МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения Аспинат® плюс

Регистрационный номер:
Торговое название: Аспинат® плюс
Международное непатентованное название или группировочное название: Ацетилсалициловая кислота + Кофеин
Лекарственная форма: таблетки.
Состав на одну таблетку
Одна таблетка содержит:
активные вещества: ацетилсалициловая кислота - 500 мг;
кофеин – 50 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 35 мг, крахмал кукурузный – 84 мг, повидон – 10 мг, стеариновая кислота – 7 мг, кросповидон – 14 мг.
Описание
Таблетки белого или белого с желтоватым или кремоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.
Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее средство комбинированное (нестероидное противовоспалительное средство + психостимулирующее средство).
Код АТХ: [N02BA71].

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Комбинированный препарат, действие которого определяется компонентами, входящими в его состав. Комбинация компонентов препарата обеспечивает лучшую переносимость симптомов недомогания и лихорадки при «простудных» и других инфекционно-воспалительных заболеваниях, снижение болевого синдрома различного происхождения.
Ацетилсалициловая кислота оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, связанное с подавлением циклооксигеназы 1 и 2, регулирующих синтез простагландинов. В результате не образуются простагландины, обеспечивающие формирование отека и гипералъгезии. Снижение содержания простагландинов (преимущественно Е1) в центре терморегуляции приводит к снижению температуры тела вследствие расширения сосудов кожи и возрастания потоотделения. Обезболивающий эффект обусловлен как центральным, так и периферическим действием. Уменьшает агрегацию, адгезивность тромбоцитов и тромбообразование за счет подавления синтеза тромбоксана А2 в тромбоцитах. Антиагрегантный эффект сохраняется в течение 7 суток после однократного приема (больше выражен у мужчин, чем у женщин).
Кофеин повышает рефлекторную возбудимость спинного мозга, возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры, расширяет кровеносные сосуды скелетных мышц, головного мозга, сердца, почек, снижает агрегацию тромбоцитов, уменьшает сонливость и чувство усталости, повышает умственную и физическую работоспособность.

Фармакокинетика
Ацетилсалициловая кислота во время абсорбции подвергается системной элиминации в стенке кишечника и в печени (деацетилируется). Абсорбированная часть быстро гидролизуется холинэстеразами плазмы и альбуминэстеразой, поэтому период

полувыведения (T1/2) - не более 15-20 мин. В организме циркулирует (на 75-90% в связи с альбумином) и распределяется в тканях в виде аниона салициловой кислоты. Максимальная концентрация (Cmax) салициловой кислоты достигается примерно через 2 часа. Легко проникает во многие ткани и жидкости организма, в том числе в спинномозговую жидкость, перитонеальную и синовиальную жидкости. Проникновение в полость сустава ускоряется при наличии гиперемии и отека и замедляется в пролиферативной фазе воспаления. В небольших количествах салицилаты обнаруживаются в нервной ткани, следы - в желчи, поте, фекалиях. При возникновении ацидоза большая часть салицилата превращается в неионизированную кислоту, хорошо проникающую в ткани, в том числе в головной мозг. Быстро проходит через плаценту, в небольших количествах выводится с грудным молоком. Метаболизируется преимущественно в печени с образованием 4 метаболитов, обнаруживаемых во многих тканях и моче. Выводится преимущественно путем активной секреции в канальцах почек в виде собственно салициловой кислоты (60%) и ее метаболитов. Выведение неизмененного салицилата зависит от pH мочи (при защелачивании мочи возрастает ионизирование салицилатов, ухудшается их реабсорбция и значительно увеличивается выведение). Скорость выведения зависит от дозы: при приеме небольших доз T1/2 - 2-3 часа, с увеличением дозы может возрастать до 15-30 часов.

Всасывание кофеина происходит в основном за счет простой диффузии. Cmax - достигается примерно через 50-75 мин после приема внутрь. Быстро распределяется во всех органах и тканях организма; легко проникает через гематоэнцефалический барьер и плаценту. Связь с белками крови (альбуминами) - 25-36%. Метаболизируется преимущественно в печени. У взрослых около 80% дозы кофеина метаболизируется в параксантин, около 10% - в теобромин и около 4% - в теофиллин. Эти соединения впоследствии деметилируются в монометилксантины, а затем в метилированные производные мочевой кислоты. T1/2 у взрослых – 3,9 - 5,3 часа (иногда - до 10 часов). Выведение кофеина и его метаболитов осуществляется почками.

Показания к применению

- Умеренно или слабо выраженный болевой синдром различного происхождения (головная боль, зубная боль, мигрень, невралгия, артралгия, люмбаго, корешковый синдром, мышечная боль, боли при менструациях).
- 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), ксантинам и другим компонентам препарата;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения);
- желудочно-кишечное кровотечение;
- гемофилия, геморрагический диатез, гипопротромбинемия;
- бронхиальная астма, индуцированная приемом салицилатов и других НПВП;
- полное или не полное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты;
- органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в том числе острый инфаркт миокарда, атеросклероз, расслаивающаяся аневризма аорты);
- артериальная гипертензия, портальная гипертензия;
- глаукома;
- почечная недостаточность;
- тревожные расстройства, повышенная возбудимость, нарушение сна;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- одновременный прием с метотрексатом в дозе более 15 мг в неделю;
- детям до 6 лет при болевом синдроме (для данной лекарственной формы);

- детям и подросткам в возрасте до 15 лет (при применении в качестве жаропонижающего) с острыми респираторными заболеваниями, вызванными вирусными инфекциями, в связи с риском развития синдрома Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печеночной недостаточности).
-беременность (I и III триместр);
-период лактации.

С осторожностью

С осторожностью назначают при подагре, гиперурикемии, т.к. ацетилсалициловая кислота в небольших дозах может спровоцировать приступ подагры у предрасположенных к развитию подагры пациентов (со сниженным выведением мочевой кислоты из организма).
Следует соблюдать осторожность при наличии в анамнезе язвенных поражений желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), желудочно-кишечных кровотечений, почечной и печеночной недостаточности. Также необходимо соблюдать осторожность при дефиците витамина К и глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.
Одновременный прием ацетилсалициловой кислоты с метотрексатом в дозах менее 15 мг в неделю может приводить к повышению частоты возникновения побочных эффектов со стороны органов кроветворения.
Применение ацетилсалициловой кислоты может вызвать бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой, сенной лихорадкой, полипозом слизистой оболочки носа, хроническими заболеваниями дыхательных путей, аллергическими реакциями на другие лекарственные средства.
Следует учитывать, что при одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой усиливается действие гепарина и непрямых антикоагулянтов.
Следует соблюдать осторожность лицам с эпилепсией и имеющим склонность к судорожным припадкам, ввиду того, что кофеин снижает защитное действие противоэпилептических лекарственных средств.

Применение при беременности и в период лактации

Обладает тератогенным действием: при применении в I триместре беременности приводит к возникновению у плода расщепления верхнего неба, в III триместре - вызывает торможение родовой деятельности (подавление синтеза простагландинов), преждевременное закрытие артериального протока у плода, гиперплазию легочных сосудов и гипертензию в малом круге кровообращения. Прием препарата во II триместре возможен в том случае, если потенциальная польза для матери превышает риск для плода.
Салицилаты и их метаболиты в небольших количествах проникают в грудное молоко, на время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутрь. Для уменьшения раздражающего действия на ЖКТ препарат следует принимать после еды, запивая водой, молоком, щелочной минеральной водой.
Для лечения болевого синдрома и повышенной температуры тела взрослым и детям старше 15 лет по 1-2 таблетки; максимальная разовая доза 2 таблетки; максимальная суточная доза 6 таблеток.
Для лечения болевого синдрома, за исключением состояний при острых респираторных заболеваниях, вызванных вирусными инфекциями (риск развития синдрома Рейе) детям в возрасте от 6 до 12 лет 1/2 таблетки, от 12 до 15 лет 1/2 - 1 таблетку.
Разовую дозу при необходимости принимают 3-4 раза в сутки с интервалом не менее 4 часов.
Длительность лечения (без консультации с врачом) не должна превышать 7 дней при назначении в качестве обезболивающего средства и 3 дней - в качестве жаропонижающего средства.

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, снижение аппетита, гастралгия, диарея.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения, анемия, лейкопения.

Аллергические реакции: кожная сыпь, ангионевротический отек, бронхоспазм.

Со стороны центральной нервной системы: бессонница.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, повышение артериального давления.

Прочие: нарушение функции печени и/или почек; синдром Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с быстрым развитием печеночной недостаточности).

При длительном применении могут возникать: головокружение, головная боль, рвота, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, гипокоагуляция, кровотечения (в том числе в ЖКТ), нарушения зрения, снижение остроты слуха, шум в ушах, бронхоспазм, интерстициальный нефрит, преренальная азотемия с гиперкреатининемией и гиперкальциемией, папиллярный некроз, острая почечная недостаточность, нефротический синдром, асептический менингит, усиление симптомов хронической сердечной недостаточности, отеки, повышение активности "печеночных" трансаминаз.

При появлении подобных симптомов рекомендуется прекратить прием препарата и немедленно обратиться к лечащему врачу.

Передозировка

Симптомы передозировки, обусловленые ацетилсалициловой кислотой, могут возникать после однократного приема большой дозы или при длительном применении. Если однократная доза меньше 150 мг/кг, острое отравление считают легким, 150 - 300мг/кг - умеренным и при применении в дозах более 300 мг/кг – тяжелым.

Симптомы: При легком отравлении - синдром салицилизма (тошнота, рвота, шум в ушах, нарушение зрения, головокружение, сильная головная боль, общее недомогание, лихорадка - плохой прогностический признак у взрослых).

При значительной передозировке - спутанность сознания, сонливость, судороги и кома, тремор, некардиогенный отек легких, одышка, удушье, нарушения водно-электролитного баланса, почечная недостаточность, коллапс и шок.

Наибольший риск развития хронической интоксикации отмечается у лиц пожилого возраста при приеме в течение нескольких суток более 100 мг/кг/сут. У детей и пациентов пожилого возраста начальные признаки салицилизма не всегда заметны, поэтому целесообразно периодически определять содержание салицилатов в крови: концентрация выше 70 мг% свидетельствует об умеренном или тяжелом отравлении; выше 100 мг% - о крайне тяжелом, прогностически неблагоприятном. При отравлении средней и тяжелой степени необходима госпитализация.

Лечение: Провокация рвоты, назначение активированного угля и слабительных, ощелачивание мочи (показано при концентрации салицилатов выше 40 мг%, обеспечивается в/в инфузией натрия гидрокарбоната - 88 мэкв в 1 л 5% раствора декстрозы, со скоростью 10-15 мл/кг/ч), восстановление объема циркулирующей крови и индукция диуреза (достигается введением раствора натрия гидрокарбоната в той же дозе и разведении, повторяют 2-3 раза); следует иметь в виду, что интенсивная инфузия жидкости пожилым может привести к отеку легких. Не рекомендуется применение ацетазоламида для ощелачивания мочи (может вызывать ацидоз и усилить токсическое действие салицилатов). Гемодиализ показан при концентрации салицилатов более 100-130 мг%, а у больных с хроническим отравлением - 40 мг% и ниже при наличии показаний (рефрактерный ацидоз, прогрессирующее ухудшение состояния, тяжелое поражение центральной нервной системы, отек легких и почечная недостаточность). При отеке легких показана искусственная вентиляция легких смесью, обогащенной кислородом, в режиме положительного давления в конце выдоха; для лечения отека мозга применяют гипервентиляцию и осмотический диурез.

Кофеин в дозах более 300 мг/сут (в том числе на фоне злоупотребления кофе - более 4 чашек натурального кофе по 150 мл) может вызывать состояние тревоги, тремор, головную боль, спутанность сознания, экстрасистолию. *Лечение:* Провокация рвоты, прием активированного угля.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ацетилсалициловая кислота усиливает токсичность метотрексата, снижая его почечный клиренс, эффекты наркотических анальгетиков, других НПВП, пероральных гипогликемических препаратов, гепарина, непрямых антикоагулянтов, тромболитиков и антиагрегантов; снижает эффект урикозурических лекарственных средств (бензбромарон, сульфинпиразон), гипотензивных средств, диуретиков (спиронолактон, фуросемид); повышает концентрацию дигоксина, барбитуратов, солей лития в плазме. Глюкокортикостероиды, этанол и этанолсодержащие лекарственные средства усиливают негативное воздействие на слизистую оболочку ЖКТ и повышают риск развития желудочно-кишечных кровотечений. Антациды, содержащие магний и/или алюминий, замедляют и ухудшают всасывание ацетилсалициловой кислоты. Миелотоксичные лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Кофеин снижает эффект наркотических анальгетиков и снотворных лекарственных средств, снижает всасывание препаратов Ca^{2+} в ЖКТ, увеличивает выведение препаратов Li^{+} с мочой, ускоряет всасывание и усиливает действие сердечных гликозидов, повышает их токсичность. Совместное применение кофеина с бета-адреноблокаторами может приводить к взаимному подавлению терапевтических эффектов. Мексилетин - снижает выведение кофеина до 50%; никотин - увеличивает скорость выведения кофеина.

Особые указания

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.

Следует учитывать, что у предрасположенных пациентов ацетилсалициловая кислота (даже в небольших дозах) уменьшает выведение мочевой кислоты из организма и может стать причиной развития острого приступа подагры.

Во время лечения следует отказаться от употребления алкоголя (повышение риска желудочно-кишечного кровотечения).

Чрезмерное употребление кофеинсодержащих продуктов (кофе, чай) на фоне лечения может вызвать симптомы передозировки кофеином.

Форма выпуска

Таблетки 500 мг + 50 мг.

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1 контурную ячейковую упаковку вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Претензии от покупателей принимает предприятие-производитель
ОАО «Валента Фармацевтика»
141101 Московская область, г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2,
тел: (495) 933 48 62, факс: (495) 933 48 63

Генеральный директор
ОАО «Валента Фармацевтика» С.А. Окуньков