Состав

действующее вещество: кислота ацетилсалициловая;

1 таблетка содержит кислоты ацетилсалициловой (в пересчете на 100 % вещество) 500 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармелоза, кремния диоксид коллоидный безводный (аэросил), магния стеарат, ароматизатор лимон, кислота лимонная безводная.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета, круглой формы, с плоской поверхностью, с чертой и фаской, со слабым лимонным запахом. На поверхности таблеток допускается мраморность.

Фармакотерапевтическая группа

Аналгетики и антипиретики. Кислота ацетилсалициловая. Код АТХ N02B A01.

Фармакодинамика

Ацетилсалициловая кислота принадлежит к группе нестероидных противовоспалительных лекарственных средств (НПВС) с анальгетическими, жаропонижающими и противовоспалительными свойствами. Механизм ее действия заключается в необратимой инактивации ферментов циклооксигеназы, которые играют важную роль при синтезе простагландинов.

Ацетилсалициловую кислоту применяют перорально в дозах от 0,3 до 1 г для облегчения боли и состояний, сопровождающихся лихорадкой, таких как простуда, для снижения температуры и ослабления боли в суставах и мышцах.

Ацетилсалициловая кислота подавляет агрегацию тромбоцитов, блокируя синтез тромбоксана А2.

Фармакокинетика

После приема внутрь ацетилсалициловая кислота быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Во время и после абсорбции она превращается в основной активный метаболит – салициловую кислоту.

Максимальная концентрация ацетилсалициловой кислоты в плазме крови достигается через 10–20 минут, салицилатов – через 20–120 минут.

Ацетилсалициловая и салициловая кислоты полностью связываются с белками плазмы крови и быстро распределяются в организме.

Салициловая кислота проникает через плаценту и экскретируется в грудное молоко.

Салициловая кислота метаболизируется в печени. Метаболитами салициловой кислоты являются салицилмочевая кислота, салицилфенол глюкуронид, салицилацил глюкуронид, гентизиновая и гентизинмочевая кислоты.

Кинетика выведения салициловой кислоты зависит от дозы, поскольку метаболизм ограничен активностью печеночных ферментов. Период полувыведения зависит от дозы и увеличивается от 2–3 часов при применении низких доз до 15 часов при применении высоких доз. Салициловая кислота и ее метаболиты выводятся из организма преимущественно почками.

Показания

- Лечение легкого и умеренно выраженного, острого болевого синдрома (головная, зубная боль, боль в суставах и мышцах, боль в спине).
- Симптоматическое лечение лихорадки и/или болевого синдрома при простудных заболеваниях.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к ацетилсалициловой кислоте, другим салицилатам или к любому компоненту препарата.
- Бронхиальная астма, вызванная применением салицилатов или других НПВС в анамнезе.
- Острые желудочно-кишечные язвы.
- Геморрагический диатез.
- Выраженная почечная недостаточность.
- Выраженная печеночная недостаточность.
- Выраженная сердечная недостаточность.
- Комбинация с метотрексатом в дозировке 15 мг/неделю или более (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Противопоказанные комбинации

Применение ацетилсалициловой кислоты с метотрексатом в дозах 15 мг/неделю и более повышает гематологическую токсичность метотрексата (снижение почечного клиренса метотрексата противовоспалительными агентами и вытеснение салицилатами метотрексата из связи с протеинами плазмы крови).

Комбинации, которые следует применять с осторожностью

При применении ацетилсалициловой кислоты с метотрексатом 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 крови).

Одновременное применение *ибупрофена* препятствует необратимому ингибированию тромбоцитов ацетилсалициловой кислотой. Лечение ибупрофеном пациентов с риском сердечно-сосудистых заболеваний может ограничивать кардиопротекторное действие ацетилсалициловой кислоты.

При одновременном применении высоких доз салицилатов с *НПВП* (благодаря взаимоусиливающему эффекту) повышается риск возникновения язв и желудочно-кишечных кровотечений.

При одновременном применении ацетилсалициловой кислоты и *антикоагулянтов* повышается риск развития кровотечения.

Одновременное применение с *урикозуричными средствами,* такими как бензобромарон, пробенецид, снижает эффект выведения мочевой кислоты (из-за конкуренции выведения мочевой кислоты почечными канальцами).

При одновременном применении с *дигоксином* концентрация последнего в плазме крови повышается вследствие снижения почечной экскреции.

При одновременном применении высоких доз ацетилсалициловой кислоты и *пероральных антидиабетических препаратов* из группы производных сульфонилмочевины или инсулина усиливается гипогликемический эффект последних за счет гипогликемического эффекта ацетилсалициловой кислоты и вытеснения сульфонилмочевины, связанной с протеинами плазмы крови.

Диуретические средства в комбинации с высокими дозами ацетилсалициловой кислоты снижают клубочковую фильтрацию из-за снижения синтеза простагландинов в почках.

Системные глюкокортикостероиды (за исключением гидрокортизона, который применяют для заместительной терапии при болезни Аддисона). При

применении ацетилсалициловой кислоты одновременно с *кортикостероидами* снижается уровень салицилатов в крови и повышается риск передозировки после окончания лечения, а также повышается риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Ингибиторы АПФ в комбинации с высокими дозами ацетилсалициловой кислоты вызывают снижение клубочковой фильтрации в результате ингибирования вазодилататорных простагландинов и снижения гипотензивного эффекта.

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина. Повышается риск кровотечения из верхних отделов желудочно-кишечного тракта из-за возможности синергического эффекта.

При одновременном применении с *вальпроевой кислотой* ацетилсалициловая кислота вытесняет ее из связи с протеинами плазмы крови, повышая токсичность последней.

Этиловый спирт способствует повреждению слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и пролонгирует время кровотечения вследствие синергизма ацетилсалициловой кислоты и алкоголя.

Особые меры безопасности

Ацетилсалициловую кислоту применяют с осторожностью при:

- гиперчувствительности к анальгетическим, противовоспалительным, противоревматическим средствам, а также при наличии аллергии на другие вещества;
- желудочно-кишечных язвах в анамнезе, в том числе при хронической или рецидивирующей язвенной болезни или желудочно-кишечных кровотечениях в анамнезе;
- одновременном применении антикоагулянтов;
- нарушениях функций почек или нарушениях кровообращения (таких как заболевания сосудов почек, застойная сердечная недостаточность, дегидратация, массивные хирургические вмешательства, сепсис или значительные кровопотери), поскольку ацетилсалициловая кислота может дополнительно повышать риск повреждения почек и вызывать острую почечную недостаточность;
- нарушениях функции печени.

У пациентов с аллергическими осложнениями, в том числе с бронхиальной астмой, аллергическим ринитом, крапивницей, кожным зудом, отеком слизистой оболочки и полипозом носа, а также при их сочетании с хроническими

инфекциями дыхательных путей и у пациентов с гиперчувствительностью к НПВП на фоне лечения препаратами ацетилсалициловой кислоты возможно развитие бронхоспазма, приступа бронхиальной астмы или других реакций гиперчувствительности.

При хирургических операциях (в том числе стоматологических) применение препаратов, содержащих ацетилсалициловую кислоту, может повысить вероятность появления/усиления кровотечения, что обусловлено угнетением агрегации тромбоцитов на протяжении некоторого времени после применения ацетилсалициловой кислоты.

При применении малых доз ацетилсалициловой кислоты может снижаться выведение мочевой кислоты. Это может привести к возникновению подагры у пациентов со сниженным выведением мочевой кислоты.

У больных с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы ацетилсалициловая кислота может вызвать гемолиз или гемолитическую анемию. Факторами, повышающими риск гемолиза, является, например, применение высоких доз препарата, лихорадка или острые инфекции.

Длительное применение анальгетиков может привести к появлению головной боли.

Частый прием обезболивающих средств может вызвать временное нарушение работы почек с риском развития почечной недостаточности (анальгетическая нефропатия). Риск является особенно высоким, когда одновременно применяются несколько различных анальгетиков.

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

Не отмечалось влияния на способность управлять автомобилем и другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Ацетилсалициловую кислоту можно применять в период беременности только в том случае, когда другие лекарственные средства не являются эффективными и только после оценки соотношения риск/польза.

Угнетение синтеза простагландинов может негативно повлиять на беременность и/или эмбриональное/внутриутробное развитие. Имеющиеся данные

эпидемиологических исследований указывают на риск выкидыша и пороков развития плода после применения ингибиторов синтеза простагландинов в начале беременности. Риск повышается в зависимости от увеличения дозы и продолжительности терапии. Согласно данных исследований связи между приемом ацетилсалициловой кислоты и повышенным риском выкидыша не подтверждено.

Присутствующий повышенный риск гастрошизиса не может быть исключен при применении ацетилсалициловой кислоты. На ранних сроках беременности (1–4-й месяц) не была установлена связь с повышенным риском развития мальформаций.

Во время I и II триместра беременности препараты, содержащие ацетилсалициловую кислоту, не следует назначать без четкой клинической необходимости. У женщин, которые предположительно могут быть беременными, или во время I и II триместра беременности доза препаратов, содержащих ацетилсалициловую кислоту, должна быть как можно ниже, а продолжительность лечения – как можно 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 олигогидрамнионом.

На женщину и плод в конце беременности ингибиторы синтеза простагландинов могут влиять таким образом:

- возможность продления времени кровотечения, антиагрегантный эффект, который может возникнуть даже после очень низких доз;
- торможение сокращений матки, что может привести к задержке или удлинению продолжительности родов.

Учитывая это, ацетилсалициловая кислота противопоказана во время III триместра беременности.

Фертильность

Существуют определенные показания, что препараты, подавляющие синтез простагландинов, могут нарушать репродуктивную функцию у женщин из-за влияния на овуляцию. Это явление имеет обратимый характер и исчезает после отмены лечения.

Период кормление грудью

Салицилаты и их метаболиты проникают в грудное молоко в небольшом количестве.

Поскольку побочные реакции у младенцев, матери которых принимали ацетилсалициловую кислоту, не наблюдались, прерывать кормление грудью, как правило, не нужно. При длительном применении препарата или применении ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах следует решить вопрос относительно прекращения кормления грудью.

Способ применения и дозы

Ацетилсалициловую кислоту принимают внутрь после еды, запивая достаточным количеством жидкости.

Ацетилсалициловую кислоту нельзя применять дольше 3–5 суток без консультации врача.

Взрослые и дети от 15 лет.

1–2 таблетки как однократная доза. Повторный прием возможен через 4–8 часов. Максимальная суточная доза не должна превышать 4 г (8 таблеток).

Уведомления.

Для больных с сопутствующими нарушениями функции печени или почек необходимо снизить дозу препарата или увеличить интервал между применениями.

Дети

Препарат применяют детям от 15 лет.

Не следует применять препараты, содержащие ацетилсалициловую кислоту, детям с острыми респираторными вирусными инфекциями (ОРВИ), которые сопровождаются или не сопровождаются повышением температуры тела, без консультации врача. При некоторых вирусных заболеваниях, особенно при ґриппе типа А, ґриппе типа В и ветряной оспе, существует риск развития синдрома Рея, который является очень редким, но опасным для жизни заболеванием и требует неотложного медицинского вмешательства. Риск может быть повышенным, если ацетилсалициловая кислота применяется как сопутствующее лекарственное средство, однако причинно-следственная связь в данном случае не доказана. Если указанные состояния сопровождаются

длительной рвотой, это может быть признаком синдрома Рея.

Передозировка

Салицилатная токсичность (применение более 100 мг/кг/сутки более 2 суток может вызвать токсичность) возможна через хроническую интоксикацию, которая возникла в результате длительной терапии, а также через острую интоксикацию (передозировку), которая потенциально угрожает жизни и причинами которой могут быть, например, случайное применение детьми или передозировка.

Хроническая интоксикация салицилатами может иметь скрытый характер, поскольку ее признаки неспецифичны. Умеренная хроническая интоксикация, вызванная салицилатами, или салицилизм, обычно наступает только после повторного применения больших доз.

Симптомы. Головокружение, звон в ушах, глухота, повышенная потливость, тошнота и рвота, головная боль, спутанность сознания. Указанные симптомы можно контролировать путем снижения дозы. Звон в ушах возможен при концентрации салицилатов в плазме крови более 150–300 мкг/мл. Более серьезные побочные реакции наблюдаются при концентрации салицилатов в плазме крови более 300 мкг/мл.

Об *острой интоксикации* свидетельствует выраженное изменение кислотно-щелочного баланса, который зависит от возраста пациента и тяжести интоксикации. У детей наиболее характерным проявлением является метаболический ацидоз. Тяжесть состояния нельзя оценить только на основании концентрации салицилатов в плазме крови. Абсорбция ацетилсалициловой кислоты может замедляться в связи с задержкой желудочного высвобождения, формированием конкрементов в желудке.

В силу сложных патофизиологических эффектов признаками и симптомами отравления салицилатами могут быть:

Интоксикация от слабой до умеренной – тахипноэ, гиперпноэ, дыхательный алкалоз; повышенная потливость, тошнота и рвота.

Интоксикация от умеренной до тяжелой – респираторный алкалоз, сопровождающийся компенсаторным метаболическим ацидозом, гиперпирексией. Со стороны дыхательной системы: от гиперпноэ, некардиогенного отека легких до остановки дыхания и асфиксии. Со стороны сердечно-сосудистой системы: от аритмии, артериальной гипотензии до остановки сердца. Также наблюдается дегидратация, олигоурия вплоть до

почечной недостаточности; нарушение метаболизма глюкозы, кетоз; желудочно-кишечные кровотечения; гематологические изменения – от угнетения тромбоцитов к коагулопатии. Со стороны нервной системы: токсическая энцефалопатия и угнетение ЦНС, что проявляется в виде сонливости, угнетения сознания до развития комы и судорог.

Изменения со стороны лабораторных и других показателей: алкалемия, алкалурия, ацидемия, ацидурия, изменения артериального давления, изменения на ЭКГ, гипокалиемия, гипернатриемия, гипонатриемия, изменения почечной функции, гипергликемия, гипогликемия (особенно у детей). Повышенный уровень кетоновых тел, гипопротромбинемия.

Лечение.

Лечение интоксикации, вызванной передозировкой ацетилсалициловой кислоты, определяется степенью тяжести, клиническими симптомами и обеспечивается стандартными методами, которые применяют при отравлении (промывание желудка, применение активированного угля, форсированный диурез). Все принятые меры должны быть направлены на ускорение удаления препарата и восстановление электролитного и кислотно-щелочного баланса. В зависимости от состояния кислотно-щелочного равновесия и электролитного баланса проводят инфузионное введение растворов электролитов. При серьезных отравлениях показан гемодиализ.

Побочные реакции

Со стороны желудочно-кишечного тракта. Диспепсия, боль в эпигастральной области и абдоминальная боль, изжога; в отдельных случаях – воспаление желудочно-кишечного тракта, эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта, которые могут в редких случаях вызвать желудочно-кишечные кровотечения и перфорации с соответствующими лабораторными и клиническими проявлениями.

Редко – транзиторная печеночная недостаточность с повышением уровня печеночных трансаминаз.

Со стороны крови и лимфатической системы. Вследствие антиагрегантного действия на тромбоциты ацетилсалициловая кислота может повышать риск развития кровотечений. Наблюдались такие кровотечения как периоперационные кровотечения, гематомы, урогенитальные кровотечения, носовые кровотечения, кровотечения из десен; редко или очень редко – серьезные кровотечения, такие как желудочно-кишечные кровотечения и церебральные геморрагии (особенно у пациентов с неконтролируемой

артериальной гипертензией и/или при одновременном применении антигемостатических средств), которые в единичных случаях могут угрожать жизни.

Кровотечения 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 кожного покрова, гипоперфузия.

У больных с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы тяжелой степени сообщалось о гемолизе и развитии гемолитической анемии.

Со стороны иммунной системы. У пациентов с индивидуальной повышенной чувствительностью к салицилатам возможно развитие аллергических реакций, включая такие симптомы как сыпь, крапивница, зуд, экзема, ринит, заложенность носа, снижение артериального давления. Очень редко наблюдали тяжелые реакции гиперчувствительности, включая анафилактический шок, ангионевротический отек, некардиогенный отек легких. У больных бронхиальной астмой возможно увеличение частоты возникновения бронхоспазма; аллергических реакций от незначительной до умеренной степени, которые потенциально поражают кожу, дыхательную систему, желудочно-кишечный тракт и сердечно-сосудистую систему.

Со стороны нервной системы. Головная боль, головокружение, нарушение слуха; звон в ушах и спутанность сознания могут быть признаками передозировки.

Со стороны мочевыделительной системы. Присутствуют данные о нарушении функции почек и развитии острой почечной недостаточности.

Срок годности

4 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере; по 10 таблеток в стрипе.

По 10 таблеток в блистере, по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

1. ПАО «Киевмедпрепарат».
2. ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

1. Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.
2. Украина, 79024, г. Львов, ул. Опришковская, 6/8.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.