кровотеча травного тракту, порушення коагуляції крові (гемофілія, хвороба фон Віллебранда, телеангіектазії, тромбоцитопенія);
- бронхіальна астма та носові поліпи;
- тяжка печінкова або ниркова недостатність;
- III триместр вагітності;
- вірусні захворювання (особливо грип та вітряна віспа) у дітей до 12 років.

Передозування.

Специфічного антидоту для ацетилсаліцилової кислоти не існує.

У випадку отруєння ацетилсаліциловою кислотою слід виконати наступні дії:

- Викликати блювання та ввести шлунковий зонд (щоб зменшити абсорбцію препарату). Ці заходи ефективні протягом 3-4 годин після прийому препарату, а у випадках отруєння дуже великою дозою препарату - аж до 10 годин.
- Застосувати активований вугіль у вигляді водної суспензії (50 - 100 г для дорослих та 30 - 60 г для дітей), щоб зменшити абсорбцію ацетилсаліцилової кислоти.
- У випадку гіпертермії температуру тіла слід знижувати шляхом підтримання низької температури навколишнього середовища, крім того, слід використовувати холодні компреси.
- Порушення водно-електролітного балансу слід ретельно відстежувати та якнайшвидше стабілізувати.
- Щоб прискорити виведення ацетилсаліцилової кислоти нирками, а також у випадку ацидозу, слід ввести внутрішньовенним шляхом бікарбонат натрію. рН сечі треба підтримувати на рівні 7,0 – 7,5.
- У випадках дуже тяжкого отруєння, коли кислотно-лужний баланс неможливо стабілізувати шляхом неінвазивних методів, та у випадках супутньої ниркової недостатності слід провести гемодіаліз або перитоніальний діаліз. Діаліз ефективно виводить ацетилсаліцилову кислоту з організму та сприяє стабілізації кислотно-лужного та водно-електролітного балансу.
- У випадках продовженого протромбінового часу слід застосувати вітамін К.
- Не слід застосовувати препарати, що пригнічують центральну нервову систему, наприклад, барбітурати, оскільки існує ризик виникнення респіраторного ацидозу та коми.
- Пацієнтам з задишкою слід забезпечити доступ свіжого повітря або застосувати кисень. При

необхідності, слід провести ендотрахеальну інтубацію та допоміжну вентиляцію легенів.

- У випадку шоку провести звичайні процедури виведення з шокowego стану.

Особливості застосування.

- Після прийому препарату може виникнути кровотеча з травного тракту та активуватися виразкова хвороба шлунка та дванадцятипалої кишки.
- Ацетилсаліцилова кислота може спричинити напад задишки у пацієнтів, які страждають на бронхіальну астму.
- У зв'язку з тим, що ацетилсаліцилова кислота та її метаболіти виділяються в сечу, підвищується ризик небажаних ефектів у пацієнтів з порушеннями функції нирок.
- Під час довготривалого лікування з застосуванням великих доз ацетилсаліцилової кислоти може розвинути анемія, спричинена дефіцитом заліза або небажаною дією на нирки; у таких випадках слід періодично перевіряти функцію нирок та гематокрит.
- У пацієнтів з ювенільним ревматоїдним артритом, системним червоним вовчаком та супутніми ураженнями печінки токсичність саліцилатів підвищується; таким пацієнтам слід перевіряти функцію печінки.
- Препарат слід з обережністю застосовувати у пацієнтів з гіпропротромбінемією в анамнезі, дефіцитом вітаміну К, тромбоцитопенією та у тих, хто перебуває на терапії антитромботичними препаратами.
- У зв'язку зі зниженням коагуляції крові та великим ризиком кровотечі прийом ацетилсаліцилової кислоти слід припинити за 5 - 7 днів до планового хірургічного втручання.
- Рекомендується припинити прийом саліцилатів за 24 - 48 годин до застосування великих доз метотрексату шляхом внутрішньовенних інфузій (див. розділ „Взаємодії”).
- Застосовувати з обережністю, якщо у хворого: кровотеча зі статевих органів, надмірна менструальна кровотеча, наявність внутрішньоматкових контрацептивних засобів, подагра, артеріальна гіпертензія, серцева недостатність, дефіцит глюкозо-6-фосфатдегідрогенази.
- Під час лікування ацетилсаліциловою кислотою не слід вживати алкогольні напої, оскільки при цьому зростає ризик небажаних ефектів з боку травного тракту.
- У пацієнтів віком старше 65 років ацетилсаліцилову кислоту слід застосовувати у менших дозах та з більшими інтервалами. У цих пацієнтів частіше виникає подразнення слизової оболонки шлунка та кровотеча травного тракту, крім того, у них також може змінюватися фармакокінетика ацетилсаліцилової кислоти.
- Застосування ацетилсаліцилової кислоти у дітей до 12 років на фоні гіпертермії у випадках вірусної вітряної віспи або грипу може спричинити розвинення синдрому Рейє.

Застосування під час вагітності та лактації

У дітей, матері яких застосовували ацетилсаліцилову кислоту перед пологами, спостерігалися такі явища, як субкон'юнктивальний крововилив, гематурія, випоти, субперіостальна гематома черепа.

Згідно з результатами інших тестів, внутрішньочерепні кровотечі частіше виникали у недоношених немовлят, матері яких приймали ацетилсаліцилову кислоту за тиждень до пологів.

Застосування матер'ю ацетилсаліцилової кислоти може призвести до передчасного закриття артеріальної протоки, що може стати причиною гіпертензії у деяких новонароджених.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти вагітними жінками може затримати пологи та спричинити кровотечу.

Якщо мати приймала ацетилсаліцилову кислоту протягом останніх 1 - 2 тижнів до пологів, дитину слід спостерігати на випадок виникнення кровотечі.

Застосовувати ацетилсаліцилову кислоту під час 1-го та 2-го триместрів вагітності можна лише у тому випадку, якщо на думку лікаря, користь для матері переважає потенційну небезпеку для дитини.

Застосування препарату під час лактації

Ацетилсаліцилова кислота потрапляє у молоко матерів, які годують груддю.

Не рекомендується годувати груддю під час довготривалого лікування великими дозами

ацетилсаліцилової кислоти, хоча її короткотривале застосування не становить загрози для дитини, яку годують груддю.

Застосування у дітей

Ацетилсаліцилову кислоту не слід застосовувати у дітей віком до 12 років у зв'язку з можливістю виникнення синдрому Рейе.

Застосування у пацієнтів літнього віку

У пацієнтів старших 65 років ацетилсаліцилову кислоту слід застосовувати у менших дозах та через більші проміжки часу, оскільки у них частіше виникає подразнення шлунка та кровотеча травного тракту. Крім того, у таких пацієнтів може змінюватися фармакокінетика ацетилсаліцилової кислоти.

Вплив на здатність керувати машинами та механізмами

Не існує даних, які б служили протипоказанням до керування автомобілями та застосування механізмів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

- Ацетилсаліцилова кислота заміщує або може бути заміщена у місцях зв'язування з білками іншими препаратами, які сильно зв'язуються з білками (наприклад, пероральні антитромботичні препарати, похідні сульфонілсечовини, гідантоїн, пеніцилін, сульфонаміди).
- Шляхом ацетилювання білків ацетилсаліцилова кислота може змінювати їх зв'язування з іншими препаратами, наприклад, ацетилований альбумін демонструє більшу афінність до фенілбутазону.
- Ацетилсаліцилова кислота може підсилювати дію:
 - гепарину та пероральних антитромботичних препаратів (після одночасного прийому більш ніж 3 г ацетилсаліцилової кислоти та інших препаратів підвищується ризик кровотечі);
 - тромболітиків, таких як стрептокіназа, альтеплаза;
 - пероральних антидіабетичних препаратів, наприклад, хлорпропаміду, толбутаміду. При одночасному прийомі цих препаратів у пацієнтів, які страждають на діабет, слід визначити концентрацію глюкози у сироватці крові, а при необхідності – змінити дозування. Після завершення лікування ацетилсаліциловою кислотою дозу антидіабетичного препарату слід підвищити;
 - метотрексату (концентрація метотрексату у сироватці підвищується у зв'язку з пригніченням його виведення через нирки; може розвинути панцитопенія);
 - вальпроєвої кислоти (може посилитися її побічна дія);
 - інших нестероїдних протизапальних препаратів (може посилитися їх побічна дія);
 - інших саліцилатів (може трапитися акумуляція препаратів та підвищитися їх токсичність);
 - кортикостероїдів (може посилитися їх побічна дія);
 - дигоксинів, барбітуратів та сполук літію.
- Ацетилсаліцилова кислота може знижувати ефект:
 - спіронолактону (незначною мірою знижується натрійуретична дія спіронолактону та абсорбція його активного метаболіту - канренону);
 - препаратів, що посилюють виділення сечової кислоти з сечею, наприклад, фенілбутазону, пробенециду, сульфінпіразону. Сульфінпіразон знижує виведення ацетилсаліцилової кислоти нирками.
- Одночасне застосування ацетилсаліцилової кислоти та інгібіторів карбоангідрази (наприклад, ацетазоламіду) може підвищувати концентрацію інгібіторів карбоангідрази шляхом конкурентного інгібування їх виведення нирковими канальцями (може посилюватися небажана дія, наприклад, може розвинути метаболічний ацидоз). Інгібітори карбоангідрази можуть також посилювати токсичність саліцилатів.
- Великі дози антацидних речовин знижують концентрацію саліцилатів в сироватці крові.
- Алкоголь підвищує частоту та інтенсивність кровотечі травного тракту, спричинену ацетилсаліциловою кислотою. Не слід одночасно приймати алкоголь та ацетилсаліцилову кислоту.

кислоту.

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі нижче 25 С у сухому, захищеному від світла місці, недоступному для дітей.

Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. Без рецепта.

Упаковка. По 25 таблеток у блістері; по 2 блістери в картонній коробці для дозування 75 мг;
по 10 таблеток у блістері; по 5 блістерів в картонній коробці для дозування 150 мг.

Виробник.

Фармацевтичний завод „Польфарма” С.А., Польща /
Pharmaceutical Works “Polpharma” S.A., Poland.

Адреса.

Вул. Пельплиньска, 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польща /
19 Pelplinska street, 83-200 Starogard Gdanski, Poland.