

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 – 500,0 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-101) – 76,0 мг,
кроскармеллоза натрия – 18,0 мг, стеариновая кислота – 6,0 мг.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской и риской, со слабым характерным запахом. Допускается незначительная мраморность.

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

Код АТХ: N02BA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Ацетилсалициловая кислота (АСК) принадлежит к группе нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) и обладает обезболивающим, жаропонижающим и противовоспалительным действием.

Механизм действия заключается в необратимом ингибировании фермента циклооксигеназы (ЦОГ) – фермента, регулирующего синтез простагландинов Е₂, Е₁₅ и тромбоксана А₂.

Фармакокинетика

Абсорбция

При приеме внутрь абсорбция полная. Во время абсорбции подвергается системной

элиминации в стенке кишечника и в печени (деацетируется). Резорбированная часть быстро гидролизуется эстеразами, поэтому период полувыведения препарата – не более 15–20 минут. 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.

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. Быстро проходит через плаценту, в небольших количествах выводится с грудным молоком.

Биотрансформация

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

Элиминация

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.

Показания к применению

Симптоматическое лечение умеренного или слабовыраженного болевого синдрома:

- головная боль (в том числе при абстинентном синдроме);
- 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

- гиперчувствительность к ацетилсалициловой кислоте и/или другим компонентам препарата;
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и др. нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) (в т.ч. 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 (гемофилия, болезнь Виллебранда, телеангиоэктазии, гипопротромбинемия, тромбоцитопения, тромбоцитопеническая пурпура);
- тяжелая 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 3,0 г в сутки;
- выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин);
- детский возраст до 15 лет.

С осторожностью

- гиперурикемия, уратный нефролитиаз, подагра;
- язвенная болезнь желудка и/или двенадцатиперстной кишки или желудочно-кишечные кровотечения (в анамнезе);
- почечная недостаточность (клиренс креатинина 30–60 мл/мин);
- печеночная недостаточность;

- бронхиальная астма;
- хроническая обструктивная болезнь легких;
- полипоз носа, сенная лихорадка, лекарственная аллергия;
- одновременный прием пероральных антикоагулянтов и ацетилсалициловой кислоты в дозе менее 3,0 г в сутки;
- одновременный прием с метотрексатом в дозе менее 15 мг/нед.;
- метроррагия (ациклические маточные кровотечения);
- гиперменорея (обильные и продолжительные менструации);
- беременность II триместр до 20 недель.

Длительный прием анальгетиков может привести к формированию головной боли привыкания, которая возникает в период отмены анальгетиков.

Привычное использование анальгетиков (особенно комбинаций различных анальгетиков) может привести к развитию тяжелого поражения почек – анальгетической нефропатии.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение больших доз салицилатов в I триместре беременности ассоциируется с повышенной частотой дефектов развития плода (расщепленное небо, пороки сердца). Не следует применять женщинам с 20-ой недели беременности в связи с возможным развитием маловодия и/или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция).

Период грудного вскармливания

Салицилаты и их метаболиты в небольших количествах проникают в грудное молоко. Во время грудного вскармливания прием препарата противопоказан.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь после еды, запивая водой, молоком или щелочной минеральной водой.

Взрослым и детям старше 15 лет: разовая доза – 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 явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную

эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Побочное действие

Ниже представлены неблагоприятные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях, разделенные по системам органов с указанием частоты их возникновения в соответствии со следующими градациями, рекомендованными Всемирной Организацией Здравоохранения: *очень часто* ($\geq 1/10$); *часто* ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); *нечасто* ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); *редко* ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$); *очень редко* ($< 1/10000$); *частота неизвестна* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

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.

Желудочно-кишечные нарушения

Часто: тошнота, рвота, боли в эпигастриальной 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 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 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-щелочным равновесием 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 (в/в) инфузией натрия гидрокарбоната (88 мЭкв в 1 л 5 % раствора декстрозы, со скоростью 10–15 мл/ч/кг); восстановление объема циркулирующей крови и индукция диуреза достигаются введением натрия гидрокарбоната в тех же дозах и разведении, которое повторяют 2–3 раза. Следует соблюдать осторожность у пожилых пациентов, 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 пациентов 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 (ИВЛ) смесью, обогащенной кислородом.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Комбинация с метотрексатом в дозе > 15 мг в неделю противопоказана.

Комбинации препаратов, которые используются с осторожностью

Метотрексат в дозе менее 15 мг/неделю

При одновременном применении препаратов повышается гематологическая токсичность метотрексата вследствие того, что НПВП в целом снижают почечный клиренс метотрексата, а салицилаты, в частности, вытесняют его из связи с белками плазмы.

Антикоагулянты (кумарин, гепарин)

При одновременном приеме ацетилсалициловой кислоты и непрямых антикоагулянтов повышается риск кровотечения за счет подавления функции тромбоцитов, повреждения слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки и вытеснения пероральных антикоагулянтов из их связи с белками плазмы.

Другие НПВП с салицилатами в высокой дозе (> 3 г/сутки)

При одновременном применении препаратов из-за эффекта синергизма повышается риск образования язв слизистой оболочки ЖКТ и кровотечений.

Урикозурические препараты (бензбромарон, пробенецид)

Снижается терапевтический эффект урикозурических препаратов за счет конкурентного тубулярного выведения мочевой кислоты.

Дигоксин

При одновременном применении препаратов повышается концентрация дигоксина в плазме крови за счет снижения его экскреции.

Противодиабетические препараты (инсулин, сульфонилмочевина)

Усиливается гипогликемический эффект за счет того, что ацетилсалициловая кислота в высокой дозе обладает гипогликемическими свойствами и вытесняет сульфонилмочевину из связи с белками плазмы.

Тромболитики/антитромбоцитарные препараты других классов (тиклопидин)

Повышается риск кровотечения.

Диуретики в сочетании с ацетилсалициловой кислотой в дозе 3 г/сутки и более

Снижается гломерулярная фильтрация, вследствие снижения синтеза простагландинов в почках.

Системные глюкокортикостероиды (ГКС) за исключением гидрокортизона (применяется для лечения болезни Аддисона)

При одновременном применении препаратов концентрация салицилатов в крови снижается, поскольку ГКС усиливает элиминацию салицилатов.

Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ)

При одновременном применении ингибиторов АПФ и ацетилсалициловой кислоты в дозе 3 г/сутки и более отмечается снижение гипотензивного эффекта ингибиторов АПФ, вследствие снижения гломерулярной фильтрации.

Вальпроевая кислота

Ацетилсалициловая кислота нарушает связь вальпроевой кислоты с белками плазмы, в результате чего повышается ее токсичность.

Антациды

Антациды, содержащие магний и/или алюминий, замедляют и ухудшают всасывание ацетилсалициловой кислоты.

Алкоголь

При сочетании с ацетилсалициловой кислотой усиливается повреждающее действие на слизистую оболочку.

Особые указания

Детям до 15 лет нельзя назначать препарат, содержащий ацетилсалициловую кислоту, поскольку в случае вирусной инфекции повышается риск возникновения синдрома Рейе (энцефалопатия и острая жировая дистрофия печени с острым развитием печеночной недостаточности). Ацетилсалициловая кислота может вызвать бронхоспазм, приступ бронхиальной астмы или другие реакции гиперчувствительности. Факторами риска являются наличие бронхиальной астмы в анамнезе, лихорадки, полипов носа, 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 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 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 выполнении потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (в т.ч. управление транспортными средствами, работа с движущимися механизмами).

Форма выпуска

Таблетки 500 мг.

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

Или по 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку) и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 или 9 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению (листок-вкладыш) помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С во вторичной упаковке (пачке).

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Держатель регистрационного удостоверения

ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Производитель

ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Либо

ООО «Озон Фарм»

Россия, Самарская обл., г.о. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

Организация, принимающая претензии потребителей

В случае производства препарата на производственной площадке ООО «Озон»:

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

В случае производства препарата на производственной площадке ООО «Озон Фарм»:

ООО «Озон Фарм»

Россия, 445043, Самарская обл., г.о. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11,
стр. 1.

Тел.: +79874599993, +79874599994

E-mail: ozonpharm@ozon-pharm.ru