

## **Состав**

*действующее вещество:* ацелизин стерильный;

1 флакон содержит ацелизина стерильного – 1 г;

## **Лекарственная форма**

Порошок для раствора для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* кристаллический порошок белого цвета без запаха или со слабым специфическим запахом.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Прочие анальгетики и антипиретики. Салициловая кислота и ее производные.

Код АТХ N02B A01.

## **Фармакодинамика**

Ацелизин является инъекционной формой ацетилсалициловой кислоты и имеет характерные для нее свойства, а также повышает ее биодоступность и анальгетический эффект. Обладает анальгезирующим, противовоспалительным, жаропонижающим и антиагрегантным действием.

Препарат ингибирует циклооксигеназу, в результате чего угнетается синтез простагландинов и образование тромбоксана A<sub>2</sub> в тромбоцитах. Уменьшается способность тромбоцитов и эритроцитов к склеиванию и прилипанию (адгезии) к эндотелию кровеносных сосудов. Снижая поверхностное натяжение мембран эритроцитов, препарат облегчает их деформирование при прохождении через капилляры и улучшает кровоток.

## **Фармакокинетика**

Препарат связывается с белками плазмы на 80-90 %. Проникает в большинство тканей организма, в том числе в синовиальную, цереброспинальную, перитонеальную жидкости. В крови гидролизует, образуя ацетилсалициловую кислоту и лизин. В печени ацетилсалициловая кислота превращается в салициловую. Период полувыведения ацетилсалициловой кислоты составляет 15-20 минут, салициловой и ее активных метаболитов – от 3-6 часов (малые дозы) до 15-30 часов (большие дозы). Экскретируется преимущественно почками в неизменной форме (60 %) и в виде метаболитов.

## **Показания**

- Болевой синдром различного генеза (головная, ушная и зубная боль, боли в послеоперационном периоде, а также при миалгии, артралгии, невралгии, невритах, коликоподобных болях, при ревматических заболеваниях);
- лихорадочные состояния;
- тромбоз поверхностных вен;
- профилактика и лечение послеоперационных тромбозов и эмболий.

## **Противопоказания**

- Гиперчувствительность к ацетилсалициловой кислоте, другим салицилатам или к любому компоненту препарата.
- Бронхиальная астма, вызванная применением салицилатов или веществ с подобным действием, особенно НПВС, в анамнезе.
- Острые желудочно-кишечные язвы.
- Геморрагический диатез.
- Почечная недостаточность тяжелой степени.
- Печеночная недостаточность тяжелой степени.
- Сердечная недостаточность тяжелой степени.
- Комбинация с метотрексатом в дозировке 15 мг/неделю или больше.
- Комбинация ацетилсалициловой кислоты в противовоспалительных/жаропонижающих/анальгезирующих дозах с пероральными антикоагулянтами у больных с гастродуоденальной язвой в анамнезе.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

### Противопоказания для одновременного применения.

- Применение ацетилсалициловой кислоты и метотрексата в дозах 15 мг/неделю и более повышает гематологическую токсичность метотрексата (снижение почечного клиренса метотрексата противовоспалительными агентами и вытеснение салицилатами метотрексата из связи с белками плазмы).
- Применение ацетилсалициловой кислоты с пероральными антикоагулянтами в противовоспалительных/жаропонижающих/анальгезирующих дозах пациентам с гастродуоденальными язвами в анамнезе: повышенный риск кровотечения.

### Не рекомендованные комбинации.

- Применение ацетилсалициловой кислоты с пероральными антикоагулянтами в противовоспалительных/жаропонижающих/анальгезирующих дозах пациентам при отсутствии гастродуоденальных язв в анамнезе: повышенный риск возникновения кровотечения.
- Применение ацетилсалициловой кислоты с пероральными антикоагулянтами в антиагрегантных дозах пациентам с гастродуоденальными язвами в анамнезе: повышенный риск кровотечений.
- Одновременное применение с низкомолекулярным гепарином, нефракционным гепарином у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) независимо от дозы гепарина и противовоспалительных/жаропонижающих/анальгезирующих доз ацетилсалициловой кислоты.
- Применение с клопидогрелем (если нет утвержденных показаний к применению данной комбинации у пациентов с острым коронарным синдромом).
- Применение с тиклопидином, с урикозурическими лекарственными средствами.
- Применение с глюкокортикоидами (кроме заместительной терапии) для противовоспалительных доз ацетилсалициловой кислоты.
- Применение с пеметрекседом у пациентов с легкой и умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина между 45 мл/мин и 80 мл/мин): повышается риск токсичности пеметрекседа.

Комбинации, которые следует применять с осторожностью.

- При применении ацетилсалициловой кислоты и метотрексата в дозах менее 15 мг/неделю повышается гематологическая токсичность метотрексата (снижение почечного клиренса метотрексата противовоспалительными агентами и вытеснение салицилатами метотрексата из связи с белками плазмы).
- Применение ацетилсалициловой кислоты с ибупрофеном препятствует необратимому ингибированию тромбоцитов ацетилсалициловой кислотой. Лечение ибупрофеном пациентов с риском сердечно-сосудистых заболеваний может ограничивать кардиопротекторное действие ацетилсалициловой кислоты.
- Применение ацетилсалициловой кислоты и антикоагулянтов, тромболитиков/других ингибиторов агрегации тромбоцитов/гемостаза повышается риск кровотечения.
- Применение высоких доз салицилатов с НПВП (благодаря взаимодополняющим эффектам) повышается риск возникновения язв

желудочно-кишечного тракта и желудочно-кишечных кровотечений.

- Применение с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (включая циталопрам, эсциталопрам, флуоксетин, флувоксамин, пароксетин, сертралин) повышается риск развития желудочно-кишечного кровотечения вследствие возможного эффекта синергизма.
- Применение с дигоксином – концентрация последнего в плазме повышается вследствие снижения почечной экскреции.
- Применение высоких доз ацетилсалициловой кислоты и противодиабетических препаратов из группы производных сульфонилмочевины усиливается гипогликемический эффект последних за счет вытеснения сульфонилмочевины, связанной с белками плазмы, ацетилсалициловой кислотой.
- Диуретические средства в сочетании с высокими дозами ацетилсалициловой кислоты снижают клубочковую фильтрацию благодаря снижению синтеза простагландинов в почках.
- Системные глюкокортикостероиды (за исключением гидрокортизона, который применяют для заместительной терапии при болезни Аддисона) снижают уровень салицилатов в крови. Применение с кортикостероидами повышается риск развития желудочно-кишечных кровотечений.
- Ингибиторы АПФ в сочетании с высокими дозами ацетилсалициловой кислоты вызывают снижение фильтрации в клубочках вследствие ингибирования вазодилаторного эффекта простагландинов, а так же снижение антигипертензивного эффекта.
- Применение с вальпроевой кислотой – ацетилсалициловая кислота вытесняет ее из связи с белками плазмы, повышая токсичность последней.
- Алкоголь способствует повреждению слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и пролонгирует время кровотечения вследствие синергизма ацетилсалициловой кислоты и алкоголя.
- Применение мочегонных лекарственных средств, ингибиторов АПФ, антагонистов рецепторов ангиотензина II с противовоспалительными/жаропонижающими/анальгезирующими дозами ацетилсалициловой кислоты: риск острой почечной недостаточности. В начале лечения необходимо убедиться, что у пациента нет обезвоживания и постоянно контролировать функции почек.
- Применение с клопидогрелем (в соответствии к утвержденным показаниям к применению данной комбинации у пациентов с острым коронарным синдромом). При необходимости сочетанного применения необходим клинический мониторинг за больным.
- При применении с пеметрекседом у пациентов с нормальной функцией почек.

- Применение с низкомолекулярным гепарином, нефракционным гепарином у пациентов до 65 лет.
- Применение с тромболитиками.
- Применение с пероральными антикоагулянтами в антиагрегантных дозах.
- Применение с другими нестероидными противовоспалительными препаратами в антиагрегантных дозах.
- Применение с глюкокортикостероидами (кроме заместительной терапии) и анальгезирующими/жаропонижающими дозами.

## **Особенности применения**

Ацетилсалициловую кислоту применяют с осторожностью в следующих ситуациях:

- гиперчувствительность к анальгетическим, противовоспалительным, противоревматическим средствам, а также при наличии аллергии на другие вещества;
- язвы желудочно-кишечного тракта, включая хроническую и рекуррентную язвенную болезнь или желудочно-кишечные кровотечения в анамнезе;
- одновременное применение антикоагулянтов;
- нарушение функции почек или нарушение сердечно-сосудистого кровообращения (например патология сосудов почки, застойная сердечная недостаточность, гиповолемия, обширные операции, сепсис или сильные кровотечения), поскольку ацетилсалициловая кислота может также увеличить риск нарушения функции почек и развития острой почечной недостаточности;
- тяжелая недостаточность глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, поскольку ацетилсалициловая кислота может вызвать гемолиз или гемолитическую анемию, особенно при наличии факторов, которые могут увеличить риск гемолиза, таких как высокие дозы препарата, лихорадка или острый инфекционный процесс;
- нарушение функции печени.

В случае применения Ацелизина перед началом приема ибупрофена как обезболивающего средства пациент должен проконсультироваться с врачом.

Ацетилсалициловая кислота может обуславливать развитие бронхоспазма или приступа бронхиальной астмы, или другие реакции повышенной чувствительности. Факторы риска включают астму в анамнезе, сенную лихорадку, полипы носа или хронические респираторные заболевания, аллергические реакции (например кожные реакции, зуд, крапивницу) на другие вещества.

Из-за способности ацетилсалициловой кислоты подавлять агрегацию тромбоцитов, которая сохраняется на протяжении нескольких дней после приема, применение препаратов, содержащих ацетилсалициловую кислоту, может повысить вероятность/усиление кровотечения при хирургических операциях (включая незначительные хирургические вмешательства, например удаление зуба).

При применении малых доз ацетилсалициловой кислоты может снижаться выведение мочевой кислоты. Это может привести к приступу подагры у предрасположенных пациентов.

Регулярное использование анальгетиков может привести к стойким поражениям почек (с риском почечной недостаточности).

С осторожностью применять пациентам с гастритом в анамнезе, с метроррагией и/или меноррагией.

Во время лечения препаратом могут возникнуть желудочно-кишечные кровотечения, язвы/перфорации в любое время, без наличия каких-либо состояний в анамнезе пациента. Относительный риск увеличивается у пожилых лиц, у пациентов с низкой массой тела, у пациентов, получающих антикоагулянты или ингибиторы агрегации тромбоцитов. В случае возникновения желудочно-кишечных кровотечений лечение должно быть немедленно прекращено.

При применении высоких противовоспалительных доз в ревматологии, необходимо контролировать возможные признаки передозировки. В случае возникновения нарушения слуха, шума в ушах или головокружения, нужно пересмотреть лечение.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Не отмечалось влияния на способность управлять автомобилем и работать с механизмами.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Угнетение синтеза простагландинов может негативно повлиять на беременность и/или эмбриональное/внутриутробное развитие. Есть данные о возможности риска выкидыша и пороков развития плода после применения ингибиторов синтеза простагландинов в начале беременности. Риск повышается в зависимости от увеличения дозы и продолжительности терапии. Согласно

имеющимся данным, связь между приемом ацетилсалициловой кислоты и повышенным риском выкидыша не подтверждена.

Данные о возникновении пороков развития не являются последовательными, однако повышенный риск гастрошизиса нельзя исключить при применении ацетилсалициловой кислоты.

В I и II триместре беременности препараты, содержащие ацетилсалициловую кислоту, не следует назначать без четкой клинической необходимости. Для женщин, у которых вероятно беременность или в первом и втором триместре беременности, доза препаратов, содержащих ацетилсалициловую кислоту, должна быть как можно ниже, а продолжительность лечения короче.

Во время III триместра беременности все ингибиторы синтеза простагландинов могут влиять на плод следующим образом:

- сердечно-легочная токсичность (с преждевременным закрытием артериального протока и легочной гипертензией);
- нарушение функции почек с возможным последующим развитием почечной недостаточности с олигогидроамниозом.

На женщину и плод в конце беременности – следующим образом:

- возможно увеличение времени кровотечения, антиагрегантный эффект, который может возникнуть даже после применения очень низких доз;
- торможение сокращений матки, что может привести к задержке или увеличению продолжительности родов.

Учитывая это, ацетилсалициловая кислота противопоказана в III триместре беременности.

Ацетилсалициловая кислота проникает в грудное молоко, поэтому ее применение во время лактации не рекомендуется.

### **Способ применения и дозы**

Применять по назначению и под контролем врача.

Ацелизин вводить внутримышечно (глубоко) и внутривенно. Для внутримышечного введения содержимое флакона растворять непосредственно перед применением: 1 г (1 флакон) – в 5 мл воды для инъекций, взбалтывая до полного растворения порошка.

Для профилактики тромбоза препарат вводить внутримышечно (глубоко) по 0,5-3 мл раствора 1 раз в сутки или через сутки. Курс лечения – до 5 инъекций, после

чего, при необходимости, можно переходить на прием пероральных форм кислоты ацетилсалициловой. Разовую дозу и частоту повторных инъекций препарата необходимо определять учитывая динамику результатов лабораторного обследования показателей гемостаза после первого введения Ацелизина.

При внутривенном введении Ацелизина для профилактики тромбоза преимущество отдается медленному вливанию препарата. Перед применением 1 г (1 флакон) растворяют в 5 мл воды для инъекций, взбалтывая до полного растворения порошка. Затем приготовленный раствор разводят в 150-200 мл 5 % раствора глюкозы или 0,9 % раствора натрия хлорида и вводят со скоростью 1 мл/минуту.

Для пациентов при болевом синдроме умеренной силы, лихорадочных состояниях, ревматических заболеваниях, невритах рекомендуется однократное введение 1 г Ацелизина. При сильных болях, коликоподобных болях разовая доза может быть увеличена до 2 г. При повторном применении Ацелизина не следует превышать его суточную дозу, которая составляет 10 г.

Курс лечения составляет 3-10 дней.

## **Дети**

Инъекционная форма ацетилсалициловой кислоты не применяется у детей.

## **Передозировка**

Передозировка салицилатов возможна вследствие хронической интоксикации, возникшей вследствие длительной терапии (применение более 100 мг/кг/сутки более 2 дней может вызвать токсические эффекты), а также из-за острой интоксикации, которая несет угрозу жизни (передозировка), причинами которой могут быть, например, случайное применение детьми или непредвиденная передозировка.

Хроническое отравление салицилатами может иметь скрытый характер, поскольку его признаки неспецифичны. Умеренная хроническая интоксикация, вызванная салицилатами, или салицилизм встречается, как правило, только после повторных приемов больших доз.

*Симптомы.* Нарушение равновесия, головокружение, звон в ушах, глухота, усиленное потоотделение, тошнота и рвота, головная боль, спутанность сознания. Указанные симптомы дозозависимы. Звон в ушах может отмечаться при концентрации салицилатов в плазме крови более 150-300 мкг/мл. Серьезные

побочные реакции встречаются при концентрации салицилатов в плазме крови более 300 мкг/мл. При тяжелом отравлении: повышение температуры, кетоз, респираторный алкалоз, метаболический ацидоз, кома, кардиоваскулярный коллапс, дыхательная недостаточность, тяжелая гипогликемия, тяжелая гипокалиемия.

Об острой интоксикации свидетельствует выраженное изменение кислотно-щелочного баланса, который может отличаться в зависимости от возраста и тяжести интоксикации. Тяжесть состояния не может быть определена только на основании концентрации салицилатов в плазме крови.

*Лечение.* Лечение интоксикации, вызванной передозировкой ацетилсалициловой кислоты, определяется степенью тяжести, клиническими симптомами и обеспечивается стандартными методами, которые применяют при отравлении. Все применяемые меры должны быть направлены на ускорение удаления препарата и восстановление электролитного и кислотно-щелочного баланса. Применяют активированный уголь, форсированный щелочной диурез. В зависимости от состояния кислотно-щелочного равновесия и электролитного баланса проводят инфузионное введение растворов электролитов. При серьезных отравлениях показан гемодиализ.

## **Побочные реакции**

При применении препарата Ацелизин возможны:

*со стороны желудочно-кишечного тракта:* эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в результате которых возможны кровотечения, перфорация; диспепсия, изжога, боли в животе, тошнота, рвота, диарея, эзофагит, транзиторная печеночная недостаточность;

*со стороны крови и кроветворения:* очень редко могут наблюдаться тромбоцитопения, постгеморрагическая железодефицитная анемия;

*со стороны иммунной системы:* аллергические реакции, включая кожную сыпь, зуд, крапивницу, бронхоспазм, обострение бронхиальной астмы, ангионевротический отек; анафилаксия, включая анафилактический шок;

*со стороны дыхательной системы:* заложенность носа, ринит, отек легких;

*со стороны органов слуха:* обратимые нарушения – шум в ушах, потеря слуха;

*со стороны центральной и периферической нервной системы:* головная боль, головокружение;

*другие:* редко – острая почечная недостаточность, обратимые нарушения функции почек и печени, возможно – возникновение гепатотоксичности, синдрома Рейно; реакции в месте введения, включая боль.

Вследствие антиагрегатного действия на тромбоциты ацетилсалициловая кислота может ассоциироваться с риском развития кровотечений, увеличение времени кровотечения. Наблюдались такие кровотечения, как периперационные геморрагии, гематомы, кровотечения из органов мочеполовой системы, носовые кровотечения, кровотечения из десен, пурпура; серьезные кровотечения, такие как церебральные геморрагии (особенно у пациентов с неконтролируемой гипертензией и/или при одновременном применении антигемостатических средств), которые в редких случаях могут потенциально угрожать жизни.

Геморрагии могут привести к острой и хронической постгеморрагической анемии/ железодефицитной анемии (вследствие так называемого скрытого микрокровотечения) с соответствующими лабораторными проявлениями и клиническими симптомами, такими как астения, бледность кожных покровов, гипоперфузия.

У пациентов с тяжелыми формами недостаточности глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы наблюдались гемолиз или гемолитическая анемия.

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

В оригинальной упаковке при температуре от 2 °С до 8 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 1 г во флаконе.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

ПАО «Киевмедпрепарат».

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).