Ацсбирин



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, а также угнетает агрегацию тромбоцитов. Механизм действия связан с угнетением активности ЦОГ - основного фермента метаболизма арахидоновой кислоты, являющейся предшественником простагландинов, которые играют главную роль в патогенезе воспаления, боли и лихорадки. Снижение содержания простагландинов (преимущественно E_1) в центре терморегуляции приводит к снижению температуры тела вследствие расширения сосудов кожи и возрастания потоотделения. Анальгезирующий эффект обусловлен как центральным, так и периферическим действием. Уменьшает агрегацию, адгезию тромбоцитов и тромбообразование за счет подавления синтеза тромбоксана A_2 в тромбоцитах.

Снижает летальность и риск развития инфаркта миокарда при нестабильной стенокардии. Эффективен при первичной профилактике заболеваний сердечно-сосудистой системы и при вторичной профилактике инфаркта миокарда. В суточной дозе 6 г и более подавляет синтез протромбина в печени и увеличивает протромбиновое время. Повышает фибринолитическую активность плазмы и снижает концентрацию витамин К-зависимых факторов свертывания (II, VII, IX, X). Учащает геморрагические осложнения при проведении хирургических вмешательств, увеличивает риск развития кровотечения на фоне терапии антикоагулянтами. Стимулирует выведение мочевой кислоты (нарушает ее реабсорбцию в почечных канальцах), но в высоких дозах. Блокада ЦОГ-1 в слизистой оболочке желудка приводит к торможению гастропротекторных простагландинов, что может обусловить изъязвление слизистой оболочки и последующее кровотечение.

Фармакокинетика

При приеме внутрь быстро абсорбируется преимущественно из проксимального отдела тонкой кишки и в меньшей степени из желудка. Присутствие пищи в желудке значительно изменяет всасывание ацетилсалициловой кислоты.

Метаболизируется в печени путем гидролиза с образованием салициловой кислоты с последующей конъюгацией с глицином или глюкуронидом. Концентрация салицилатов в плазме крови вариабельна.

Около 80% салициловой кислоты связывается с белками плазмы крови. Салицилаты легко проникают во многие ткани и жидкости организма, в т.ч. в спинномозговую, перитонеальную и синовиальную жидкости. В небольших количествах салицилаты обнаруживаются в мозговой ткани, следы - в желчи, поте, кале. Быстро проникает через плацентарный барьер, в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

У новорожденных салицилаты могут вытеснять билирубин из связи с альбумином и способствовать развитию билирубиновой энцефалопатии.

Проникновение в полость сустава ускоряется при наличии гиперемии и отека и замедляется в пролиферативной фазе воспаления.

При возникновении ацидоза большая часть салицилата превращается в неионизированную кислоту, хорошо

проникающую в ткани, в т.ч. в мозг.

Выводится преимущественно путем активной секреции в канальцах почек в неизмененном виде (60%) и в виде метаболитов. Выведение неизмененного салицилата зависит от pH мочи (при подщелачивании мочи возрастает ионизирование салицилатов, ухудшается их реабсорбция и значительно увеличивается выведение). $T_{1/2}$ ацетилсалициловой кислоты составляет приблизительно 15 мин. $T_{1/2}$ салицилата при приеме в невысоких дозах составляет 2-3 ч, с увеличением дозы может возрастать до 15-30 ч. У новорожденных элиминация салицилата значительно более медленная, чем у взрослых.

Показания к применению:

Ревматизм, ревматоидный артрит, инфекционно-аллергический миокардит; лихорадка при инфекционно-воспалительных заболеваниях; болевой синдром слабой и средней интенсивности различного генеза (в т.ч. невралгия, миалгия, головная боль); профилактика тромбозов и эмболий; первичная и вторичная профилактика инфаркта миокарда; профилактика нарушений мозгового кровообращения по ишемическому типу.

В клинической иммунологии и аллергологии: в постепенно нарастающих дозах для продолжительной "аспириновой" десенситизации и формирования стойкой толерантности к НПВС у больных с "аспириновой" астмой и "аспириновой триадой".

Относится к болезням:

- Аллергия
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Головная боль
- Инфекции
- Лихорадка
- Миалгия
- Миокардит
- Нарушение мозгового кровообращения
- Невралгия
- Неврит
- Ревматоидный артрит
- Тромбоз

Противопоказания:

Эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в фазе обострения, желудочно-кишечное кровотечение, "аспириновая триада", наличие в анамнезе указаний на крапивницу, ринит, вызванные приемом ацетилсалициловой кислоты и других НПВС, гемофилия, геморрагический диатез, гипопротромбинемия, расслаивающая аневризма аорты, портальная гипертензия, дефицит витамина K, печеночная и/или почечная недостаточность, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, синдром Рейе, детский возраст (до 15 лет - риск развития синдрома Рейе у детей с гипертермией на фоне вирусных заболеваний), I и III триместры беременности, период лактации, повышенная чувствительность к ацетилсалициловой кислоте и другим салицилатам.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Для взрослых разовая доза варьирует от 40 мг до 1 г, суточная - от 150 мг до 8 г; кратность применения - 2-6 раз/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, анорексия, боли в эпигастрии, диарея; редко - возникновение эрозивно-язвенных поражений, кровотечений из ЖКТ, нарушение функции печени.

Со стороны ЦНС: при длительном применении возможны головокружение, головная боль, обратимые нарушения зрения, шум в ушах, асептический менингит.

Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения, анемия.

Со стороны системы свертывания крови: редко - геморрагический синдром, удлинение времени кровотечения.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение функции почек; при длительном применении - острая почечная недостаточность, нефротический синдром.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, отек Квинке, бронхоспазм, "аспириновая триада" (сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и лекарственных средств пиразолонового ряда).

Прочие: в отдельных случаях - синдром Рейе; при длительном применении - усиление симптомов хронической сердечной недостаточности.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказана к применению в I и III триместрах беременности. Во II триместре беременности возможен разовый прием по строгим показаниям.

Обладает тератогенным действием: при применении в I триместре приводит к развитию расщепления верхнего неба, в III триместре - вызывает торможение родовой деятельности (ингибирование синтеза простагландинов), преждевременное закрытие артериального протока у плода, гиперплазию легочных сосудов и гипертензию в малом круге кровообращения.

Ацетилсалициловая кислота выделяется с грудным молоком, что повышает риск возникновения кровотечений у ребенка вследствие нарушения функции тромбоцитов, поэтому не следует применять ацетилсалициловую кислоту у матери в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении антациды, содержащие магния и/или алюминия гидроксид, замедляют и уменьшают всасывание ацетилсалициловой кислоты.

При одновременном применении блокаторов кальциевых каналов, средств, ограничивающих поступление кальция или увеличивающих выведение кальция из организма, повышается риск развития кровотечений.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой усиливается действие гепарина и непрямых антикоагулянтов, гипогликемических средств производных сульфонилмочевины, инсулинов, метотрексата, фенитоина, вальпроевой кислоты.

При одновременном применении с ГКС повышается риск ульцерогенного действия и возникновения желудочно-кишечных кровотечений.

При одновременном применении снижается эффективность диуретиков (спиронолактона, фуросемида).

При одновременном применении других НПВС повышается риск развития побочных эффектов. Ацетилсалициловая кислота может уменьшать концентрации в плазме крови индометацина, пироксикама.

При одновременном применении с препаратами золота ацетилсалициловая кислота может индуцировать повреждение печени.

При одновременном применении снижается эффективность урикозурических средств (в т.ч. пробенецида, сульфинпиразона, бензбромарона).

При одновременном применении ацетилсалициловой кислоты и алендроната натрия возможно развитие тяжелого эзофагита.

При одновременном применении гризеофульвина возможно нарушение абсорбции ацетилсалициловой кислоты.

Описан случай спонтанного кровоизлияния в радужную оболочку при приеме экстракта гинкго билоба на фоне длительного применения ацетилсалициловой кислоты в дозе 325 мг/сут. Полагают, что это может быть обусловлено аддитивным ингибирующим действием на агрегацию тромбоцитов.

При одновременном применении дипиридамола возможно увеличение C_{max} салицилата в плазме крови и AUC.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой повышаются концентрации дигоксина, барбитуратов и солей лития в плазме крови.

При одновременном применении салицилатов в высоких дозах с ингибиторами карбоангидразы возможна интоксикация салицилатами.

Ацетилсалициловая кислота в дозах менее 300 мг/сут оказывает незначительное влияние на эффективность каптоприла и эналаприла. При применении ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах возможно уменьшение

эффективности каптоприла и эналаприла.

При одновременном применении кофеин повышает скорость всасывания, концентрацию в плазме крови и биодоступность ацетилсалициловой кислоты.

При одновременном применении метопролол может повышать C_{max} салицилата в плазме крови.

При применении пентазоцина на фоне длительного приема ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах имеется риск развития тяжелых побочных реакций со стороны почек.

При одновременном применении фенилбутазон уменьшает урикозурию, вызванную ацетилсалициловой кислотой.

При одновременном применении этанол может усиливать действие ацетилсалициловой кислоты на ЖКТ.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени и почек, при бронхиальной астме, эрозивно-язвенных поражениях и кровотечениях из ЖКТ в анамнезе, при повышенной кровоточивости или при одновременном проведении противосвертывающей терапии, декомпенсированной хронической сердечной недостаточности.

Ацетилсалициловая кислота даже в небольших дозах уменьшает выведение мочевой кислоты из организма, что может стать причиной острого приступа подагры у предрасположенных пациентов. При проведении длительной терапии и/или применении ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах требуется наблюдение врача и регулярный контроль уровня гемоглобина.

Применение ацетилсалициловой кислоты в качестве противовоспалительного средства в суточной дозе 5-8 г ограничено в связи с высокой вероятностью развития побочных эффектов со стороны ЖКТ.

Перед хирургическим вмешательством, для уменьшения кровоточивости в ходе операции и в послеоперационном периоде следует отменить прием салицилатов за 5-7 дней.

Во время продолжительной терапии необходимо проводить общий анализ крови и исследование кала на скрытую кровь.

Применение ацетилсалициловой кислоты в педиатрии противопоказано, поскольку в случае вирусной инфекции у детей под влиянием ацетилсалициловой кислоты повышается риск развития синдрома Рейе. Симптомами синдрома Рейе являются длительная рвота, острая энцефалопатия, увеличение печени.

Длительность лечения (без консультации с врачом) не должна превышать 7 дней при назначении в качестве анальгезирующего средства и более 3 дней в качестве жаропонижающего.

В период лечения пациент должен воздерживаться от употребления алкоголя.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: почечная недостаточность.

С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказание: печеночная недостаточность.

С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст (до 15 лет - риск развития синдрома Рейе у детей с гипертермией на фоне вирусных заболеваний)**.**

Источник: http://drugs.thead.ru/Acsbirin