Інструкція

для медичного застосування лікарського засобу

АЦЕТИЛСАЛІЦИЛОВА КИСЛОТА
(ACETYLSALICYLIC ACID)

Склад:
діюча речовина: ацетилсаліцилова кислота;
1 таблетка містить кислоти ацетилсаліцилової 500 мг;
допоміжні речовини: целюлоза порошкоподібна, крохмаль кукурудзяний.

Лікарська форма. Таблетки.
Основні фізико-хімічні властивості: одношарові таблетки круглої форми, з опуклими верхньою і нижньою поверхнями, білого або майже білого кольору. На розломі під лупою видно відносно однорідну структуру.

Фармакотерапевтична група. Аналгетики і антипіретики. Ацетилсаліцилова кислота.
Код АТХ N02B A01.

Фармакологічні властивості.
Фармакодинаміка.
Ацетилсаліцилова кислота належить до групи нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ) з аналгетичними, жарознижувальними та протизапальними властивостями. Механізм її дії полягає у незворотній інактивації ферментів циклооксигенази, що відіграють важливу роль при синтезі простагландинів.
При пероральному прийомі у дозах від 0,3 г до 1 г препарат застосовують для полегшення болю і станів, які супроводжуються гарячкою легкого ступеня, таких як застуда та грип, для зниження температури і послаблення болю у суглобах та м'язах.
Ацетилсаліцилову кислоту також застосовують при гострих та хронічних запальних захворюваннях, таких як ревматоїдний артрит, остеоартрити та анкілозуючий спондиліт.
Ацетилсаліцилова кислота пригнічує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування синтезу тромбоксану A_2 та застосовується при багатьох судинних захворюваннях у дозах 75-300 мг на добу.
Фармакокінетика.
Після прийому внутрішньо кислота ацетилсаліцилова швидко та повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Під час та після абсорбції вона перетворюється на основний активний метаболіт – кислоту саліцилову. Максимальна концентрація кислоти ацетилсаліцилової у плазмі крові досягається через 10-20 хвилин, саліцилатів – через
20 - 120 хвилин відповідно.
Ацетилсаліцилова та саліцилова кислоти повністю зв'язуються з білками плазми крові і швидко розподіляються в організмі. Саліцилова кислота проникає крізь плаценту і проникає у грудне молоко. Саліцилова кислота зазнає метаболізму в печінці. Метаболітами саліцилової кислоти є саліцилсечова кислота, саліцилфенол глюкуронід, саліцилацил глюкуронід, гентизинова кислота та гентизинсечова кислота.
Кінетика виведення саліцилової кислоти залежить від дози, оскільки метаболізм обмежений активністю ферментів печінки. Період напіввиведення залежить від дози і зростає від
2-3 годин при застосуванні низьких доз до 15 годин – при застосуванні високих доз. Саліцилова кислота та її метаболіти виводяться із організму переважно нирками.

Клінічні характеристики.
Показання.
Для симптоматичного лікування головного болю, зубного болю; болю у горлі, зумовленого застудою; альгодисменореї; болю у м'язах та суглобах; болю у спині; помірного болю, зумовленого артритом.
При застуді або гострих респіраторних захворюваннях для симптоматичного полегшення болю та гарячки.

Протипоказання.
Гіперчутливість до ацетилсаліцилової кислоти, інших саліцилатів або до будь-якого компонента препарату.
Бронхіальна астма, спричинена застосуванням саліцилатів або інших НПЗЗ в анамнезі.
Гострі шлунково-кишкові виразки.
Геморагічний діатез.
Виражена ниркова недостатність.
Виражена печінкова недостатність.
Виражена серцева недостатність.
Комбінація з метотрексатом у дозуванні 15 мг/тиждень або більше (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).
III триместр вагітності.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.
Протипоказання для взаємодії
Застосування метотрексату у дозах 15 мг/тиждень і більше підвищує гематологічну токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми крові).
Комбінації, які потрібно застосовувати з обережністю.
При застосуванні метотрексату у дозах менше 15 мг/тиждень підвищується гематологічна токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми крові).
Одночасне застосування ібупрофену перешкоджає незворотному інгібуванню тромбоцитів ацетилсаліциловою кислотою. Лікування ібупрофеном пацієнтів, які мають ризик серцево- судинних захворювань, може обмежувати кардіопротекторну дію ацетилсаліцилової кислоти.
При одночасному застосуванні препарату та антикоагулянтів підвищується ризик розвитку кровотечі.
При одночасному застосуванні високих доз саліцилатів із НПЗЗ (завдяки взаємопосилюючому ефекту) підвищується ризик виникнення виразок і шлунково-кишкових кровотеч.
Одночасне застосування з урикозуричними засобами, такими як бензобромарон, пробенецид, знижує ефект виведення сечової кислоти (завдяки конкуренції виведення сечової кислоти нирковими канальцями).
При одночасному застосуванні з дигоксином концентрація останнього у плазмі крові підвищується внаслідок зниження ниркової екскреції.
При одночасному застосуванні високих доз кислоти ацетилсаліцилової та пероральних антидіабетичних препаратів із групи похідних сульфонілсечовини або інсуліну посилюється гіпоглікемічний ефект останніх за рахунок гіпоглікемічного ефекту ацетилсаліцилової кислоти і витіснення сульфонілсечовини, зв'язаної з протеїнами плазми крові.
Діуретичні засоби у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти знижують фільтрацію клубочків завдяки зниженню синтезу простагландинів у нирках.
Системні глюкокортикостероїди (виключаючи гідрокортизон), які застосовуються для замісної терапії при хворобі Аддісона, у період лікування кортикостероїдами знижують рівень саліцилатів у крові та підвищують ризик передозування після закінчення лікування.
При застосуванні з кортикостероїдами підвищується ризик розвитку шлунково-кишкових кровотеч.
Інгібітори АПФ у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти спричиняють зниження фільтрації у клубочках внаслідок інгібування вазодилататорних простагландинів та зниження гіпотензивного ефекту.
Селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну: підвищується ризик кровотечі з верхніх відділів шлунково-кишкового тракту через можливість синергічного ефекту.
При одночасному застосуванні з вальпроєвою кислотою ацетилсаліцилова кислота витісняє її зі зв'язку з протеїнами плазми крові, підвищуючи токсичність останньої.
Етиловий спирт сприяє пошкодженню слизової оболонки шлунково-кишкового тракту і пролонгує час кровотечі внаслідок синергізму ацетилсаліцилової кислоти та алкоголю.

Особливості застосування.
Препарат застосовувати з обережністю при:
- гіперчутливостідо аналгетичних, протизапальних, протиревматичних засобів, а також при наявності алергії на інші речовини;
- шлунково-кишкових виразках в анамнезі, у тому числі при хронічній чирецидивуючій виразковій хворобі або шлунково-кишкових кровотечах в анамнезі;
- одночасному застосуванні антикоагулянтів;
- порушеннях функції нирок або порушеннях кровообігу (наприклад, захворювання судин нирок, застійна серцева недостатність, зменшення об'єму циркулюючої крові, масивні хірургічні втручання, сепсис або значні крововтрати), оскільки ацетилсаліцилова кислота може додатково підвищувати ризик пошкодження нирок та спричиняти гостру ниркову недостатність;
- порушеннях функції печінки.
У пацієнтів з алергічними ускладненнями, у тому числі з бронхіальною астмою, алергічним ринітом, кропив'янкою, шкірним свербежем, набряком слизової оболонки таполіпозом носа, а також при їх поєднанні з хронічними інфекціями дихальних шляхів та у хворих ізгіперчутливістюдо НПЗЗ на тлі лікування препаратом можливий розвиток бронхоспазму або нападу бронхіальної астми.
При хірургічних втручаннях (у тому числі стоматологічних) застосування препаратів, які містять ацетилсаліцилову кислоту, може підвищити ймовірність появи/посилення кровотечі, що зумовлено пригніченням агрегації тромбоцитів протягом деякого часу після застосування ацетилсаліцилової кислоти.
При застосуванні малих доз ацетилсаліцилової кислоти може знижуватися виведення сечової кислоти. Це може призвести до виникнення нападу подагри у пацієнтів, які мають знижене виведення сечової кислоти.
У хворих з дефіцитом глюкозо-6-фосфатдегідрогенази ацетилсаліцилова кислота може спричиняти гемоліз або гемолітичну анемію. Факторами, що підвищують ризик гемолізу, є, наприклад, застосування високих доз, пропасниця або гострі інфекції.

Застосування у період вагітності або годування груддю.
Препарат можна застосовувати у період вагітності тільки у тому випадку, коли інші лікарські засоби не є ефективними. Саліцилати можна застосовувати у період вагітності тільки після оцінки співвідношення ризик/користь.
Протягом I та II триместру вагітності препарати, що містять ацетилсаліцилову кислоту, призначати не слід, крім випадків надзвичайної потреби. Якщо препарати, що містять ацетилсаліцилову кислоту, застосовують жінки, які планують вагітність, а також протягом
I та II триместру вагітності, їх дози мають бути настільки низькими, а курс лікування настільки короткочасним, наскільки це можливо.
Застосування саліцилатів у I триместрі вагітності у деяких ретроспективних епідеміологічних дослідженнях асоціювалося з підвищеним ризиком розвитку вроджених вад (палатосхиз («вовча паща»), вади серця, гастрошизис). Проте при довготривалому застосуванні препарату у терапевтичних дозах, що перевищували 150 мг/добу, цей ризик виявився низьким: у результаті дослідження, проведеного на 32000 парах мати-дитина, не виявлено зв'язку між застосуванням препарату та збільшенням ризику вроджених вад.
Згідно з попередніми оцінками, при довготривалому застосуванні препарату не рекомендується приймати ацетилсаліцилову кислоту в дозі, що перевищує 150 мг/добу.
У III триместрі вагітності прийом саліцилатів у високих дозах (понад 300 мг/добу) може призвести до переношування вагітності та послаблення переймів під час пологів, а також докардіопульмональної токсичності (передчасного закриття артеріальної протоки та розвитку легеневої гіпертензії) або порушення ниркової функції у плода, що може прогресувати до
ниркової недостатності зі зменшенням кількостіамніотичної рідини.
Інгібітори синтезупростагландину, що застосовуються наприкінці вагітності, можуть спричиняти у матері та плода підвищення часу кровотечі таантиагрегантний ефект, що може виникати навіть при застосуванні дуже низьких доз.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти у великих дозах незадовго до пологів може призвести до внутрішньочерепних кровотеч, особливо у недоношених дітей.
Таким чином, крім надзвичайно особливих випадків, обумовлених кардіологічними або акушерськими медичними показаннями з використанням спеціального моніторингу,
застосування ацетилсаліцилової кислоти протягом III триместру вагітності протипоказане.
Саліцилати та їх метаболіти проникають у грудне молоко у невеликій кількості.
Оскільки побічні реакції у немовлят після випадкового застосування препарату не спостерігалися, переривати годування груддю, як правило, не вимагається. При довготривалому застосуванні препарату або застосуванні ацетилсаліцилової кислоти у високих дозах слід вирішити питання щодо припинення годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.
Не відзначалося впливу на здатність керувати автомобілем та іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.
Препарат приймати внутрішньо після їди, запиваючи достатньою кількістю рідини.
Препарат не можна застосовувати довше 3-5 діб без консультації лікаря.
Дорослі та діти віком від 15 років.
500-1000 мг як одноразова доза. Повторний прийом можливий через 4-8 годин. Максимальна добова доза не повинна перевищувати 4 г.
Попередження.
Для хворих із супутніми порушеннями функції печінки або нирок необхідно знизити дозу препарату або збільшити інтервал між застосуваннями

Діти.
Препарат застосовувати дітям віком від 15 років. Не слід застосовувати препарати, які містять ацетилсаліцилову кислоту, дітям із гострою респіраторною вірусною інфекцією (ГРВІ), яка супроводжується або не супроводжується підвищенням температури тіла. При деяких вірусних захворюваннях, особливо грипі А, грипі В та вітряній віспі, існує ризик розвитку синдрому Рея, який є дуже рідкісною, але небезпечною для життя хворобою, що потребує невідкладного медичного втручання. Ризик може бути підвищеним, якщо ацетилсаліцилова кислота застосовується як супутній лікарський засіб, проте причинно-наслідковий зв'язок у цьому випадку не доведений. Якщо вказані стани супроводжуються тривалим блюванням, це може бути ознакою синдрому Рея.

Передозування.
Передозування саліцилатів можливе внаслідок хронічної інтоксикації, що виникла внаслідок тривалої терапії (застосування понад 100 мг/кг/добу більше 2 днів може спричинити токсичні ефекти), а також через гостру інтоксикацію, яка несе загрозу життю (передозування), і причинами якої можуть бути, наприклад, випадкове застосування дітьми або непередбачене передозування.
Хронічне отруєння саліцилатами може мати прихований характер, оскільки його ознаки неспецифічні. Помірна хронічна інтоксикація, спричинена саліцилатами, або саліцилізм зустрічається, як правило, тільки після повторних прийомів великих доз.
Симптоми. Порушення рівноваги, запаморочення, дзвін у вухах, глухота, посилене потовиділення, нудота і блювання, головний біль, сплутаність свідомості. Зазначені симптоми можна контролювати зниженням дози. Дзвін у вухах може відзначатися при концентрації саліцилатів у плазмі крові понад 150-300 мкг/мл. Серйозніші побічні реакції зустрічаються при концентрації саліцилатів у плазмі крові понад 300 мкг/мл. Також можуть спостерігатися підвищення частоти дихання, гіпервентиляція, дихальний алкалоз. При інтоксикації від середнього до тяжкого ступеня можливий розвиток дихального алкалозу з компенсаторним метаболічним ацидозом, гіперпірексія, некардіогенний набряк легень до зупинки дихання, асфіксія; аритмія, артеріальна гіпотензія до зупинки серцевої діяльності;

дегідратація,олігуріядо ниркової недостатності, порушення метаболізму глюкози,кетоз; шлунково-кишкові кровотечі; гематологічні зміни – від пригнічення тромбоцитів до коагулопатій; з боку нервової системи – токсична енцефалопатія та пригнічення ЦНС, що проявляється у вигляді сонливості, пригнічення свідомості до розвитку коми та судом.
Про гостру інтоксикацію свідчить виражена зміна кислотно-лужного балансу, який може відрізнятися залежно від віку і тяжкості інтоксикації. Найбільш загальним показником для дітей є метаболічний ацидоз. Тяжкість стану не може бути оцінена лише на підставі концентрації саліцилатів у плазмі крові. Абсорбція ацетилсаліцилової кислоти може уповільнюватися у зв'язку із затримкою шлункового вивільнення, формуванням конкрементів у шлунку або у разі прийому препарату у формі таблеток, вкритих кишково-розчинною оболонкою.
Лікування.
Лікування інтоксикації, спричиненої передозуванням ацетилсаліцилової кислоти, визначається ступенем тяжкості, клінічними симптомами та забезпечується стандартними методами, які застосовуються при отруєнні. Усі застосовані заходи мають бути спрямовані на прискорення видалення препарату та відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу. Застосовують активоване вугілля, форсований лужний діурез. Залежно від стану кислотно-лужної рівноваги та електролітного балансу проводять інфузійневведення розчинів електролітів. При серйозних отруєннях показаний гемодіаліз.

Побічні реакції.
Шлунково-кишкові розлади. Диспепсія, біль уепігастральній ділянці та абдомінальний біль; в окремих випадках – запалення шлунково-кишкового тракту, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, які можуть у поодиноких випадках спричинити шлунково- кишкові кровотечі та перфорації з відповідними лабораторними та клінічними проявами. Рідко – транзиторна печінкова недостатність із підвищенням рівня трансаміназ печінки.
Система крові. Внаслідок антиагрегантної дії на тромбоцити ацетилсаліцилова кислота може підвищувати ризик розвитку кровотеч. Спостерігалися такі кровотечі як інтраопераційні геморагії, гематоми, кровотечі з органів сечостатевої системи, носові кровотечі, кровотечі з ясен; рідко або дуже рідко – серйозні кровотечі, такі як шлунково-кишкові кровотечі та мозкові геморагії (особливо у пацієнтів із неконтрольованою артеріальною гіпертензією та/або при одночасному застосуванні антигемостатичних засобів), які у поодиноких випадках могли потенційно загрожувати життю.
Кровотечі можуть призвести до гострої та хронічної постгеморагічної анемії/залізодефіцитної анемії (внаслідок так званої прихованої мікрокровотечі) з відповідними лабораторними проявами і клінічними симптомами, такими як астенія, блідість шкірного покриву, гіпоперфузія.
У хворих з дефіцитом глюкозо-6-фосфатдегідрогенази тяжкого ступеня повідомлялося про гемоліз та розвиток гемолітичної анемії.
Алергічні реакції. У пацієнтів з індивідуальною підвищеною чутливістю до саліцилатів можливий розвиток алергічних реакцій, включаючи такі симптоми як висипання, кропив'янка, набряк, свербіж, риніт, закладеність носа.
У хворих на бронхіальну астму можливе збільшення частоти виникнення бронхоспазму; алергічних реакцій від незначного до помірного ступеня, які потенційно вражають шкіру, дихальну систему, шлунково-кишковий тракт і серцево-судинну систему. Дуже рідко спостерігалися тяжкі реакції, включаючи анафілактичний шок танекардіогенний набряк легень.
Нервова система. Спостерігалися запаморочення і дзвін у вухах, що може свідчити про передозування.
Сечостатева система. Повідомлялося про ушкодження нирок та розвиток гострої ниркової недостатності.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.
Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 30 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.
По 10 таблеток у блістерах;
по 10 таблеток у блістері; по 1 блістеру в пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.
ПрАТ «Технолог».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
20300, Україна, м. Умань Черкаської обл., вул. Мануїльського, 8.