

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
АСПІРИН®С
(ASPIRIN®С)

Загальна характеристика:

основні фізико-хімічні властивості: круглі, плоскі таблетки білого кольору, на одному боці таблетки нанесено маркування у вигляді фірмового байєровського хреста;

склад: 1 таблетка містить 400 мг кислоти ацетилсаліцилової та 240 мг кислоти аскорбінової (вітамін С);

допоміжні речовини: натрію цитрат безводний, натрію гідрокарбонат, кислота лимонна, натрію карбонат безводний.

Форма випуску. Таблетки шипучі.

Фармакотерапевтична група. Інші аналгетики і антипіретики. Кислота ацетилсаліцилова. Код АТС N02B A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Ацетилсаліцилова кислота належить до групи нестероїдних протизапальних лікарських засобів з аналгетичними, жарознижувальними і протизапальними властивостями. Механізм її дії полягає у незворотній інактивації ферментів циклооксигенази, що відіграють важливу роль при синтезі простагландинів.

При пероральному прийомі в 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 в суглобах і м'язах.

Ацетилсаліцилова кислота також застосовується при гострих і хронічних запальних захворюваннях, таких як ревматоїдний артрит, остеоартрити, і анкілозивному спондиліті. При таких захворюваннях застосовуються, як правило, високі дози препарату від 4 г до 8 г ацетилсаліцилової кислоти на добу.

Ацетилсаліцилова кислота пригнічує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування синтезу тромбоксану А₂ і застосовується при багатьох судинних захворюваннях в дозах 75 мг - 300 мг на добу.

Водорозчинний вітамін - кислота аскорбінова є частиною захисної системи організму проти радикалів кисню та інших окисників ендогенного і екзогенного походження, які відіграють особливу роль в запальних процесах і функціонуванні лейкоцитів.

Результати *in vitro* і *ex vivo* досліджень показали, що кислота аскорбінова має позитивну дію на лейкоцитарну імунну відповідь людини.

Кислота аскорбінова вносить суттєвий вклад в синтез внутрішньоклітинних речовин (мукополісахаридів), які одночасно з волокнами колагену відповідають за цілісність стінок капілярів і, таким чином, зменшують проникність судин.

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо кислота ацетилсаліцилова швидко і повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Під час та після абсорбції вона перетворюється на основний активний метаболіт - кислоту саліцилову. Максимальна концентрація кислоти ацетилсаліцилової в плазмі крові досягається через 10 - 20 хв, саліцилатів - 20 - 120 хв відповідно.

Ацетилсаліцилова і саліцилова кислоти повністю зв'язуються з білками плазми крові й швидко розподіляються в організмі. Саліцилова кислота проникає через плаценту, а також потрапляє в грудне молоко.

Саліцилова кислота зазнає метаболізму в печінці. Метаболітами саліцилової кислоти є саліцилсечова кислота, саліцилфенол глюкоуронід, саліцилалцил глюкоуронід, гентизинова кислота і 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 год при застосуванні низьких доз до 15 год - при застосуванні високих доз. Саліцилова кислота та її

Сторінка 2 з 6. Видавець: Державний експертний центр МОЗ України
метаболіти виводяться з організму переважно нирками.

Після перорального застосування кислота аскорбінова абсорбується в кишечнику людини Na^+ -залежною активною транспортною системою, найбільш активно в проксимальному відділі кишечника. Абсорбція не пропорційна дозі. При підвищенні добової оральної дози кислоти аскорбінової її концентрація в плазмі та інших рідинах організму не підвищується пропорційно, а має тенденцію наближатися до верхньої межі.

Кислота аскорбінова фільтрується крізь клубочки і реабсорбується проксимальними каналцями під дією Na^+ залежного процесу. Основні метаболіти виводяться із сечею у незмінному стані або у вигляді основних метаболітів: оксалатів і дикетогулонової кислоти.

Показання для застосування. Для симптоматичного полегшення головного болю, зубного болю; болю в горлі, альгодисменореї, болю в м'язах і суглобах; болю в спині, помірного болю, обумовленого артритом.

При застуді або при гострих респіраторних захворюваннях; для симптоматичного полегшення болю і гарячки.

Спосіб застосування та дози. Аспірин[®]С приймають перорально. Шипучі таблетки розчиняють у склянці води безпосередньо перед прийомом.

Застосування Аспірину[®]С довше, ніж 3-5 днів, можливо тільки після консультації з лікарем!

Дозу препарату розраховують за ацетилсаліциловою кислотою.

Дорослі.

1 - 2 шипучі таблетки як одноразова доза. Повторний прийом можливий через 4-8 годин. Максимальна добова доза не повинна перевищувати 10 таблеток (4 г).

Діти. Загалом рекомендована добова доза кислоти ацетилсаліцилової для дітей віком від 1 року - 60 мг/кг маси тіла, які рекомендується давати в 4-6 прийомів, тобто 15 мг/кг маси тіла кожні 6 годин або 10 мг/ кг маси тіла кожні 4 години.

1-4 роки: 100 мг – 200 мг кислоти ацетилсаліцилової як одноразова доза (1/4-1/2 склянки розчину з 1 таблетки);

5-9 років: 200 мг – 400 мг кислоти ацетилсаліцилової як одноразова доза (1/2 склянки розчину – 1 склянка розчину з 1 таблетки).

Для дітей віком від 9 років разова доза становить 400 мг (1 таблетка), добова -1-3 таблетки. Разову дозу при необхідності можна приймати 3 рази на добу (по 1 таблетці) з інтервалом 4-8 годин.

Попередження

Призначення препарату дітям необхідно робити з урахуванням інформації, що викладена у розділі Інструкції «Спеціальні попередження та застережні заходи».

Для хворих із супутніми порушеннями функції печінки або нирок необхідно знизити дозу препарату або збільшити інтервал між прийомами.

Побічна дія. Шлунково-кишкові розлади: диспепсія, біль в епігастральній ділянці та абдомінальний біль; в окремих випадках - запалення шлунково-кишкового тракту, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, які можуть в поодиноких випадках, спричинити шлунково-кишкові геморагії і перфорації з відповідними лабораторними показниками та клінічними проявами.

Внаслідок антиагрегантної дії на тромбоцити ацетилсаліцилова кислота може підвищувати ризик розвитку кровотеч. Спостерігались такі кровотечі, як інтраопераційні геморагії, гематоми, кровотечі з органів сечостатевої системи, носові кровотечі, кровотечі з ясен; рідко або дуже рідко - серйозні кровотечі, такі як геморагії шлунково-кишкового тракту, мозкові геморагії (особливо в пацієнтів із

Сторінка 3 з 6. Видавець: Державний експертний центр МОЗ України
неконтрольованою гіпертензією та/або при одночасному застосуванні антигемостатичних засобів), які в поодиноких випадках могли потенційно загрожувати життю.

Геморагії можуть призвести до гострої і хронічної постгеморагічної анемії/залізодефіцитної анемії (внаслідок так званої прихованої мікрокровотечі) з відповідними лабораторними проявами і клінічними симптомами, такими як астенія, блідість шкірного покриву, гіперперфузія.

У пацієнтів з індивідуальною підвищеною чутливістю до саліцилатів можливий розвиток алергічних реакцій шкіри, включаючи такі симптоми, як висип, кропив'янка, набряк, свербіж. У хворих на бронхіальну астму можливе збільшення частоти виникнення бронхоспазму; алергічних реакцій від незначного до помірного ступеня, які потенційно вражають шкіру, респіраторний тракт, шлунково-кишковий тракт і кардіоваскулярну систему. Дуже рідко спостерігали тяжкі реакції, включаючи анафілактичний шок.

Рідко - транзиторна печінкова недостатність із підвищенням рівня трансаміназ печінки.

Спостерігались запаморочення і дзвін у вухах, що може свідчити про передозування.

Протипоказання.

- Гіперчутливість до ацетилсаліцилової кислоти, інших саліцилатів або будь-якого компонента препарату.
- Астма, спричинена застосуванням саліцилатів або інших НПЗЗ в анамнезі.
- Гострі пептичні виразки.
- Геморагічний діатез.
- Виражена ниркова недостатність.
- Виражена печінкова недостатність.
- Виражена серцева недостатність.
- Комбінація з метотрексатом у дозуванні 15 мг/тиждень або більше (див. розділ «Взаємодію з іншими лікарськими засобами.»).
- III триместр вагітності.

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 внаслідок гострої інтоксикації, 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 ознаки і симптоми його неспецифічні. Помірна хронічна інтоксикація, спричинена саліцилатами, або саліцилізм зустрічається, як правило, тільки після повторних прийомів великих доз.

Симптоми. Запаморочення, вертиго, дзвін у вухах, глухота, посилене потовиділення, нудота і блювання, головний біль сплутаність свідомості. Зазначені симптоми можна контролювати зниженням дози. Дзвін у вухах може зустрічатися при концентрації саліцилатів в плазмі крові вище ніж 150-300 мкг/мл. Серйозніші побічні реакції зустрічаються при концентрації саліцилатів у плазмі крові вище 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 в плазмі. Абсорбція ацетилсаліцилової кислоти може уповільнюватися в зв'язку із затримкою шлункового вивільнення, формуванням конкрементів в шлунку або в разі прийому препарату в формі таблеток, вкритих кишково-розчинною оболонкою.

Лікування.

Лікування інтоксикації, спричиненої передозуванням ацетилсаліцилової кислоти, визначається ступенем тяжкості, клінічними симптомами і забезпечується стандартними методами, які

застосовують при отруєнні. Всі застосовані заходи повинні бути спрямовані на прискорення видалення препарату та відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу. Застосовують прийом активованого вугілля, форсований лужний діурез. Залежно від стану кислотно-лужної рівноваги та електролітного балансу проводять інфузійне введення розчинів електролітів. При серйозних отруєннях показаний гемодіаліз.

Особливості застосування.

Спеціальні попередження і застережні заходи. Не слід застосовувати препарати, які містять ацетилсаліцилову кислоту, дітям із гострою респіраторною вірусною інфекцією (ГРВІ), яка супроводжується або не супроводжується підвищенням температури тіла, без консультації з лікарем. При деяких вірусних захворюваннях, особливо грипі А, грипі В і 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.

Аспірин®С застосовують з обережністю при:

- гіперчутливості до анагетичних, протизапальних, протиревматичних засобів, а також за наявності алергії на інші речовини;
- виразках шлунково-кишкового тракту, включаючи хронічні та рекурентні виразкові хвороби або шлунково-кишкові кровотечі в анамнезі;
- одночасному застосуванні антикоагулянтів;
- 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 і поліпозом носа, а також при їх поєднанні з хронічними інфекціями дихальних шляхів та у хворих із гіперчутливістю до НПЗЗ на тлі лікування препаратом «Аспірин® С» можливий розвиток бронхоспазму або нападу бронхіальної астми.

При хірургічних операціях (включаючи стоматологічні) 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 знижуватись виведення сечової кислоти. Це може призвести до виникнення подагри у пацієнтів, які мають знижене виведення сечової кислоти.

1 шипуча таблетка Аспірин®С містить 933 мг натрію, що слід враховувати пацієнтам, які перебувають на дієті з обмеженням натрію.

Вагітність і лактація. Аспірин®С може застосовуватися в період вагітності тільки в тому випадку, коли інші лікарські засоби не є ефективними.

Застосування саліцилатів у I триместрі вагітності в деяких ретроспективних епідеміологічних дослідженнях асоціювалося з підвищеним ризиком розвитку вроджених вад (палатосхиз («вовча паща»), вади серця). Проте при довготривалому застосуванні препарату в терапевтичних дозах, що перевищували 150 мг/добу, цей ризик виявився низьким: у результаті дослідження, проведеного на 32 000 парах "мати - дитина", не виявлено зв'язку між застосуванням препарату «Аспірин® С» і збільшенням кількості вроджених вад.

Саліцилати можна застосовувати під час вагітності тільки після оцінки співвідношення ризик/користь. Згідно з попередніми оцінками, при довготривалому застосуванні препарату «Аспірин® С» бажано не приймати ацетилсаліцилову кислоту в дозі, що перевищує 150 мг/добу.

У III триместрі вагітності прийом саліцилатів у високих дозах (більш ніж 300 мг/добу) може

призвести до переносу вагітності та послаблення переймів під час пологів, а також до кардіопульмональної токсичності (передчасного закриття ductus arteriosus) у дітей.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти у великих дозах незадовго до пологів може призвести до внутрішньочерепних кровотеч, особливо в недоношених дітей. Таким чином, крім надзвичайно особливих випадків, обумовлених кардіологічними або акушерськими медичними показаннями з використанням спеціального моніторингу, застосування ацетилсаліцилової кислоти протягом останнього триместру вагітності протипоказане.

Саліцилати та їх метаболіти проникають у грудне молоко в невеликій кількості.

Оскільки побічні реакції в 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.

Вплив на керування автомобілем та іншими механізмами. Не впливає на здатність керувати автомобілем та іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Протипоказання для взаємодії.

Застосування метотрексату в 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).

Комбінації, які потрібно застосовувати з обережністю.

При застосуванні метотрексату в дозах менше ніж 15 мг/тиждень підвищується гематологічна токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми).

Одночасне застосування ібупрофену перешкоджає незворотному інгібуванню тромбоцитів ацетилсаліциловою кислотою. Лікування ібупрофеном пацієнтів, які мають ризик кардіоваскулярних захворювань, може обмежувати кардіопротекторну дію ацетилсаліцилової кислоти.

При одночасному застосуванні препарату «Аспірин® С» та антикоагулянтів підвищується ризик розвитку кровотечі.

При одночасному застосуванні високих доз саліцилатів із НПЗЗ (завдяки взаємопосилючому 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 каналцями).

При одночасному застосуванні з дигоксином концентрація останнього в плазмі 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 в 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 Адисона, в період лікування кортикостероїдами знижують рівень саліцилатів в крові та підвищують ризик передозування після закінчення лікування.

При застосуванні з кортикостероїдами підвищується ризик розвитку шлунково-кишкової кровотечі.

Ангіотензинперетворюючі ферменти (АПФ) у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти спричиняють зниження фільтрації в клубочках внаслідок інгібування вазодилататорних простагландинів та зниження антигіпертензивного ефекту.

При одночасному застосуванні з вальпроєвою кислотою ацетилсаліцилова кислота витісняє її зі зв'язку з протеїнами плазми, підвищуючи токсичність останньої.

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

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 25°C. Термін придатності – 3 роки. Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови відпуску. Без рецепта.

Упаковка. По 2 таблетки в стрипі з паперу, ламінованому алюмінієвою фольгою; по 5 або 10 стрипів в картонній коробці.

Виробник. Байєр АГ/Bayer AG; Байєр Біттерфельд ГмбХ/ Bayer Bitterfeld GmbH.

Адреса. Байєр АГ, D-51368, Лєверкузен, Німєччина/ Bayer AG, D-51368 Leverkusen, Germany;
Байєр Біттерфельд ГмбХ, D-06803 Греппін, Німєччина/ Bayer Bitterfeld GmbH, D-06803 Greppin, Germany.