

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

АСПИРИН®

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата

Аспирин®.

Международное непатентованное наименование

Ацетилсалициловая кислота.

Лекарственная форма

Таблетки.

Состав

Одна таблетка содержит:

действующее вещество: ацетилсалициловая кислота – 500 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный.

Описание

Круглые, слегка двояковыпуклые, скошенные к краю таблетки белого цвета с оттиском в виде фирменного знака с одной стороны (байеровский крест)

В
А
BAY ER
Е
R

и «ASPIRIN 0,5» с обратной.

Фармакотерапевтическая группа

Анальгетики; другие анальгетики и антипиретики; салициловая кислота и ее производные.

Код АТХ: N02BA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия

Механизм обезболивающего, жаропонижающего и противовоспалительного действия ацетилсалициловой кислоты обусловлен угнетением синтеза простагландинов за счет необратимого ингибирования циклооксигеназы. Ацетилсалициловая кислота также ингибирует агрегацию тромбоцитов, блокируя синтез тромбоксана A₂ в тромбоцитах.

Фармакодинамические эффекты

В диапазоне доз 0,3–1,0 г ацетилсалициловая кислота применяется для лечения боли от лёгкой до умеренной и для снижения температуры, например, при простуде или гриппе, а также для лечения боли в суставах и мышцах.

Она также применяется для лечения острых и хронических воспалительных заболеваний, таких как ревматоидный артрит, остеоартрит и анкилозирующий спондилит.

Антиагрегантное действие ацетилсалициловой кислоты позволяет применять ее при различных сердечно-сосудистых заболеваниях в дозировках от 75 до 300 мг в день.

Фармакокинетика

Абсорбция

После приема внутрь ацетилсалициловая кислота быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Во время и после всасывания ацетилсалициловая кислота превращается в главный метаболит – салициловую кислоту. Сывороточные концентрации салицилатов очень вариабельны. Максимальные концентрации ацетилсалициловой кислоты и салициловой кислоты в плазме крови (C_{max}) достигаются приблизительно, через 18–30 минут и 0,72–2 часа после приема таблеток соответственно. Это время зависит от лекарственной формы.

Для Аспирина (таблетка 500 мг) средняя максимальная концентрация ацетилсалициловой кислоты в плазме (C_{max}) составляет 5,4 мкг/мл; среднее время достижения максимальной концентрации в плазме (T_{max}) составляет 30 минут; а средняя общая экспозиция ацетилсалициловой кислоты (площадь под кривой/AUC) составляет 6,2 мкг × ч/мл. Для салициловой кислоты средняя максимальная концентрация в плазме (C_{max}) составляет 25,4 мкг/мл; среднее время достижения максимальной концентрации в плазме (T_{max}) — 2 ч; а средняя общая экспозиция (площадь под кривой/AUC) — 145 мкг × ч/мл.

Распределение

Ацетилсалициловая кислота и салициловая кислота в значительной степени связываются с белками плазмы крови и быстро распределяются в организме. Салициловая кислота проникает через плаценту и выделяется с грудным молоком (см. раздел 4.6.).

Биотрансформация

Основным метаболитом ацетилсалициловой кислоты является салициловая кислота. Метаболизм салициловой кислоты осуществляется в печени с образованием салицируловой кислоты, фенольного глюкуронида салициловой кислоты, салицилглюкуронида и гентисуровой кислоты.

Элиминация

Выведение салициловой кислоты зависит от дозы, поскольку ее метаболизм ограничен возможностями ферментативной системы. Период полувыведения составляет от 2–3 часов при применении ацетилсалициловой кислоты в низких дозах и до 15 часов при применении препарата в высоких дозах. Салициловая кислота и ее метаболиты выводятся главным образом почками.

Показания к применению

Лекарственный препарат показан к применению у взрослых и детей в возрасте старше 12 лет.

- Для симптоматического облегчения головной боли, зубной боли, боли в горле, боли при менструациях, боли в мышцах и суставах, боли в спине.
- Повышенная температура тела при простудных и других инфекционно-воспалительных заболеваниях (у взрослых и детей старше 15 лет).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к ацетилсалициловой кислоте, другим нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП), (в т. ч. в анамнезе) или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата.
- Эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения), желудочно-кишечное кровотечение.
- Острая сердечная недостаточность.
- Сочетанное применение с метотрексатом в дозе 15 мг в неделю и более.
- Детский возраст до 12 лет.
- Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.
- Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в том числе в анамнезе).
- Беременность I триместр и в сроке более 20 недель.
- Период грудного вскармливания.
- Геморрагические диатезы (гемофилии, болезнь Виллебранда, телеангиоэктазии, гипопротромбинемия, тромбоцитопеническая пурпура).
- Выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени.
- Обострение воспалительных заболеваний кишечника (язвенный колит, болезнь Крона).
- Цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения.
- Дефицит витамина К.
- Одновременный прием пероральных антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе, превышающей 3000 мг в день.
- Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

Препарат не назначают детям до 15 лет с острыми респираторными заболеваниями, вызванными вирусными инфекциями, из-за риска развития синдрома Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печёночной недостаточности).

С осторожностью

При сопутствующем лечении антикоагулянтами, подагре, гиперурикемии, язвенной болезни желудка и/или двенадцатиперстной кишки (в анамнезе), включая хроническое или рецидивирующее течение язвенной болезни, а также бронхиальной астме, полипозе носа, хронических бронхо-легочных заболеваниях; при нарушении функции почек и/или печени; беременности II триместр до 20 недели; склонности к аллергии; уратном нефролитиазе, хронической обструктивной болезни легких; сенной лихорадке, лекарственной аллергии; одновременном приеме пероральных антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе

менее 3000 мг в сутки; одновременном приеме с метотрексатом в дозе менее 15 мг/нед.; метроррагии (ациклических маточных кровотечений); гиперменорее (обильных и продолжительных менструациях).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Противопоказано применение препарата во время беременности в I триместре и в сроке более 20 недель беременности. С осторожностью применяют при беременности - II триместр до 20 недели. Применение больших доз салицилатов в I триместре беременности ассоциируется с повышенной частотой дефектов развития плода (расщепленное небо, пороки сердца). При применении НПВП у женщин с 20-й недели беременности возможно развитие маловодия и/или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция).

Период грудного вскармливания

Салицилаты и их метаболиты в небольших количествах проникают в грудное молоко.

Применение препарата в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Принимать внутрь, после еды, запивая большим количеством жидкости.

Препарат предназначен для взрослых и детей старше 12 лет. У детей в возрасте от 12 до 15 лет: разовая доза составляет 500 мг, максимальная разовая доза — 500 мг. Интервалы между приемами препарата должны быть не менее 4 часов. Максимальная суточная доза не должна превышать 1500 мг (3 таблетки).

У детей в возрасте от 15 лет и взрослых: разовая доза составляет 500–1000 мг, максимальная разовая доза 1000 мг. Интервалы между приемами препарата должны быть не менее 4 часов. Максимальная суточная доза не должна превышать 3000 мг (6 таблеток).

Длительность лечения (без консультации с врачом) не должна превышать 5 дней при назначении в качестве обезболивающего средства и более 3 дней — в качестве жаропонижающего средства.

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Препарат Аспирин® следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции почек, при выраженной почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) препарат противопоказан.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Препарат Аспирин® следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени, при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени препарат противопоказан.

Побочное действие

По частоте возникновения побочные действия классифицируются следующим образом: часто ($>1/100$ до $<1/10$), нечасто ($>1/1000$ до $<1/100$), редко ($>1/10\ 000$ до $<1/1000$), очень редко, включая отдельные сообщения ($<1/10\ 000$), частота не установлена.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

Часто: кровотечения, такие как кровотечения при вмешательствах, гематомы, эпистаксис.

Нечасто: мочеполовые кровотечения и кровоточивость десен. Геморрагический синдром (носовое кровотечение, кровоточивость десен, геморрагическая сыпь), увеличение времени свертываемости крови. Данные эффекты сохраняются на протяжении 4–8 дней с момента прекращения приема препарата и должны быть учтены при планировании последующих операций для пациентов.

Частота неизвестна: геморрагическая или железодефицитная анемия (например, из-за оккультного микрокровотечения) с соответствующими лабораторными и клиническими признаками и симптомами, такими как астения, бледность, гипоперфузия.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота не установлена: обострение респираторных заболеваний; легкие и умеренные реакции, потенциально затрагивающие кожу, дыхательные пути, желудочно-кишечный тракт и сердечно-сосудистую систему, включая такие симптомы, как сыпь, крапивница, отек, зуд, ринит, заложенность носа, кардиореспираторные нарушения; формирование на основе гаптенного механизма «аспириновой» триады (сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух, и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и препаратов пиразолонового ряда).

Нарушения со стороны нервной системы

Нечасто: головная боль, в отдельных случаях – снижение остроты слуха.

Частота не установлена: головокружение, шум в ушах (обычно в случае передозировки).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Редко: воспаление ЖКТ и язвенные поражения ЖКТ.

Очень редко: кровотечения и перфорации язв ЖКТ, с соответствующими лабораторными и клиническими признаками и симптомами.

Частота не установлена: образование стриктур «диафрагм» в кишечнике (особенно при длительном применении); расстройства верхних и нижних отделов ЖКТ (диспепсия, желудочно-кишечные и абдоминальные боли).

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Очень редко: перемежающиеся нарушения функции печени с повышением уровня печеночных трансаминаз; синдром Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печеночной недостаточности)

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Очень редко: почечная недостаточность, тяжелое повреждение почек.

Передозировка

Токсичность салицилатов (может развиваться в случае приема более 100 мг/кг/сут на

протяжении 2 дней) может быть вызвана длительным приемом токсических доз препарата в рамках неправильного применения препарата – хроническая интоксикация, или острыми отравлениями, случайными и намеренными – передозировкой.

Передозировка особенно опасна у пациентов пожилого возраста.

Хроническая интоксикация салицилатами

Может протекать незаметно, поскольку признаки и симптомы не являются специфичными. Слабо выраженная хроническая интоксикация салицилатами, салицилизм, обычно возникает только при многократном приеме больших доз.

Симптомы: головокружение, вертиго, шум в ушах, глухота, потливость, тошнота и рвота, головная боль и затуманенность сознания.

Лечение: в большинстве случаев достаточно уменьшения дозы препарата.

Острая интоксикация салицилатами

Симптомы: тяжелое нарушение кислотно-основного равновесия, проявления которого могут варьировать в зависимости от возраста пациента и степени тяжести интоксикации. У детей наиболее типичным является развитие метаболического ацидоза. Степень тяжести отравления невозможно оценить только по концентрации салицилатов в плазме, поскольку скорость всасывания ацетилсалициловой кислоты может снижаться из-за замедленного опорожнения желудка, образования конкрементов или приема кишечнорастворимых препаратов. Шум в ушах может возникать при концентрации салицилатов в плазме от 150 до 300 мкг/мл. Другие серьезные побочные эффекты могут возникать при концентрации выше 300 мкг/мл. Интоксикация легкой и средней степени тяжести проявляется тошнотой, рвотой, тахипноэ, гипервентиляцией, респираторным алкалозом и потоотделением.

Признаки интоксикации средней и тяжелой степени включают: респираторный алкалоз с компенсаторным метаболическим ацидозом, гиперпирексию, нарушение метаболизма глюкозы и кетоз, шум в ушах, глухоту, желудочно-кишечное кровотечение, респираторные нарушения (от гипервентиляции до остановки дыхания), сердечно-сосудистые нарушения (от аритмии до кардиоваскулярного шока), водно-электролитный дисбаланс (от обезвоживания до почечной недостаточности), гематологические нарушения (от ингибирования тромбоцитов до коагулопатии), токсическую энцефалопатию и угнетение центральной нервной системы (от летаргии до комы и судорог).

Лечение: проводится в соответствии с принятыми стандартами и зависит от степени тяжести интоксикации и клинической картины интоксикации, и должно быть направлено главным образом на ускорение выведения препарата из организма и восстановление водно-электролитного и кислотно-основного балансов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ацетилсалициловая кислота усиливает действие следующих лекарственных препаратов вплоть до повышения риска побочных эффектов:

- Антикоагулянты/тромболитики: ацетилсалициловая кислота может увеличить риск кровотечения, если она была принята до начала тромболитической терапии. Поэтому пациенты, которым предстоит лечение тромболитиком, должны находиться под тщательным наблюдением на предмет признаков внешнего или внутреннего кровотечения;
- Ингибиторы агрегации тромбоцитов, например, тиклопидин, клопидогрель: повышенный риск кровотечений;

- Другие нестероидные анальгетики/противовоспалительные препараты (в дозе 3 г ацетилсалициловой кислоты или более в день): повышенный риск развития язв желудочно-кишечного тракта и кровотечений;
- Системные глюкокортикоиды (за исключением гидрокортизона в качестве заместительной терапии при болезни Аддисона): повышенный риск побочных эффектов со стороны желудочно-кишечного тракта;
- Алкоголь: повышенный риск развития язв желудочно-кишечного тракта и кровотечений;
- Дигоксин: увеличение концентрации в плазме крови;
- Противодиабетические препараты: понижение уровня сахара в крови;
- Метотрексат: снижение экскреции и вытеснение салицилатами из связывания с белками плазмы (см. раздел 4.3);
- Вальпроевая кислота: вытеснение салицилатами из связывания с белками плазмы;
- Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС): повышенный риск желудочно-кишечных кровотечений из-за синергетического эффекта.

Ацетилсалициловая кислота снижает эффекты следующих лекарственных препаратов:

- Диуретики (в дозах от 3 г ацетилсалициловой кислоты и более в день);
- Ингибиторы АПФ (в дозе 3 г ацетилсалициловой кислоты и более в день);
- Урикозурические препараты (например, пробенецид, бензбромарон).

Особые указания

Детям до 15 лет с острыми респираторными заболеваниями, вызванными вирусными инфекциями, нельзя назначать препарат, содержащий ацетилсалициловую кислоту, поскольку в случае вирусной инфекции повышается риск возникновения синдрома Рейе. Симптомами синдрома Рейе являются: продолжительная рвота, острая энцефалопатия, увеличение печени.

Ацетилсалициловая кислота может вызвать бронхоспазм, приступ бронхиальной астмы или другие реакции повышенной чувствительности. Факторами риска являются наличие бронхиальной астмы в анамнезе, лихорадки, полипов носа, хронических бронхолегочных заболеваний, случаев аллергии в анамнезе (аллергические риниты, высыпания на коже).

Ацетилсалициловая кислота может повышать склонность к кровоточивости, что связано с ее ингибирующим влиянием на агрегацию тромбоцитов. Это следует учитывать при необходимости хирургического вмешательства, включая небольшие вмешательства, как удаление зуба. Перед хирургическим вмешательством, для уменьшения кровоточивости в ходе операции и в послеоперационном периоде, следует отменить прием препарата за 5–7 дней и поставить в известность врача.

При применении ацетилсалициловой кислоты были зарегистрированы случаи острой ишемии миокарда с инфарктом миокарда или без него в рамках реакции гиперчувствительности (синдром Коуниса). В случае возникновения синдрома Коуниса на фоне лечения ацетилсалициловой кислотой немедленно прекратите применение препарата Аспирин®.

Ацетилсалициловая кислота уменьшает выведение мочевой кислоты из организма, что может стать причиной острого приступа подагры у предрасположенных пациентов.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Препарат Аспирин® не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Форма выпуска

Таблетки 500 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ/алюминиевой фольги.

1, 2 или 10 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С.

Срок годности

5 лет. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Держатель регистрационного удостоверения:

АО «БАЙЕР», Российская Федерация
107113, г. Москва, ул. 3-я Рыбинская, д. 18, стр. 2

Производитель:

Байер Биттерфельд ГмбХ,
Ортштейл Греппин, Салегастер шоссе 1,
06803 Биттерфельд-Вольфен, Германия

Организация, принимающая претензии потребителей:

Российская Федерация
АО «БАЙЕР»
107113, г. Москва, ул. 3-я Рыбинская, д. 18, стр. 2
Телефон: +7 495 231 12 00
Электронная почта: ru.communications@bayer.ru