

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
АЦЕТИЛСАЛІЦИЛОВА КИСЛОТА
(ACIDUM ACETYLSALICYLICUM)

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: ацетилсаліцилова кислота;

1 таблетка містить кислоти ацетилсаліцилової 500 мг (0,5 г);

допоміжні речовини: кислота лимонна моногідрат, кислота стеаринова, крохмаль картопляний.

Лікарська форма. Таблетки.

Таблетки білого кольору з плоскою поверхнею, скошеними краями та рискою.

Назва і місцезнаходження виробника.

ПАТ «Монфарм». Україна, 19100, Черкаська обл., м. Монастирище, вул. Заводська, 8.

Фармакотерапевтична група.

Аналгетики та антипіретики. Код АТС N02B A01.

Ацетилсаліцилова кислота належить до групи нестероїдних протизапальних лікарських засобів з анальгетичними, жарознижувальними і 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 і анкілозуючий спондиліт. При таких захворюваннях застосовують, як правило, високі дози препарату від 4 г до 8 г ацетилсаліцилової кислоти на добу.

Ацетилсаліцилова кислота пригнічує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування синтезу тромбоксану ~~А~~ та застосовується при багатьох судинних захворюваннях у дозах 75-300 мг на добу.

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 – 20-120 хвилин відповідно.

Ацетилсаліцилова та саліцилова кислоти повністю зв'язується з білками плазми крові і швидко розподіляється в організмі. Саліцилова кислота проникає крізь плаценту і у грудне молоко.

Саліцилова кислота зазнає метаболізму у печінці.

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 з організму переважно нирками.

Показання для застосування.

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 нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ), в анамнезі.

Гострі шлунково-кишкові виразки.

Геморагічний діатез.

Тяжка ниркова недостатність.

Тяжка 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»).

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Ацетилсаліцилову кислоту застосовують з обережністю при:

гіперчутливості до анагетичних, протизапальних, протиревматичних засобів, а також при наявності алергії на інші речовини;

шлунково-кишкових виразках в анамнезі, у тому числі при хронічній чи рецидивуючій виразковій хворобі або шлунково-кишкових кровотечах в анамнезі;

одночасному застосуванні антикоагулянтів;

помірних порушеннях функцій нирок та/або печінки.

У пацієнтів з алергічними ускладненнями, у тому числі з бронхіальною астмою, алергічним ринітом, кропив'янкою, шкірним свербіжем, набряком слизової оболонки та поліпозом носа, а також при їх поєднанні з хронічними інфекціями дихальних шляхів та у хворих із гіперчутливістю до НПЗЗ та на тлі лікування ацетилсаліциловою кислотою можливий розвиток бронхоспазму або нападу бронхіальної астми.

При хірургічних операціях (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 подагри у пацієнтів, які мають знижене виведення сечової кислоти.

Призначення препарату дітям віком до 15 років як протигарячкового засобу може сприяти виникненню синдрому Рея.

При тривалому застосуванні для виявлення ульцерогенної дії необхідно періодично досліджувати кал на наявність крові, а також робити аналізи крові (1 раз в 2 тижні). За 5-7 діб до хірургічних втручань препарат треба відмінити.

Особливі застереження.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

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 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 ацетилсаліцилової кислоти та збільшенням ризику вроджених вад.

Згідно з попередніми оцінками, при довготривалому застосуванні препарату, не рекомендується приймати у дозі, що перевищує 150 мг/добу.

У III триместрі вагітності прийом саліцилатів у високих дозах (понад 300 мг/добу) може призвести до переносування вагітності та послаблення переймів під час пологів, а також до кардіопульмональної токсичності (передчасного закриття *ductus arteriosus*) або порушення ниркової функції у плода.

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 про припинення годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Інформація щодо впливу препарату на здатність керувати транспортними засобами та працювати зі складними механізмами відсутня.

Доки не буде з'ясована індивідуальна реакція пацієнта на препарат, слід утримуватись від керування автотранспортом або іншими механізмами, враховуючи, що під час лікування ацетилсаліциловою кислотою можливі такі побічні реакції з боку нервової системи як запаморочення і дзвін у вухах, зниження слуху.

Діти.

Не рекомендується застосовувати дітям до 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.

Спосіб застосування та дози.

Ацетилсаліцилову кислоту приймати внутрішньо після їжі, запиваючи достатньою кількістю рідини.

Ацетилсаліцилову кислоту не можна застосовувати довше 3-5 днів без консультації лікаря.

Дорослі та діти віком від 15 років.

Разова доза – 500-1000 мг. Повторний прийом можливий через 4-8 годин. Максимальна добова доза не має перевищувати 4 г.

Попередження.

Для хворих із помірними порушеннями функції печінки або нирок слід зменшити дозу препарату або збільшити інтервал між застосуваннями.

Передозування.

Передозування саліцилатів можливе через хронічну інтоксикацію, що виникла внаслідок тривалої терапії (застосування понад 100 мг/добу більше 2 днів може спричинити токсичні ефекти), а також 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, ~~об~~оротні порушення зору, блювання, порушення реологічних властивостей і згортання крові. При значному передозуванні мовна сплутаність, сонливість, колапс, тремор, задишка, ядуха, гіпертермія, зневоднення, кома, метаболічний ацидоз, дихальний алкалоз, порушення вуглеводного обміну.

Зазначені симптоми можна контролювати зниженням дози. Дзвін у вухах може відзначитися 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.

Про гостру інтоксикацію свідчить виражена зміна кислотно-лужного балансу, який може відрізнитися 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

кишковорозчинною оболонкою.

Лікування.

Лікування інтоксикації, спричиненої передозуванням ацетилсаліцилової кислоти, визначається ступенем тяжкості, клінічними симптомами та забезпечується стандартними методами, які застосовують 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 інфузійне введення розчинів електролітів. При тяжких отруєннях показаний гемодіаліз.

Побічні ефекти.

Шлунково-кишкові розлади. Диспепсія, біль у епігастральній ділянці та абдомінальний біль/вечія, нудота та блювання; 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.

З боку системи 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, тромбоцитопенія, лейкопенія, синдром Рея (внаслідок так званої прихованої мікрокровотечі) з відповідними лабораторними проявами і клінічними симптомами, такими як астенія, блідість шкірного покриву, гіпоперфурія.

Алергічні реакції. У пацієнтів з індивідуальною підвищеною чутливістю до саліцилатів можливий розвиток алергічних реакцій, включаючи такі симптоми яктоксикодермія, висипи, 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, при тривалому застосуванні: інтерстиціальний нефрит, преренальна азотемія з підвищенням рівня креатиніну крові та гіперкальціємією, папілярний некроз, гостра ниркова недостатність, нефротичний синдром, захворювання крові, асептичний менінгіт, посилення симптомів застійної серцевої недостатності, набряки, підвищення активності амінотрансфераз у крові.

Дуже рідко спостерігали тяжкі реакції, включаючи анафілактичний шок та некардіогенний набряк легень.

З боку нервової системи. Спостерігалися запаморочення і дзвін у вухах/зниження слуху, що може свідчити про передозування.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Протипоказані комбінації.

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 білками 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 ацетилсаліцилової кислоти 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.

Діуретичні засоби у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти знижують фільтрацію клубочків завдяки зниженню синтезу простагландинів у нирках.

Системні глюкокортикостероїди (включаючи 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 вазодилаторних 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 білками плазми крові, підвищуючи токсичність останньої.

Етиловий спирт сприяє пошкодженню слизової оболонки шлунково-кишкового тракту і пролонгує час кровотечі внаслідок синергізму ацетилсаліцилової кислоти та алкоголю.

Термін придатності 4 роки.

Умови зберігання. В оригінальній упаковці при температурі не вище 25°C. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у стрипах або блістерах, №20 (10x2) у стрипах або блістерах, №100 (10x10) у стрипах або блістерах.

Категорія відпуску. Без рецепта.