

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

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

Действующее вещество: ацетилсалициловая кислота — 500,0 мг.

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный — 72,1 мг, лимонная кислота — 0,2 мг, стеариновая кислота — 6,0 мг, тальк — 12,7 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) 3,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (крахмала натрия гликолят) — 6,0 мг.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета, слегка мраморные.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат

Код АТХ: [N02BA01]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Препарат оказывает анальгезирующее, жаропонижающее и противовоспалительное действие. Механизм действия ацетилсалициловой кислоты основан на ингибировании активности ферментов циклооксигеназ ЦОГ-1 и ЦОГ-2, участвующих в синтезе простагландинов, простациклинов и тромбоксана. В результате нарушается синтез простагландинов, обеспечивающих формирование отека и гиперальгезии. Снижение содержания простагландинов (преимущественно Е 1) в центре терморегуляции приводит к снижению температуры тела вследствие

расширения сосудов кожи и усиления процессов потоотделения. Анальгезирующий эффект обусловлен как центральным (влияние на центры болевой чувствительности), так и периферическим (уменьшение альгогенной активности брадикинина) действием. Противовоспалительное действие препарата обусловлено снижением синтеза простагландинов, уменьшением проницаемости капилляров, понижением активности гиалуронидазы, ограничением энергетического обеспечения воспалительного процесса путем торможения образования аденозинтрифосфорной кислоты.

Уменьшает агрегацию, адгезию тромбоцитов и угнетает процессы тромбообразования за счет подавления синтеза тромбоксана А₂ в тромбоцитах.

Блокада ЦОГ-1 в слизистой оболочке желудка приводит к торможению синтеза гастропротекторных простагландинов, что может способствовать изъязвлению слизистой оболочки желудка и возникновению последующего кровотечения.

Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбция полная. Во время абсорбции подвергается системной элиминации в стенке кишечника и в печени (деацетируется). Резорбированная часть быстро гидролизуется специальными эстеразами, поэтому период полувыведения препарата - 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 — 2 ч. Сывороточный уровень салицилатов весьма вариабелен. 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. 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 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 небольших доз период полувыведения препарата — 2-3 ч, с увеличением дозы может возрастать до 15-30 ч.

У новорожденных детей салицилаты могут вытеснять билирубин из связи с альбумином и способствовать развитию билирубиновой энцефалопатии. Элиминация салицилатов у новорожденных осуществляется значительно медленнее, чем у взрослых.

Показания к применению

Симптоматическое лечение болевого синдрома, головной боли (в том числе при абстинентном синдроме), зубной боли, боли в горле, мигренозной боли, боли в спине и мышцах, боли в суставах, боли при менструации.

Повышенная температура тела при простудных и других инфекционно-воспалительных заболеваниях (у взрослых и детей старше 15 лет).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к ацетилсалициловой кислоте и другим нестероидным противовоспалительным средствам или другим компонентам препарата;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения), желудочно-кишечное кровотечение;
- бронхиальная астма, индуцированная приемом салицилатов и нестероидных противовоспалительных средств;
- геморрагические диатезы;
- сочетанное применение метотрексата в дозе 15 мг в неделю и более;
- беременность, период грудного вскармливания;
- сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты;
- детский возраст до 12 лет (для данной лекарственной формы)

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 печеночной недостаточности).

С осторожностью

При сопутствующей терапии антикоагулянтами, подагре, язвенной болезни желудка и/или двенадцатиперстной кишки (в анамнезе), включая хроническое или рецидивирующее течение язвенной болезни, или эпизоды желудочно-кишечных кровотечений; почечная и/или печеночная недостаточность, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; гиперурикемия, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких, сенная лихорадка, полипоз носа, лекарственная аллергия, одновременный прием метотрексата в дозе менее 15 мг/нед, беременность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение ацетилсалициловой кислоты противопоказано в I и III триместрах беременности. Применение ацетилсалициловой кислоты в I триместре беременности, в связи с ее тератогенным действием, приводит к повышению частоты дефектов развития плода (расщепление верхнего неба, сердечно-сосудистые аномалии), в III триместре - вызывает торможение родовой деятельности, преждевременное закрытие артериального протока у плода, повышенную кровоточивость у матери и плода. Назначение непосредственно перед родами может вызвать внутричерепные кровоизлияния, особенно у недоношенных детей.

Применение препарата во II триместре беременности противопоказано в связи с невозможностью осуществить режим его дозирования в данной лекарственной форме.

Период грудного вскармливания

Салицилаты и их метаболиты проникают в грудное молоко. На период лечения препаратом кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь, взрослым и детям старше 12 лет: разовая доза составляет 0,5 г, максимальная разовая доза — 1,0 г (2 таблетки по 0,5 г), максимальная суточная - 3,0 г (6 таблеток по 0,5 г).

Способ применения: препарат следует принимать после еды, запивая водой, молоком или щелочной минеральной водой.

Частота и время приема: разовую дозу при необходимости можно принимать 3-4 раза в сутки с интервалом не менее 4 часов. Регулярное соблюдение режима приема препарата позволяет избежать резкого повышения температуры и уменьшить интенсивность болевого синдрома.

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.

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: снижение аппетита, диарея; боли в животе, изжога, тошнота, рвота, явные (рвота с кровью, дегтеобразный стул) или скрытые признаки желудочно-кишечного кровотечения, которые могут приводить к железодефицитной анемии, эрозивно-язвенные поражения (в том числе с перфорацией) желудочно-кишечного тракта, единичные случаи нарушения функции печени (повышение печеночных трансаминаз).

Со стороны центральной нервной системы: головокружение, шум в ушах (обычно являются признаками передозировки).

Со стороны системы кроветворения: повышение риска кровотечения, что является следствием влияния ацетилсалициловой кислоты на агрегацию тромбоцитов, тромбоцитопения, анемия, лейкопения.

Аллергические реакции: кожная сыпь, анафилактические реакции, бронхоспазм, отек Квинке.

Со стороны мочеполовой системы: нарушение функции почек.

Другие: при приеме в качестве жаропонижающего средства синдром Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с быстрым развитием печеночной недостаточности).

Передозировка

Симптомы

Передозировка средней степени тяжести: тошнота, рвота, шум в ушах, нарушение слуха, головная боль, головокружение и спутанность сознания.

Тяжелая передозировка: лихорадка, гипервентиляция, кетоацидоз, респираторный алкалоз, метаболический ацидоз, кома, кардиогенный шок, дыхательная недостаточность, выраженная гипогликемия.

Лечение: госпитализация, желудочный лаваж, прием активированного угля, мониторинг кислотно-щелочного баланса, щелочной диурез для того, чтобы получить рН мочи между 7,5-8 (форсированное ощелачивание мочи считается достигнутым, если концентрация салицилата в плазме крови составляет более 500 мг/л (3,6 ммоль/л) у взрослых или 300 мг/л (2,2 ммоль/л) у детей), гемодиализ, возмещение потери жидкости, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместное применение:

- с метотрексатом в дозе 15 мг в неделю или более: повышается гемолитическая цитотоксичность метотрексата (снижается почечный клиренс метотрексата и метотрексат замещается салицилатами в связи с белками плазмы крови);
- с непрямymi антикоагулянтами и гепарином: повышается риск кровотечения вследствие ингибирования функции тромбоцитов, повреждения слизистой желудочно-кишечного тракта, вытеснения антикоагулянтов (пероральных) из связи с белками плазмы крови;
- с другими нестероидными противовоспалительными препаратами: в результате синергического взаимодействия, повышается риск возникновения язвы и кровотечения желудка;
- с урикозурическими лекарственными средствами, например, бензбромарон: снижает урикозурический эффект;

- с дигоксином: концентрация дигоксина повышается вследствие снижения почечной экскреции;

- усиливает эффекты пероральных гипогликемических лекарственных средств;

- с препаратами группы тромболитиков: риск возникновения кровотечения повышается;
- с системными глюкокортикостероидами, исключая гидрокортизон, используемый в качестве заместительной терапии при болезни Аддисона: при применении глюкокортикостероидов снижается уровень салицилатов в крови за счет повышения выведения последних;
- с ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента: снижается гломерулярная фильтрация за счет ингибирования простагландинов и, как следствие, снижается антигипертензивный эффект;
- с вальпроевой кислотой: повышается токсичность вальпроевой кислоты;
- с этанолом (алкогольные напитки): возрастает риск повреждающего влияния на слизистую желудочно-кишечного тракта и увеличивается риск кровотечения в желудочно-кишечном тракте;
- усиливает эффекты наркотических анальгетиков, тромболитиков и ингибиторов агрегации тромбоцитов, сульфаниламидов (в том числе ко-тримоксазола); - повышает концентрацию барбитуратов, солей лития в плазме;
- антациды, содержащие магний и/или алюминий, замедляют и ухудшают всасывание ацетилсалициловой кислоты;
- миелотоксические лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата;
- усиливает эффекты трийодтиронина;
- снижает эффект гипотензивных лекарственных средств, диуретиков (спиронолактон, фуросемид),

Глюкокортикоидные средства, этанол и этанолсодержащие лекарственные средства увеличивают повреждающее действие ацетилсалициловой кислоты на слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта, повышают риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

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 постоперационном периоде, следует отменить прием препарата за 5-7 дней и поставить в известность врача.

Детям при острых вирусных инфекциях 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.

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.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как применение препарата может в редких случаях вызвать головокружение.

Форма выпуска

Таблетки 500 мг.

По 10 таблеток в контурной безъячейковой или ячейковой упаковке;

1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению в пачку картонную. Допускается контурные ячейковые и безъячейковые упаковки помещать в групповую упаковку с равным количеством инструкций.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года. По окончании срока годности препарат не использовать.

Условия отпуска

Без рецепта.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

ОАО "Фармстандарт - Лексредства",

305022, Россия, г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18, тел./факс: (4712) 34-03-13,

www.pharmstd.ru