



ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Ацетилсалициловая кислота

Регистрационный номер: ЛП №(001835)-(РГ-RU)

Торговое наименование: Ацетилсалициловая кислота

Международное непатентованное или группировочное наименование:
ацетилсалициловая кислота

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

Действующее вещество:

Ацетилсалициловая кислота – 500,000 мг

Вспомогательные вещества:

крахмал картофельный –83,632 мг

лимонной кислоты моногидрат –0,168 мг

тальк –16,200 мг

Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета, слегка мраморные, с фаской и риской, без запаха или со слабым характерным запахом.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).



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 тромбоксана А₂.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь абсорбция полная. Во время абсорбции подвергается пресистемной элиминации в стенке кишечника и в печени (деацетируется).

Распределение

Абсорбированная часть быстро гидролизуется неспецифическими холинэстеразами плазмы и альбуминэстеразой, 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 (T_{max}) – 2 ч. Сывороточная концентрация салицилатов весьма вариабельна. Салицилаты легко проникают во многие ткани и жидкости организма, в том числе 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 нервной ткани, следы – в желчи, поте, фекалиях. При возникновении ацидоза большая часть салициловой кислоты превращается в неионизированную кислоту, хорошо проникающую в ткани, в том числе в мозг. Быстро проходит через плаценту, в небольших количествах проникает в грудное молоко.

Метаболизм

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

Выведение

Выводится преимущественно путем активной секреции в канальцах почек в виде салициловой кислоты (60 %) и в виде метаболитов. Выведение салициловой кислоты зависит от рН мочи (при подщелачивании мочи возрастает ионизирование салицилатов, ухудшается их реабсорбция и значительно увеличивается выведение). Скорость выведения зависит от дозы: при приеме небольших доз $T_{1/2}$ – 2–3 ч, с увеличением дозы может возрастать до 15–30 ч.

Показания к применению

- Лечение умеренного или слабовыраженного болевого синдрома: головная боль (в том числе связанная с алкогольным абстинентным синдромом), зубная боль, мигрень, боль в горле, боль в спине и мышцах, боль в суставах, невралгия, корешковый синдром, 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 и другим нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП) или другим компонентам препарата;
- детский возраст до 15 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;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) (в фазе обострения);
- желудочно-кишечное кровотечение;
- 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;
- одновременное применение с метотрексатом в дозе 15 мг/день и более;
- одновременный прием пероральных антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе, превышающей 3000 мг в день;
- выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

С осторожностью

При подагре, язвенной болезни желудка и/или двенадцатиперстной кишки (в анамнезе), включая хроническое или рецидивирующее течение язвенной болезни, или эпизоды желудочно-кишечных кровотечений; при почечной и/или печеночной недостаточности; гиперурикемии, бронхиальной астме, хронической обструктивной болезни легких, сенной лихорадке, полипозе носа, лекарственной аллергии, одновременном приеме метотрексата в дозе менее 15 мг/нед., беременности (II триместр).

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

Внутрь. После еды, запивая водой или щелочной минеральной водой.

Взрослым и детям старше 15 лет: разовая доза составляет 500 мг, максимальная разовая доза – 1000 мг (2 таблетки по 500 мг), максимальная суточная доза – 3000 мг (6 таблеток по 500 мг).

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

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

Нежелательные реакции, представленные ниже, классифицированы по системно-органному классам (СОК) и распределены по частоте в соответствии со следующей классификацией: часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$); очень редко ($\leq 1/10000$), частота неизвестна – на основании имеющихся данных оценить невозможно.

Нарушения 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.

Нарушения 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).

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто - головная боль, головокружение, в отдельных случаях - снижение остроты слуха, звон в ушах.

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

Нарушения 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 - острое 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 тяжелого 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 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, 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 - ИВЛ смесью, обогащенной кислородом.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ацетилсалициловая кислота усиливает токсичность метотрексата (снижает его почечный клиренс), вальпроевой кислоты, эффекты наркотических анальгетиков, других нестероидных противовоспалительных препаратов, пероральных гипогликемических препаратов, гепарина, непрямых антикоагулянтов, тромболитиков и ингибиторов агрегации тромбоцитов, сульфаниламидов (в том числе ко-тримоксазола), трийодтиронина; снижает эффективность урикозурических препаратов (бензбромарон, сульфинпиразон), гипотензивных средств и диуретиков (спиронолактон, фуросемид). Глюкокортикостероиды, алкоголь и алкогольсодержащие препараты увеличивают повреждающее действие на слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта, повышают риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

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

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

Особые указания

Ацетилсалициловая кислота может вызывать бронхоспазм, приступ бронхиальной астмы или другие реакции повышенной чувствительности. Факторами риска являются наличие бронхиальной астмы, полипов носа, лихорадки, хронических бронхо-легочных 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 хирургических вмешательств, включая такие 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.

Детям нельзя назначать препараты, содержащие ацетилсалициловую кислоту, поскольку в случае вирусной инфекции повышается риск возникновения синдрома Рейе. Симптомами синдрома Рейе являются продолжительная рвота, острая энцефалопатия, увеличение печени.

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

Не выявлено влияния приема препарата на управление автотранспортным средством и другими механизмами, которое может повлиять на способность управлять транспортными средствами и др.

Ацетилсалициловая кислота обладает тератогенным влиянием; при применении в I триместре приводит к развитию расщепления верхнего неба; в III триместре вызывает торможение родовой деятельности (ингибирование синтеза простагландинов),



преждевременное закрытие артериального протока у плода, гиперплазию легочных сосудов и гипертензию в малом круге кровообращения. Выделяется с грудным молоком, что повышает риск возникновения кровотечений у ребенка вследствие нарушения функции тромбоцитов.

В период лечения следует воздержаться от приема этанола.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении транспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторной реакции.

Форма выпуска

Таблетки 500 мг.

По 10 таблеток в контурную безъячейковую упаковку из бумаги упаковочной.

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

По 1, 2 контурные ячейковые упаковки с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 20 контурных безъячейковых или контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 200 контурных безъячейковых или по 800 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению помещают в групповую упаковку (для стационаров).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С (для таблеток, упакованных в контурные ячейковые упаковки из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной).

В сухом месте при температуре не выше 25 °С (для таблеток, упакованных в контурные безъячейковые упаковки из бумаги упаковочной и контурные ячейковые упаковки из пленки поливинилхлоридной и бумаги упаковочной).

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Владелец регистрационного удостоверения:

Общество с ограниченной ответственностью «ПФКО-1»



АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО
ПРОИЗВОДСТВЕННАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ
КОМПАНИЯ ОБНОВЛЕНИЕ

Тел./факс: 8 (800) 200-09-95

Юридический адрес: 630096, Новосибирская область, г. Новосибирск, улица Станционная, дом 80, этаж 1, помещение 4.

Производитель/Организация, принимающая претензии от потребителей:

Производитель

Акционерное общество «Производственная фармацевтическая компания Обновление»

Адрес места производства

630096, г. Новосибирск, ул. Станционная, д. 80.

Организация, принимающая претензии от потребителей

Акционерное общество «Производственная фармацевтическая компания Обновление»

630096, г. Новосибирск, ул. Станционная, д. 80,

Тел./факс: 8 (800) 200-09-95

e-mail: pretenzii@pfc-obnovlenie.ru