

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Ацетилсалициловая кислота

Регистрационный номер

Торговое наименование

Ацетилсалициловая кислота

Международное непатентованное или группировочное наименование

Ацетилсалициловая кислота

Лекарственная форма

Таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

Действующее вещество: ацетилсалициловая кислота - 250 мг и 500 мг.

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, повидон К-17 (поливинилпирролидон низкомолекулярный), лимонной кислоты моногидрат, тальк, кальция стеарат.

Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской и риской без запаха или со слабым характерным запахом. Допускается мраморность поверхности таблеток.

Фармакотерапевтическая группа: Анальгетики; другие анальгетики и антипиретики; салициловая кислота и ее производные.

Код АТХ: N02BA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Препарат оказывает обезболивающее, жаропонижающее, противовоспалительное действие, что обусловлено ингибированием циклооксигеназ, участвующих в синтезе простагландинов. Ацетилсалициловая кислота ингибирует агрегацию тромбоцитов, блокируя синтез тромбосана А₂.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь абсорбция полная. Во время абсорбции подвергается системной эли-

минации в стенке кишечника и в печени (деацетируется). Резорбированная часть быстро гидролизуется эстеразами, поэтому период полувыведения ($T_{1/2}$) – не более 15–20 мин. В организме циркулирует (на 75–90 % в связи с альбумином) и распределяется в тканях в виде аниона салициловой кислоты.

Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (TC_{max}) – 2 ч. Сывороточный уровень салицилатов весьма вариабелен.

Распределение

Салицилаты легко проникают во многие ткани и жидкости организма, в т.ч. в спинномозговую, 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 мозговой ткани, следы - в желчи, поте, фекалиях. При возникновении ацидоза большая часть салициловой кислоты превращается в неионизированную кислоту, хорошо проникающую в ткани, в т.ч. в мозг. Проникает через плаценту, в небольших количествах выделяется в грудное молоко.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется преимущественно в печени с образованием 4 метаболитов, обнаруживаемых во многих тканях и моче.

Выводится преимущественно путем активной секреции в канальцах почек в неизменном виде (60 %) и в виде метаболитов. Выведение неизменного салицилата зависит от pH мочи (при подщелачивании мочи возрастает ионизирование салицилатов, ухудшается их реабсорбция и значительно увеличивается выведение). Скорость выведения зависит от дозы: при приеме низких доз $T_{1/2}$ – 2–3 ч, с увеличением дозы может возрастать до 15 ч.

Показания к применению

Симптоматическое лечение у взрослых при умеренном или слабо выраженном болевом синдроме различного происхождения: головная боль (в том числе связанная с алкогольным абстинентным синдромом), зубная боль, мигрень, боль в горле, невралгия, корешковый синдром, мышечные и суставные боли, альгодисменорея (боли при менструациях).

Лихорадочный синдром 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) или к любым вспомогательным веществам препарата;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения), желудочно-кишечное кровотечение;

- геморрагические диатезы (гемофилии, болезнь Виллебранда, телеангиоэктазии, гипопротромбинемия, тромбоцитопения, тромбоцитопеническая пурпура);
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в т.ч. в анамнезе);
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- беременность I триместр и в сроке более 20 недель, период грудного вскармливания;
- детский возраст до 15 лет;
- 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 с метотрексатом в дозе 15 мг/нед и более;
- одновременный прием пероральных антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе, превышающей 3 г в сутки;
- выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

С осторожностью

Гиперурикемия, уратный нефролитиаз, подагра, язвенная болезнь желудка и/или двенадцатиперстной кишки или желудочно-кишечные кровотечения (в анамнезе), почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30–60 мл/мин), печеночная недостаточность, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких, полипоз носа, сенная лихорадка, лекарственная аллергия, беременность (II триместр до 20 недели), одновременный прием антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе менее 3 г в сутки, одновременный прием метотрексата в дозе менее 15 мг/нед, метроррагия (ациклические маточные кровотечения), гиперменорея (обильные и продолжительные менструации).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

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 недели беременности возможно развитие маловодия и/или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция).

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

В период грудного вскармливания прием препарата противопоказан.

Способ применения и дозы

Внутрь, после еды, запивая большим количеством жидкости.

Препарат предназначен для взрослых и детей старше 15 лет.

Разовая доза составляет 500 мг, максимальная разовая доза – 1000 мг (2 таблетки по 500 мг), максимальная суточная – 3000 мг (6 таблеток по 500 мг).

Разовую дозу при необходимости можно принимать 3-4 раза в сутки с интервалом не менее 4 ч.

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 реакций со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Побочное действие

Для оценки частоты развития нежелательных реакций используют следующую классификацию ВОЗ: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна – не может быть определена по имеющимся данным.

Со стороны крови и лимфатической системы: нечасто – 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.

Со стороны иммунной системы: часто – кожная сыпь; очень редко – бронхоспазм, отек Квинке. Формирование на основе гаптенного механизма «аспириновой» триады (сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух, и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и препаратов пиразолонового ряда).

Со стороны нервной системы: нечасто – головная боль, головокружение; в отдельных случаях – снижение остроты слуха, звон в ушах.

Желудочно-кишечные нарушения: часто – тошнота, рвота, боли в эпигастральной области, снижение аппетита; редко – диарея, желудочно-кишечные кровотечения (рвота типа «кофейной гущи», черный «дегтеобразный» стул); очень редко – повышение активности «печеночных» трансаминаз, в отдельных случаях – язва, прободение желудка.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко – синдром Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печеночной недостаточности).

Передозировка

Симптомы (однократная доза менее 150 мг/кг – отравление считается легким, 150-300 мг/кг – умеренным, более 300 мг/кг – тяжелым): синдром салицилизма (тошнота, рвота, шум в ушах, нарушение зрения, головокружение, сильная головная боль, общее недомогание, лихорадка – плохой прогностический признак у взрослых). Тяжелое отравление – гипервентиляция легких центрального генеза, респираторный алкалоз, метаболический ацидоз, спутанное сознание, сонливость, коллапс, судороги, анурия, кровотечения. Первоначально центральная гипервентиляция легких приводит к дыхательному алкалозу – одышка, удушье, цианоз, холодный липкий пот; с усилением интоксикации нарастает паралич дыхания и разобщение окислительного фосфорилирования, вызывающие респираторный ацидоз.

При хронической передозировке концентрация, определяемая в плазме, плохо коррелирует со степенью тяжести интоксикации. 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 и 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, постоянный контроль за кислотно-основным состоянием (КОС) и электролитным балансом; в зависимости от состояния обмена веществ – введение натрия гидрокарбоната, раствора натрия цитрата или натрия лактата. Повышение резервной щелочности усиливает выведение ацетилсалициловой кислоты за счет защелачивания мочи. Защелачивание мочи показано при концентрации салицилатов выше 40 мг% и обеспечивается внутривенной инфузией натрия гидрокарбоната (88 мЭкв в 1 л 5 % раствора декстрозы, со скоростью 10–15 мл/ч/кг); восстановление объема циркулирующей крови (ОЦК) и индукция диуреза достигаются введением натрия гидрокарбоната в тех же дозах и разведении, которое повторяют 2–3 раза. Следует соблюдать осторожность у пожилых больных, у которых интенсивная инфузия жидкости может привести к отеку легких. Не рекомендуется применение ацетазоламида для защелачивания мочи (может вызвать ацидоз и усилить токсическое действие салицилатов). Гемодиализ показан при концентрации салицилатов более 100–130 мг%, 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 – искусственная вентиляция легких смесью, обогащенной кислородом.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Ацетилсалициловая кислота усиливает токсичность метотрексата (снижает его почечный клиренс), вальпроевой кислоты; усиливает эффекты наркотических анальгетиков, других НПВП, пероральных гипогликемических препаратов, гепарина, непрямых антикоагулянтов, тромболитиков и ингибиторов агрегации тромбоцитов, сульфаниламидов (в т.ч. котримоксазола), трийодтиронина; снижает эффект урикозурических препаратов (бензбромарон, сульфинпиразон), гипотензивных средств и диуретиков (спиронолактон, фуросемид).

Глюкокортикостероиды, алкоголь и алкогольсодержащие препараты увеличивают повреждающее действие на слизистую оболочку ЖКТ, повышают риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Ацетилсалициловая кислота повышает концентрацию дигоксина, барбитуратов и солей лития в плазме крови.

Антациды, содержащие магния и/или алюминия гидроксид, замедляют и ухудшают всасывание ацетилсалициловой кислоты.

Особые указания

Детям до 15 лет нельзя назначать препарат, содержащий ацетилсалициловую кислоту, поскольку в случае вирусной инфекции повышается риск развития синдрома Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печеночной недостаточности). 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, сенной лихорадки, полипоза носа, хронических заболеваний органов дыхания, 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 постоперационном периоде, следует отменить прием препарата за 5-7 дней и поставить в известность врача.

При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

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

При длительном применении препарата следует периодически проводить общий анализ крови и анализ кала на скрытую кровь, контролировать функциональное состояние печени.

В период лечения следует воздерживаться от приема этанола.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо соблюдать осторожность в период лечения при вождении транспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты развития психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки 250 мг и 500 мг.

По 10 таблеток в контурную безъячейковую упаковку из материала упаковочного комбинированного на бумажной основе.

1, 2, 3, 4, 5 контурные безъячейковые упаковки по 10 таблеток вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5 контурные ячейковые упаковки по 10 таблеток вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Контурные безъячейковые упаковки с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в ящик или коробку из картона гофрированного.

Контурные ячейковые упаковки с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в ящик или коробку из картона гофрированного.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель

АО "Татхимфармпрепараты", Россия

420091, Республика Татарстан, г. Казань, ул. Беломорская, д. 260

тел.: 8 800 201 98 88, тел./факс: +7 (843) 571-85-58

e-mail: marketing@tatpharm.ru

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии от потребителей

АО "Татхимфармпрепараты", Россия

420091, Республика Татарстан, г. Казань, ул. Беломорская, д. 260

тел.: 8 800 201 98 88, тел./факс: +7 (843) 571-85-58

e-mail: marketing@tatpharm.ru