

**Инструкция по медицинскому применению  
лекарственного средства**

**УПСАРИН УПСА**

**Торговое название**

Упсарин УПСА

**Международное непатентованное название**

Ацетилсалициловая кислота

**Лекарственная форма**

Таблетки шипучие 500 мг

**Состав**

Одна таблетка содержит

*активное вещество:* ацетилсалициловая кислота - 500 мг,

*вспомогательные вещества:* натрия гидрокарбонат, кислота лимонная безводная, натрия цитрат безводный, натрия карбонат безводный, аспартам Е 951, повидон (К30), кросповидон, ароматизатор апельсиновый\*.

\*алфа-пинен, бета-пинен, мирцен, лимонен, октаналь, деканаль, линалол, алфа-терпинеол, мальтодекстрин, акация, серы диоксид, бутилированный гидроксианизол.

**Описание**

Таблетки белого цвета со скошенными краями, плоской поверхностью и риской, растворяются в воде с выделением пузырьков газа.

**Фармакотерапевтическая группа**

Анальгетики и антипиретики. Салициловая кислота и ее производные.

Ацетилсалициловая кислота.

Код АТХ N02BA01

## **Фармакологические свойства**

### ***Фармакокинетика***

Ацетилсалициловая кислота быстро абсорбируется при пероральном введении. Максимальные концентрации в плазме достигаются через 15-40 минут. Ацетилсалициловая кислота подвергается быстрому гидролизу с образованием активного метаболита салициловой кислоты. Биодоступность зависит от дозы и составляет 60% для дозы менее 500 мг и 90% для доз свыше 1 г. Ацетилсалициловая кислота и салициловая кислота быстро распределяются во все ткани. Проникают через плацентарный барьер и поступают в материнское молоко. Салициловая кислота в значительной степени связывается белками плазмы (90%). Период полувыведения из плазмы составляет 15-20 минут для ацетилсалициловой кислоты и 2 - 4 часа для салициловой кислоты. Ацетилсалициловая кислота в значительной степени подвергается метаболизму в печени, выводится преимущественно с мочой в виде салициловой кислоты и глюкуроновых конъюгатов.

### ***Фармакодинамика***

Ацетилсалициловая кислота относится к группе нестероидных противовоспалительных препаратов с обезболивающими, жаропонижающими и противовоспалительными свойствами. Механизм её действия обусловлен необратимым ингибированием ферментов циклооксигеназы, участвующих в синтезе простагландина. Ацетилсалициловая кислота ингибирует агрегацию тромбоцитов, блокируя синтез тромбоксана А<sub>2</sub> в тромбоцитах.

## **Показания к применению**

- симптоматическое лечение боли от легкой до умеренной степени интенсивности и/или лихорадочных состояний,
- хронический воспалительный ревматизм, острый суставной ревматизм у детей,
- симптоматическое лечение воспалительного ревматизма у взрослых.

## **Способ применения и дозы**

Полностью растворить таблетку в большом стакане воды и немедленно выпить.

Максимальная рекомендованная суточная доза составляет 3 г аспирина, т.е. 6 шипучих таблеток в сутки.

Разовая доза составляет одну шипучую таблетку по 500 мг. При необходимости дозу можно повторить через интервал не менее 4 часов. В случае более интенсивной боли или лихорадки можно принимать дозу две шипучие таблетки по 500 мг, которую, при необходимости, можно

повторить через интервал 4 часа, не превышая дозы 6 шипучих таблеток в сутки.

*Лица пожилого возраста:*

Максимальная суточная доза составляет 2 г аспирина, т.е. 4 шипучих таблетки в сутки.

Разовая доза составляет одну шипучую таблетку по 500 мг. При необходимости дозу можно повторить через интервал не менее 4 часов. В случае более интенсивной боли или лихорадки можно принимать дозу две шипучие таблетки по 500 мг, которую, при необходимости, можно повторить через интервал 4 часа, не превышая дозы 4 шипучие таблетки в сутки.

*Частота приемов*

Регулярные приемы позволяют избежать колебаний степени боли и лихорадки. У взрослых интервал между приемами должен составлять не менее 4 часов.

*Длительность лечения* (без консультации с врачом) не должна превышать 5 дней при назначении в качестве обезболивающего средства и не более 3 дней – в качестве жаропонижающего средства.

*Ревматические заболевания*

Только для взрослых и детей с массой тела 50 кг и более.

Взрослые

Максимум 3-6 г в сутки. Дозу следует разделить на 3-4 приема с интервалом между приемами не менее 4 часов. У пожилых пациентов дозу следует уменьшить.

Дети

Данная форма выпуска предназначена для детей с массой тела 50 кг и больше.

Максимум 50 мг/кг – 100 мг/кг в сутки. Дозу следует разделить на 4-6 приемов с интервалом между приемами не менее 4 часов.

## **Побочные действия**

*Эффекты со стороны желудочно-кишечного тракта*

- боль в животе
- выраженное (кровавая рвота, кровавый стул, и т.д.) или скрытое желудочно-кишечное кровотечение, обуславливающее железодефицитную анемию. Чем выше доза, тем выше частота возникновения таких кровотечений.
- язвы и перфорации желудка.

*Эффекты со стороны центральной нервной системы*

- головные боли, вертиго
- ощущение снижения слуха
- звон в ушах, которые обычно являются признаками передозировки.

*Гематологические эффекты*

Геморрагический синдром (носовые кровотечения, кровотечения из десен, пурпура, и.т.д.) может вызвать увеличение риска кровотечения у пациентов, подвергающихся хирургическому вмешательству. Это действие может сохраняться в течение 4-8 дней после прекращения приема.

*Реакция повышенной чувствительности*

- крапивница, кожные реакции, анафилактические реакции, астма, отек Квинке.

*Синдром Рейе.*

## **Противопоказания**

Данное лекарственное средство противопоказано в следующих случаях:

- повышенная чувствительность к ацетилсалициловой кислоте или к какому-либо из вспомогательных веществ
- фенилкетонурия, поскольку препарат содержит аспартам
- наличие в анамнезе астмы, спровоцированной приемом салицилатов или веществ с подобной активностью, особенно нестероидных противовоспалительных препаратов
- последний триместр беременности ( $\geq 500$  мг в сутки и на прием)
- язва желудка и двенадцатиперстной кишки в активной фазе
- любое конституциональное или приобретенное геморрагическое заболевание
- риск геморрагии
- тяжелая печеночная и почечная недостаточность
- тяжелая, неконтролируемая сердечная недостаточность
- комбинация с метотрексатом при дозах, превышающих 15 мг/неделю
- комбинация с пероральными антикоагулянтами при использовании больших доз ацетилсалициловой кислоты, особенно при лечении ревматических заболеваний
- детский возраст до 16 лет.

## **Лекарственные взаимодействия**

*Риски, связанные с ингибированием агрегации тромбоцитов*

Совместное применение нескольких лекарственных средств, которые могут ингибировать агрегацию тромбоцитов: ацетилсалициловая кислота и НПВП, тиклопидин и клопидогрель, тирофибан, эптифибатид и абциксимаб, илопрост, повышает риск кровотечения. При комбинации антитромбоцитарных препаратов и гепарина или подобных веществ (гирудинов), пероральных антикоагулянтов и тромболитиков следует проводить тщательный клинический и лабораторный мониторинг.

*Комбинации, которые противопоказаны*

- пероральный антикоагулянт вытесняется с его участка связывания с белками плазмы при совместном применении с ацетилсалициловой кислотой в больших дозах (более 3 г в день),

- метотрексат, применяемый при дозах более 15 мг/неделю: повышение гематологической токсичности метотрексата (снижение почечного клиренса метотрексата под влиянием противовоспалительных средств и вытеснение ацетилсалициловой кислотой метотрексата с участка его связывания с белками плазмы).

*Комбинации, которые нежелательны*

- пероральные антикоагулянты, гепарины (парентеральный путь введения): повышение риска кровотечений (ингибирование функции тромбоцитов и раздражение гастродуоденальной слизистой за счет НПВП). Следует контролировать время кровотечения.

- другие нестероидные противовоспалительные препараты: для ацетилсалициловой кислоты в больших дозах (более 3 г в день): повышение риска образования язвы и желудочно-кишечного кровотечения (аддитивная синергия).

- урикозурические средства (бензбромарон для доз ацетилсалициловой кислоты) 3 г в день или ниже): сниженный урикозурический эффект за счет конкуренции за выведение мочевой кислоты в почечных канальцах.

*Комбинации, которые следует применять с осторожностью*

- противодиабетические средства (инсулины): усиление гипогликемических эффектов при высоких дозах ацетилсалициловой кислоты. Необходимо проинформировать пациента, а также потребовать более строгого самоконтроля уровней глюкозы в плазме.

- диуретики, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента, ингибиторы преобразующего фермента и путем экстраполяции – ингибиторы ангиотензина II для ацетилсалициловой кислоты при высоких дозах (более 3 г в день): острая почечная недостаточность у пациентов с обезвоживанием (сниженная клубочковая фильтрация из-за сниженного синтеза почечных простагландинов). Кроме того, снижается антигипертензивный эффект. Необходимо обеспечить поступление жидкости в организм пациента и следить за функцией почек в начале лечения.

- глюкокортикоиды (при системном применении), за исключением гидрокортизона, применяемого в качестве заместительной терапии при болезни Аддисона: снижение уровней салицилатов в крови в течение лечения кортикостероидами и риск передозировки салицилатов после их отмены (поскольку кортикостероиды усиливают выведение салицилатов). Корректировка дозы салицилатов в течение сопутствующего приема глюкокортикоидов и после отмены комбинированной терапии.

- метотрексат, применяемый при дозах менее 15 мг/неделю: повышенная токсичность, особенно гематологическая, метотрексата (снижение почечного клиренса метотрексата противовоспалительными средствами в целом и вытеснения аспирином метотрексата с участка его связывания с белками плазмы). В течение первых недель комбинированной терапии

необходимо еженедельно выполнять полный анализ крови. Особое внимание требуется при любом, даже небольшом, нарушении функции почек, а также у лиц пожилого возраста.

*Комбинации, на которые следует обращать внимание*

- внутриматочные противозачаточные средства: для ацетилсалициловой кислоты при высоких дозах (более 3 г в день): риск (спорный) сниженной эффективности внутриматочного противозачаточного средства.
- локальные желудочно-кишечные средства, такие как соли, оксиды и гидроксиды магния, алюминия и кальция: повышенное почечное выведение салицилатов по причине ощелачивания мочи.

### **Особые указания**

- Во избежание риска передозировки при комбинации с другими препаратами следует убедиться, что другие препараты не содержат ацетилсалициловую кислоту.
- При длительном приеме больших доз обезболивающих лекарственных средств может возникать головная боль, которую не следует лечить путем ещё большего увеличения дозы препарата. Регулярное применение обезболивающих, особенно в комбинации, может вызвать стойкое поражение почек с риском развития почечной недостаточности.
- Детям следует назначать препараты, содержащие ацетилсалициловую кислоту, только по рекомендации врача, поскольку в случае вирусной инфекции повышается риск возникновения синдрома Рейе. Симптомами синдрома Рейе являются: продолжительная рвота, расстройство сознания, аномальное поведение.
- В случаях недостаточности глюкозо-6-фосфат дегидрогеназы ацетилсалициловую кислоту следует принимать под наблюдением врача из-за риска возникновения гемолиза.
- Перед хирургическим вмешательством, учитывая антитромбоцитарное действие ацетилсалициловой кислоты, необходимо поставить в известность врача.
- 1 шипучая таблетка содержит 388,5 мг натрия, что следует учитывать пациентам, находящимся на строгой диете с ограничениями натрия.
- Поскольку данные препарата содержат глюкозу, он противопоказан при синдроме мальабсорбции глюкозы и галактозы.
- Необходимо проводить усиленный мониторинг лечения в следующих случаях:
  - наличие желудочно-кишечных язв в анамнезе, желудочно-кишечного кровотечения или гастрита;
  - почечная или печеночная недостаточность;
  - астма: у некоторых лиц возникновение приступа астмы может быть связано с аллергией на НПВП или на ацетилсалициловую кислоту. В таких случаях это лекарственное средство противопоказано.

- метороррагия или меноррагия (риск усиления менструального кровотечения и продления менструации);
- использование внутриматочных противозачаточных средств.
- Возможны желудочно-кишечные кровотечения или язвы/перфорации, в том числе в анамнезе. Относительный риск повышается у пожилых людей, лиц с низкой массой тела и у пациентов, получающих антикоагулянтную или антитромбоцитарную терапию. При возникновении желудочно-кишечного кровотечения лечение прием препарата следует немедленно прекратить.
- Учитывая антитромбоцитарное действие ацетилсалициловой кислоты, которое проявляется при самых низких дозах и сохраняется в течение нескольких дней, пациентов следует предупредить о риске кровотечения, которое может возникнуть во время хирургических вмешательств (например, удаление зуба).
- Ацетилсалициловая кислота изменяет урикемию (анальгетическая доза ацетилсалициловой кислоты повышает урикемию, ингибируя выделение мочевой кислоты, кроме того, ацетилсалициловая кислота оказывает урикозурический эффект при дозах, используемых в ревматологии).
- При высоких дозах, используемых в ревматологии, рекомендуется следить за появлением признаков передозировки. Следует провести переоценку лечения в случае возникновения звона в ушах, снижении слуха и вертиго. Рекомендуется следить за уровнями салицилатов в крови у детей, особенно в начале лечения.

#### *Беременность и период лактации*

При необходимости ацетилсалициловую кислоту можно назначать для симптоматического лечения в период I и II триместра беременности.

Может назначаться только после оценки польза/риск.

В качестве меры предосторожности, желательно не использовать ацетилсалициловую кислоту для долгосрочного лечения при дозе свыше 150 мг/день.

За исключением очень ограниченных кардиологических и акушерских случаев, оправданных медицинскими рекомендациями и особым мониторингом, любой препарат, содержащий ацетилсалициловую кислоту, противопоказан в течение последних трех месяцев беременности.

#### *Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами*

Не наблюдалось случаев влияния на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами.

### **Передозировка**

Существует риск отравления у лиц пожилого возраста и, особенно, у маленьких детей, который может быть опасным для жизни.

*Симптомы:*

звон в ушах, ощущение снижения слуха, головные боли, вертиго являются признаками передозировки. Их можно контролировать снижением дозы.

*Тяжелое отравление:*

У детей передозировка может быть смертельной при приеме 100 мг/кг или более за один прием. К симптомам относятся: лихорадка, гипервентиляция, кетоз, респираторный алкалоз, метаболический ацидоз, кома, сосудистая недостаточность, дыхательная недостаточность, выраженная гипогликемия.

*Лечение:*

Немедленная госпитализация в специализированное медицинское учреждение. Выведение вещества посредством промывания желудка и введения активированного угля. Контроль кислотно-щелочного баланса. Щелочной диурез, позволяющий добиться рН мочи 7,5-8. В случаях тяжелого отравления возможен гемодиализ. Симптоматическое лечение.

### **Форма выпуска и упаковка**

По 4 таблетки в контурной безъячейковой упаковке (стрип) из фольги алюминиевой с полиэтиленовым покрытием.

По 4 контурные безъячейковые упаковки (стрипы) вместе с инструкцией по медицинскому применению на казахском и русском языках помещают в картонную коробку.

### **Условия хранения**

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

### **Срок хранения**

3 года

Не использовать по истечении срока годности.

### **Условия отпуска из аптек**

Без рецепта

### **Производитель**

УПСА САС,

979 авеню де Пирене, 47520 Ле Пассаж, Франция.

### **Владелец регистрационного удостоверения**

УПСА САС,

3 рю Жозеф Монье, 92500 Рюэй-Мальмэзон, Франция.

*Наименование и адрес организации на территории Республики Казахстан, принимающей претензии (предложения) по качеству*

*лекарственного средства от потребителей, ответственный за  
пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного  
средства*

Представительство АО «Дельта Медикел Промоушнз АГ» (Швейцария),  
050040, г. Алматы, Бостандыкский район, ул. Байзакова, д. 280,

Тел./факс: +7 (727) 332 20 79.

Электронная почта: [PVG@deltamedical.com.ua](mailto:PVG@deltamedical.com.ua)