

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

УПСАРИН УПСА 500 мг
(UPSARIN UPSA 500 mg)

Склад лікарського засобу:

діючі речовини: 1 таблетка містить ацетилсаліцилової кислоти 500 мг;

допоміжні речовини: натрію гідрокарбонат, кислота лимонна безводна, мононатрію цитрат безводний, натрію карбонат безводний, аспартам, повідон, кросповідон, ароматизатор апельсиновий.

Лікарська форма.

Таблетки шипучі.

Круглі білі таблетки зі скошеними краями та насічкою для поділу, швидко розчиняються у воді з шипучою реакцією.

Назва і місцезнаходження виробника.

“Брістол-Майєрс Сквібб”, Франція/ “Bristol-Myers Squibb”, France.

47000 Франція, м. Ажан, авеню Д-ра Жана Брю 304/ 47000 France, 304, Agen, avenue Dr. Jean Bru.

Фармакотерапевтична група.

Аналгетики і антипіретики. Код АТС N02BA01.

Має анальгезуючу, протизапальну, жарознижувальну, антиагрегатну дію. Ацетилсаліцилова кислота завдяки необоротному інгібуванню ферменту циклооксигенази (ЦОГ) гальмує біосинтез простагландинів. В осередку запалення зменшує проникність капілярів, знижує активність гіалуронідази, обмежує енергетичне забезпечення запального процесу шляхом гальмування утворення АТФ. Знижує збудження центрів терморегуляції і больової чутливості, зменшує альгогенну дію брадикініну. Крім того, ацетилсаліцилова кислота інгібує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування тромбоцитами синтезу тромбоксану А₂.

Препарат випускається у формі шипучих таблеток з буферними властивостями, що зменшує подразнювальну дію ацетилсаліцилової кислоти на слизову оболонку шлунково-кишкового тракту.

Шипучі розчинні таблетки препарату всмоктуються швидше, ніж звичайні таблетки. Максимальна концентрація ацетилсаліцилової кислоти в плазмі крові спостерігається через 15-40 хвилин після прийому. Біодоступність ацетилсаліцилової кислоти змінюється залежно від дози: вона становить приблизно 60% при прийомі менше 500 мг і 90% - при прийомі більше 1 г у зв'язку з насиченням процесу гідролізу у печінці. Ацетилсаліцилова кислота швидко гідролізується з утворенням саліцилової кислоти, яка також має фармакологічну активність. Ацетилсаліцилова кислота та саліцилова кислота швидко розподіляються по всіх тканинах організму. Ці кислоти проникають крізь плацентарний бар'єр, а також потрапляють у материнське молоко. Саліцилова кислота інтенсивно зв'язується з білками плазми (90%). Період напіввиведення з плазми ацетилсаліцилової кислоти становить 15-20 хвилин, а саліцилової кислоти – 2-4 години.

Ацетилсаліцилова кислота метаболізується головним чином у печінці і виводиться в основному із сечею у вигляді саліцилової, саліцилурової, гентесової кислот і глюкуронідів.

Показання для застосування.

- Симптоматичне лікування больового синдрому легкої або середньої тяжкості та/або підвищеної температури тіла.
- Хронічні запалення ревматичного характеру, гострі прояви ревматизму у дітей.
- Симптоматичне лікування ревматичних запалень у дорослих.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до ацетилсаліцилової кислоти або інших компонентів препарату;
- фенілкетонурія, оскільки препарат містить аспартам;
- бронхіальна астма, що зумовлена прийомом ацетилсаліцилової кислоти або іншими нестероїдними протизапальними засобами;
- останній триместр вагітності;
- загострення виразкової хвороби шлунка та 12-палої кишки;
- уроджені (гемофілія) або набуті геморагічні захворювання;
- підвищений ризик кровотеч;
- тяжка печінкова недостатність;
- тяжка ниркова недостатність;
- тяжка серцева недостатність, резистентна до лікування;
- одночасне застосування з метотрексатом у дозах понад 15 мг/тиждень;
- одночасне застосування високих доз препарату з непрямими антикоагулянтами, особливо при лікуванні ревматичних хвороб;
- дитячий вік (до 7 років).

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Для запобігання передозуванню слід переконатись, що інші препарати, які пацієнт застосовує, не містять ацетилсаліцилової кислоти.

Необхідно бути обережними, призначаючи препарат пацієнтам з наявністю в анамнезі виразки шлунка або 12-палої кишки, а також із шлунково-кишковими кровотечами; хворим на бронхіальну астму та з нирковою недостатністю.

Необхідно бути обережними, призначаючи препарат пацієнтам, які застосовують гіпоглікемічні засоби (потрібен регулярний контроль рівня цукру в крові), глюкокортикоїди, антигіпертензивні засоби, сечогінні препарати (необхідно забезпечити достатню гідратацію пацієнта і контроль функції нирок), антациди, які не всмоктуються і містять гідроксид магнію і/або алюмінію (їх необхідно приймати не раніше, ніж через 2 години після прийому препарату).

Пацієнтам, які знаходяться на безнатрієвій дієті, слід пам'ятати, що в кожній таблетці препарату міститься 388,5 мг натрію.

У дітей віком до 12 років з вірусними інфекціями (вітряна віспа, грипоподібні інфекції) при прийомі ацетилсаліцилової кислоти у поодиноких випадках може розвинути синдром Рейє, який є небезпечним для життя, тому ацетилсаліцилову кислоту повинен призначати дітям тільки лікар, коли інші засоби не є ефективними.

Особливі застереження.***Застосування у період вагітності або годування груддю.***

У I і II триместрах вагітності можливий разовий прийом препарату. У III триместрі препарат протипоказаний.

Ацетилсаліцилова кислота проникає у грудне молоко, тому застосовувати препарат під час годування груддю недоцільно.

Діти. Не застосовувати систематично як знеболювальний та антигіпертермічний засіб дітям з масою тіла менше 40 кг (молодше 12 років), при ревматичних захворюваннях – дітям за масою тіла менше 20 кг.

Періодичний прийом можливий у дітей з масою тіла починаючи від 20 кг (від 7 років).

Спосіб застосування та дози.

Таблетку розчиняють у склянці води безпосередньо перед застосуванням.

Симптоматичне лікування больового синдрому легкої або середньої тяжкості та/або підвищеної

температури тіла.

Призначають дорослим та дітям з масою тіла від 40 кг (старше 12 років).

Дорослим та дітям з масою тіла понад 50 кг (від 15 років та старше)

Максимальна добова доза 3 г, тобто 6 шипучих таблеток на день.

Зазвичай приймають 1 шипучу таблетку по 500 мг, при необхідності повторний прийом можливий через 4 години. У випадку більш інтенсивного болю або гіпертермії можливий прийом двох таблеток одночасно, але повторний прийом повинен бути не раніше 4 годин, при такому режимі дозування – приймати не більше 4 шипучих таблеток на день.

Дітям з масою тіла від 40 до 50 кг (від 12 до 15 років).

При призначенні дітям необхідно точно знати масу тіла дитини.

Рекомендована доза 60 мг/кг/день повинна бути поділена на 4 або 6 прийомів, тобто 15 мг/кг кожні 6 годин, або 10 мг/кг кожні 4 години.

Діти з масою від 40 до 50 кг (від 12 до 15 років) можуть приймати по 1 таблетці з повторним прийомом через 4 годин, але не більше 6 шипучих таблеток на день.

Систематичний прийом дозволить уникнути коливань температурної реакції.

Для дорослих рекомендований інтервал між прийомами повинен бути не менш 4 годин.

Для дітей (від 40 до 50 кг, тобто від 12 до 15 років) регулярний прийом може бути не більше 2 діб при застосуванні доз, що були згадані вище.

Періодичний прийом можливий у дітей з масою тіла починаючи від 20 кг (від 7 років) по ½ таблетці однократно.

Пацієнт повинен знати, що без консультації лікаря ацетилсаліцилову кислоту можна приймати не більше 3 днів для лікування гіпертермічної реакції та не більше 5 днів для лікування больового синдрому.

Ревматичні захворювання:

Застосування обмежується дорослими та дітьми з масою тіла від 20 кг та більше.

Дорослі: від 3 до 6 г максимально за добу у 3 або 4 прийоми з інтервалом не менше 4 годин.

Особам літнього віку дозу слід зменшити.

Діти: застосування обмежується масою тіла дитини - від 20 кг та більше: від 50 мг/кг до 100 мг/кг максимально за добу у 4 або 6 прийомів з інтервалом не менше 4 годин.

Передозування.

Існує ризик розвитку інтоксикації в осіб літнього віку і особливо у дітей молодшого віку (як при терапевтичному застосуванні, так і при випадковому прийомі). Тяжка інтоксикація може призвести до смерті.

Токсичність саліцилатів може бути результатом інтоксикації внаслідок тривалого застосування терапевтичних доз або гострої інтоксикації (при застосуванні >100 мг/кг/добу більше двох днів), що потенційно становить загрозу для життя.

Хронічне отруєння саліцилатами може проходити безсимптомно, або не має специфічних симптомів.

Інтоксикація саліцилатами середнього ступеня тяжкості, або саліцилізм, зазвичай розвивається лише після повторного застосування високих доз.

Симптоми: запаморочення, шум у вухах, глухота, пітливість, нудота, блювання, головний біль та пригнічення свідомості, можуть контролюватись шляхом зниження дози. Шум у вухах може виникати при плазмовій концентрації від 150 до 300 мкг/мл. Більш тяжкі побічні ефекти виникають при концентрації понад 300 мкг/мл.

Особливістю гострого отруєння є тяжке порушення кислотно-лужного балансу, яке може відрізнитися з віком та за тяжкістю інтоксикації.

Найрозповсюдженішою ознакою у дітей є метаболічний ацидоз. Тяжкість отруєння не можна оцінити, використовуючи лише дані плазмової концентрації. Всмокування ацетилсаліцилової кислоти може сповільнюватись внаслідок гальмування спорожнення шлунка, формування конкрементів у шлунку або внаслідок застосування препаратів, вкритих ентросолубтивною оболонкою. Невідкладна допомога

при отруєнні ацетилсаліциловою кислотою визначається ступенем тяжкості, стадією та клінічними симптомами, та відповідає стандартним методам надання невідкладної допомоги при отруєннях. Першочергові заходи мають бути спрямовані на прискорення виведення лікарського засобу, а також відновлення електролітного та кислотно-лужного балансу.

Внаслідок комплексних патофізіологічних ефектів отруєння саліцилатами можуть виникнути наступні симптоми та лабораторні зміни:

Симптоми

Інтотоксикація легкого та середнього ступеня тяжкості: тахіпное, гіпервентиляція, дихальний алкалоз, пітливість, нудота, блювання. Лабораторні дані: алкалоз, лужна реакція сечі.

Невідкладна допомога: промивання шлунка, повторне призначення активованого вугілля, форсований лужний діурез.

Тяжке отруєння: дихальний алкалоз з компенсаторним метаболічним ацидозом, гіперпірексія, відчуття шуму у вухах, глухота. Шум у вухах може виникати при плазмовій концентрації від 150 до 300 мкг/мл. Тяжчі побічні ефекти виникають при концентрації понад 300 мкг/мл.

Дихальна система: від гіпервентиляції, некардіогенного набряку легень до зупинки дихання та асфіксії, лабораторні дані – алкалоз, лужна реакція сечі.

Серцево-судинна система: від порушень серцевого ритму, артеріальної гіпотензії до зупинки серця. Втрата рідини та електролітів: дегідратація, олігурія, ниркова недостатність. Лабораторні дані – гіпокаліємія, гіпернатріємія, гіпонатріємія, порушення функції нирок.

Порушення обміну глюкози, кетоз лабораторно проявляється у вигляді гіперкаліємії гіпоглікемії (особливо у дітей), підвищення рівня кетонових тіл.

Шлунково-кишковий тракт: шлунково-кишкові кровотечі.

Зміни з боку системи крові: від пригнічення функції тромбоцитів до коагулопатій. Лабораторні дані – подовження протромбінового часу, гіпопротромбінемія.

Неврологічні: токсична енцефалопатія та пригнічення ЦНС - від млявості, пригнічення свідомості до коми та нападу судом.

Невідкладна допомога: промивання шлунка, повторне призначення активованого вугілля, форсований лужний діурез, гемодіаліз, в тяжких випадках інфузія рідини та електролітів.

Побічні ефекти.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти може стати причиною виникнення перфорація, транзиторне порушення функції печінки з підвищенням рівня трансаміназ, кровотечі під час та після операції, гематоми, уrogenітальні кровотечі, повідомлялось про важкі кровотечі, такі як шлунково-кишкові, черепно-мозкові крововиливи (особливо у хворих із неконтрольованою артеріальною гіпертензією та/або при супутньому застосуванні антигемостатичних засобів).

Кровотечі можуть призвести до гострої та хронічної постгеморагічної анемії, залізодефіцитної анемії (внаслідок, наприклад, прихованих мікрокровотеч) із відповідними лабораторними та клінічними ознаками та симптомами, такими як астения, блідість та гіпоперфузія.

При застосуванні ацетилсаліцилової кислоти можлива поява синдрому астми, легкі та середньої тяжкості реакції, що потенційно вражають шкіру, дихальну, серцево-судинну систему, шлунково-кишковий тракт, і проявляються у вигляді висипу, набряку, свербіжжю, некардіогенного набряку легень, і дуже рідко – тяжких реакцій, таких як анафілактичний шок, повідомлялось про запаморочення та шум в вухах, що може бути ознаками передозування.

Синдром Рейє: одною з ознак котрого є блювання, що не припиняється протягом тривалого часу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Ацетилсаліцилова кислота підвищує плазмову концентрацію дигоксину через зменшення виведення нирками, застосування високих доз ацетилсаліцилової кислоти підсилює дію гіпоглікемічних препаратів за рахунок її гіпоглікемічної дії та витіснення сульфонілсечовини із зв'язку з білками плазми крові, ацетилсаліцилова кислота підсилює дію деяких проти судомних препаратів, таких як вальпроєва кислота та фенітоїн; підсилює токсичність вальпроєвої кислоти внаслідок витіснення зі зв'язаного з

білками стану, при одночасному застосуванні з алкоголем підвищує пошкодження слизової оболонки шлунково-кишкового тракту із збільшує тривалість кровотечі внаслідок адитивного ефекту.

Ацетилсаліцилова кислота подібно іншим нестероїдним протизапальним препаратам, а також тіклопідіну, клопідогрелю, трофібану може оказувати антиагрегантну дію на тромбоцити.

Одночасне застосування різних препаратів що гальмують агрегацію тромбоцитів можуть підвищити ризик виникнення геморагічних явищ.

Одночасне застосування з гепарином або іншими антикоагулянтами потребує постійного спостереження за хворим.

Комбінації, що протипоказані.

Пероральні антикоагулянти. При прийомі ацетилсаліцилової кислоти в дозах понад 3 г/добу антикоагулянти витискаються із сполук з білками плазми.

Метотрексат у дозах понад 15 мг/тиждень. Підвищується мієлотоксична дія.

Небажані комбінації.

Пероральні антикоагулянти. Збільшення ризику кровотеч, необхідно контролювати показники згортання крові, і особливо тривалість кровотечі.

Інші нестероїдні протизапальні препарати. Збільшується ризик виникнення виразки шлунка та 12-палої кишки і шлунково-кишкових кровотеч.

Гепарин. Збільшується ризик кровотеч (інгібування функції тромбоцитів та ушкодження слизової оболонки шлунково-кишкового тракту).

Урикозуричні засоби (бензбромарон, пробенецид). Зниження урикозуричного ефекту за рахунок конкуренції за виведення сечової кислоти у ниркових канальцях.

Комбінації, що потребують застереження.

Антидіабетичні засоби (інсуліни). Посилення гіпоглікемічної дії.

Діуретики та інгібітори ангіотензинперетворюючого ферменту. При прийомі у великих дозах можливий розвиток гострої ниркової недостатності у хворих зі зневоднюванням (зниження клубочкової фільтрації через пригнічення синтезу простагландинів, крім того, знижується гіпотензивна дія).

Глюкокортикоїди (при системному застосуванні): зниження концентрації саліцилатів у крові під час лікування кортикостероїдами та ризик передозування саліцилатів після їх відміни (кортикостероїди посилюють виведення саліцилатів).

Метотрексат у дозах менше 15 мг/тиждень. Небезпека мієлотоксичності.

Комбінації, які слід враховувати.

Внутрішньоматкові засоби. Ризик зниження контрацептивного ефекту.

Шлунково-кишкові засоби місцевої дії: оксиди та гідроксиди магнію, алюмінію, солі кальцію. Підвищене виведення саліцилатів нирками за рахунок олужнення сечі.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Зберігати в сухому місці при температурі 15 - 25°C.

Упаковка.

По 4 таблетки у стрипі з алюмінієвої фольги; по 4 стрипи в картонній коробці.

Категорія відпуску.

Без рецепта.