

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ЛОСПИРИН®
(LOWSPIRIN®)

Склад:

діюча речовина: acetylsalicylic acid;

1 таблетка містить кислоти ацетилсаліцилової 75 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль прежелатинізований, кремнію діоксид колоїдний безводний, кислота стеаринова, Opadry Y-1-7000 білий, Acryl-Eze 93018359 білий.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою, кишковорозчинні.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою білого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Антитромботичні засоби.

Код АТХ В01А С06.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ацетилсаліцилова кислота пригнічує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування синтезу тромбосану А₂. Механізм її дії полягає у незворотній інактивації ферменту циклооксигенази (ЦОГ-1). Ацетилсаліцилова кислота також виявляє й інші інгібуючі ефекти на тромбоцити.

Ацетилсаліцилова кислота належить до групи нестероїдних протизапальних лікарських засобів (НПЗЗ) з анальгетичними, жарознижувальними і протизапальними властивостями.

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 у плазмі крові досягається через 10-20 хв, саліцилової кислоти – через 20-120 хв відповідно. Завдяки кишковорозчинній оболонці таблеток Лоспирину вивільнення активної речовини відбувається не у шлунку, а в лужному середовищі кишечника. Тому абсорбція ацетилсаліцилової кислоти уповільнюється до 3-6 годин після застосування таблетки, вкритої кишковорозчинною оболонкою, порівняно зі звичайною таблеткою ацетилсаліцилової кислоти.

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

Саліцилова кислота зазнає метаболізму переважно у печінці. Метаболітами саліцилової кислоти є саліцилсечова кислота, саліцилфенол глюкуроонід, саліцилацил глюкуроонід, 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 годин при застосуванні низьких доз до 15 годин – при застосуванні високих доз. Саліцилова кислота та її метаболіти виводяться з організму переважно нирками.

Клінічні характеристики.

Показання.

Для зниження ризику:

- летального наслідку пацієнтів з підозрою на гострий інфаркт міокарда;
- захворюваності і летального наслідку пацієнтів, які перенесли інфаркт міокарда;
- транзиторних ішемічних атак (ТІА) та інсульту у пацієнтів з ТІА;
- захворюваності і летального наслідку при стабільній і нестабільній стенокардії;

- інфаркту міокарда у пацієнтів з високим ризиком розвитку серцево-судинних ускладнень (цукровий діабет, контрольована артеріальна гіпертензія) та особам із багатофакторним ризиком серцево-судинних захворювань (гіперліпідемія, ожиріння, тютюнопаління, літній вік).

Для профілактики:

- тромбозів і емболій після операцій на судинах (черезшкірнатранслюмінарна катетерна ангіопластика (PTCA), ендартеректомія сонної артерії, аортокоронарне шунтування (CABG), артеріовенозне шунтування);
- тромбозу глибоких вен і емболії легеневої артерії після довготривалої іммобілізації (після хірургічних операцій);
- інсультів (у якості вторинної профілактики).

Протипоказання.

- Гіперчутливість до ацетилсаліцилової кислоти, до інших саліцилатів або до будь-якого компонента препарату.
- Астма, спричинена застосуванням саліцилатів або речовин з подібною дією, особливо НПЗЗ, в анамнезі.
- Гострі пептичні виразки.
- Геморагічний діатез.
- Ниркова недостатність тяжкого ступеня.
- Печінкова недостатність тяжкого ступеня.
- Серцева недостатність тяжкого ступеня.
- Комбінація з метотрексатом у дозуванні 15 мг/тиждень або більше (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Особливі заходи безпеки.

Лоспирин® застосовувати з обережністю у наступних ситуаціях:

- гіперчутливість до анагетичних, протизапальних, протиревматичних засобів, а також у разі наявності алергії на інші речовини;
- виразки шлунково-кишкового тракту, включаючи хронічні та рекурентні виразкові хвороби або шлунково-кишкові кровотечі в анамнезі;
- одночасне застосування антикоагулянтів;
- у пацієнтів з порушеннями функції нирок або хворих із порушеннями серцево-судинного кровообігу (наприклад, патологія судин нирки, застійна серцева недостатність, гіповолемія, обширні операції, сепсис або сильні кровотечі), оскільки ацетилсаліцилова кислота може також збільшити ризик порушення функції нирок та гострої ниркової недостатності;
- у пацієнтів із тяжкою недостатністю глюкозо-6-фосфатдегідрогенази ацетилсаліцилова кислота може спричинити гемоліз або гемолітичну анемію. Особливо при наявності факторів, які можуть збільшити ризик гемолізу, наприклад, високі дози препарату, гарячка або гострий інфекційний процес;
- порушення функції печінки.

Ібупрофен може зменшити інгібіторний ефект ацетилсаліцилової кислоти щодо агрегації тромбоцитів. У разі застосування Лоспирину перед початком прийому ібупрофену як знеболювального засобу пацієнт повинен проконсультуватися з лікарем.

Ацетилсаліцилова кислота може зумовлювати розвиток бронхоспазму або нападу бронхіальної астми або інші реакції підвищеної чутливості. Фактори ризику включають астму в анамнезі, сінову гарячку, поліпоз носа або хронічне респіраторне захворювання, алергічні реакції (наприклад, шкірні реакції, свербіж, кропив'янку) на інші речовини в анамнезі.

Через інгібіторний ефект ацетилсаліцилової кислоти щодо агрегації тромбоцитів, який зберігається упродовж кількох днів після прийому застосування препаратів, які містять ацетилсаліцилову кислоту, може підвищити імовірність/посилення кровотечі при хірургічних операціях (включаючи незначні хірургічні втручання, наприклад, видалення зуба). Тому за 5-7 днів до планової операції або екстракції зубів слід припинити застосування препарату.

При застосуванні малих доз ацетилсаліцилової кислоти може знижуватися виведення сечової кислоти. Це може призвести до нападу подагри у схильних до неї пацієнтів.

Не слід застосовувати препарати, які містять ацетилсаліцилову кислоту, дітям та підліткам із гострою респіраторною вірусною інфекцією (ГРВІ), яка супроводжується або не супроводжується підвищенням температури тіла, без консультації з лікарем. При деяких вірусних захворюваннях, особливо при 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 ацетилсаліцилову кислоту застосовувати як супутній лікарський засіб, проте причинно-наслідковий зв'язок у цьому випадку не доведений. Якщо вказані стани супроводжуються постійним блюванням, це може бути проявом синдрому Рея.

При одночасному застосуванні ацетилсаліцилової кислоти та алкоголю підвищується ризик уражень слизової оболонки органів шлунково-кишкового тракту і подовження часу кровотечі.

Застосування препарату у високих дозах спричиняє гіпоглікемічний ефект, що необхідно брати до уваги при призначенні його пацієнтам з цукровим діабетом.

При тривалому застосуванні препарату у високих дозах необхідний регулярний гематологічний контроль (рівень гемоглобіну і показників системи згортання).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Протипоказання для одночасного застосування.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти та 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 ацетилсаліцилової кислоти та метотрексату у дозах менш ніж 15мг/тиждень підвищується гематологічна токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми крові).

Одночасне застосування ацетилсаліцилової кислоти з ібупрофеном перешкоджає незворотному інгібуванню тромбоцитів ацетилсаліциловою кислотою. Лікування ібупрофеном пацієнтів з ризиком кардіоваскулярних захворювань може обмежувати кардіопротекторну дію ацетилсаліцилової кислоти.

При одночасному застосуванні Лоспірину та антикоагулянтів, тромболітиків/інших інгібіторів агрегації тромбоцитів/гемостазу підвищується ризик кровотечі.

При одночасному застосуванні високих доз саліцилатів із НПЗЗ (через взаємопосилувальний ефект) підвищується ризик виникнення виразок і шлунково-кишкових кровотеч.

При застосуванні із селективними інгібіторами зворотного захоплення серотоніну підвищується ризик розвитку шлунково-кишкової кровотечі внаслідок можливого ефекту синергізму.

При одночасному застосуванні з дигоксином концентрація останнього у плазмі крові підвищується внаслідок зниження ниркової екскреції.

При одночасному застосуванні високих доз ацетилсаліцилової кислоти та антидіабетичних препаратів із групи похідних сульфонілсечовини посилюється гіпоглікемічний ефект останніх за рахунок витіснення сульфонілсечовини, зв'язаної з протеїнами плазми крові, ацетилсаліциловою кислотою.

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

Системні глюкокортикостероїди (виключаючи гідрокортизон, який застосовують для замісної терапії при хворобі Аддісона) знижують рівень саліцилатів у крові та підвищують ризик передозування після закінчення лікування.

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

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

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

Одночасне застосування з урикозуричними засобами, такими як бензобромарон, пробенецид, знижує ефект виведення сечової кислоти (внаслідок конкуренції виведення сечової кислоти нирковими каналцями).

Особливості застосування.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Пригнічення синтезу простагландинів може негативно вплинути на вагітність та/або ембріональний/внутрішньоутробний розвиток. Наявні дані епідеміологічних досліджень вказують на ризик викидня та вад розвитку плода після застосування інгібіторів синтезу простагландинів на початку вагітності. Ризик підвищується залежно від збільшення дозита тривалості терапії. Згідно з наявними даними зв'язок між прийомом ацетилсаліцилової кислоти і підвищеним ризиком викидня не підтверджено.

Наявні епідеміологічні дані щодо виникнення вад розвитку не є послідовними, проте підвищений ризик гастрошизису не може бути виключений при застосуванні ацетилсаліцилової кислоти. Результати проспективного дослідження впливу у ранній термін вагітності (1-4-й місяць) з участю приблизно 14800 пар жінка-дитина не вказують на будь-який зв'язок із підвищеним ризиком розвитку мальформацій.

Дослідження на тваринах вказують на репродуктивну токсичність.

Під час I і II триместру вагітності препарати, що містять ацетилсаліцилову кислоту, не слід призначати без чіткої клінічної необхідності. У жінок, які, імовірно, можуть бути вагітними або під час I і II триместру вагітності доза препаратів, які містять ацетилсаліцилову кислоту, повинна бути якомога нижчою, а тривалість лікування – якомога коротшою.

Під час III триместру вагітності всі інгібітори синтезу простагландинів можуть впливати наплід наступним чином:

- ☐ серцево-легенева токсичність (із передчасним закриттям артеріальної протоки і легеневою гіпертензією);
- ☐ порушення функції нирок з можливим наступним розвитком ниркової недостатності з олігогідроамніозом;

на жінку і дитину в кінці вагітності інгібітори синтезу простагландинів можуть впливати наступним чином:

- можливість подовження часу кровотечі, антиагрегантний ефект, який може виникнути навіть після дуже низьких доз;
- ☐ гальмування скорочень матки, що може призвести до затримки або подовження тривалості пологів.

Зважаючи на це, ацетилсаліцилова кислота протипоказана під час III триместру вагітності.

Саліцилати і їх метаболіти проникають у грудне молоко в невеликих кількостях.

Оскільки не було виявлено шкідливого впливу препарату на дитину після його прийому жінками, переривати годування груддю, як правило, не потрібно. Однак у випадках регулярного застосування або при застосуванні високих доз годування груддю необхідно припинити на ранніх етапах.

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

Не відзначалося впливу на здатність керувати автомобілем та іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймати внутрішньо, за 30-60 хвилин до їди, не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини.

Для зниження ризику летального наслідку у пацієнтів із підозрою на гострий інфаркт міокарда застосовувати препарат у дозі 75-300 мг на добу. Упродовж 30 днів після інфаркту продовжувати приймати підтримуючу дозу 75-300 мг на добу. Через 30 днів слід розглянути питання про подальшу профілактику рецидиву інфаркту міокарда.

Для зниження ризику захворюваності і летального наслідку у пацієнтів, які перенесли інфаркт міокарда, застосовувати 75-300 мг на добу.

Для вторинної профілактики інсульту застосовувати препарат у дозі 75-300 мг на добу.

Для зниження ризику ТІА та інсульту у пацієнтів з ТІА застосовувати 75-300 мг на добу.

Для зниження ризику розвитку захворювання і летального наслідку у пацієнтів зі стабільною і нестабільною стенокардією: 75-300 мг на добу.

Для профілактики тромбоемболій після операцій на судинах (черезшкірна транслюмінарна катетерна ангіопластика (PTCA), ендартеректомія сонної артерії, аортокоронарне шунтування (CABG), артеріовенозне шунтування) застосовувати препарат в дозі 75-150 мг на добу кожного дня або 300 мг на добу через день.

Для профілактики тромбозу глибоких вен і емболії легеневої артерії після довготривалого стану іммобілізації (після хірургічних операцій) – 75-150 мг на добу або 300 мг на добу через день.

Для профілактики інфаркту міокарда у пацієнтів з високим ризиком розвитку серцево-судинних ускладнень (цукровий діабет, контрольована артеріальна гіпертензія) та особам із багатфакторним ризиком серцево-судинних захворювань (гіперліпідемія, ожиріння, тютюнопаління, літній вік) застосовувати 75 мг на добу або 300 мг на добу через день.

Діти.

Згідно з показаннями (див. розділ «Показання») препарат Лоспирин® не застосовувати дітям.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти дітям віком до 16 років може спричинити тяжкі побічні ефекти (у тому числі синдром Рея, одною з ознак якого є постійне блювання). Прохання ознайомитися з інформацією, викладеною у розділі «Особливі заходи безпеки»

Передозування.

Токсична дія саліцилатів можлива внаслідок хронічної інтоксикації, що виникла внаслідок тривалої терапії (застосування понад 100 мг/кг/добу більше 2 днів може спричинити токсичні ефекти), внаслідок гострої інтоксикації, яка несе загрозу життю (передозування), і причиною якої може 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 у 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 відрізнятися залежно від віку і тяжкості інтоксикації. Найчастішим його проявом у 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 в разі прийому препарату у формі таблеток, вкритих кишково-розчинною оболонкою.

Лікування.

Лікування гострої інтоксикації, спричиненої передозуванням ацетилсаліцилової кислоти, визначається ступенем тяжкості, клінічними симптомами і забезпечується стандартними методами, які застосовують при отруєнні. Усі застосовані заходи повинні бути спрямовані на прискорення видалення препарату та відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу.

Через комплексні патофізіологічні ефекти отруєння саліцилатами прояви і симптоми/результати аналізів можуть включати:

Прояви і симптоми	Результати аналізів	Терапевтичні заходи
Інтоксикація легкого або середнього ступеня		Промивання шлунка, повторне введення активованого вугілля, форсований лужний діурез
Тахіпное, гіпервентиляція, респіраторний алкалоз	Алкалемія, алкалурія	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Діафорез (посилене потовиділення)		
Нудота, блювання		

Інтоксикація середнього або тяжкого ступеня		Промивання шлунка, повторне введення активованого вугілля, форсований лужний діурез, гемодіаліз у тяжких випадках
Респіраторний алкалоз із компенсаторним метаболічним ацидозом	Ацидемія, ацидурія	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Гіперпірексія		Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Респіраторні: гіпервентиляція, некардіогенний набряк легенів, дихальна недостатність, асфіксія		
Серцево-судинні: дизаритмії, артеріальна гіпотензія, серцево-судинна недостатність	Наприклад, зміни артеріального тиску, ЕКГ	
Втрата рідини та електролітів: дегідратація, олігурія, ниркова недостатність	Наприклад, гіпокаліємія, гіпернатріємія, гіпонатріємія, зміни ниркової функції	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Порушення метаболізму глюкози, кетоацидоз	Гіперглікемія, гіпоглікемія (особливо у дітей). Підвищений рівень кетонових тіл	
Дзвін у вухах, глухота		
Шлунково-кишкові: кровотеча у ШКТ		
Гематологічні: інгібування тромбоцитів, коагулопатія	Наприклад, пролонгація РТ, гіпопротромбінемія	
Неврологічні: токсична енцефалопатія та пригнічення ЦНС з такими проявами як летаргія, сплутаність свідомості, кома і судоми		

епігастральні ділянки, абдомінальна біль, нудота, блювання, діарея, печія, анорексія, запалення шлунково-кишкового тракту, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, які можуть у поодиноких випадках спричинити шлунково-кишкові геморагії і перфорації з відповідними лабораторними показниками та клінічними проявами. З боку судинної системи: кровотечі (інтраопераційні, геморагії, гематоми, кровотечі з органів сечостатевої системи, носові кровотечі, кровотечі з ясен, геморагії шлунково-кишкового тракту, кровотечі у мозок (особливо у пацієнтів з неконтрольованою гіпертензією та /або при одночасному застосуванні антикоагулянтів) з відповідними клінічними симптомами, у тому числі: астенія, блідість шкірного покриву, гіпоперфузія.

З боку системи крові: тромбоцитопенія, анемія (постгеморагічна/залізодефіцитна) з відповідними лабораторними показниками та клінічними проявами; гемоліз та гемолітична анемія (у пацієнтів з тяжкими формами недостатності глюкозо-6-фосфат-дегідрогенази).

З боку імунної системи: реакції підвищеної чутливості з відповідними лабораторними та клінічними проявами включають астматичний стан, шкірні реакції легкого або середнього ступеня, а також з боку дихальної системи, шлунково-кишкового тракту та серцево-судинної системи, включаючи такі симптоми як висипання, кропив'янка, набряк, свербіж, риніт, закладення носа, серцево-дихальна недостатність і дуже рідко – тяжкі реакції, включаючи анафілактичний шок.

З боку нирок та сечовивідних шляхів: порушення функції нирок, гостра ниркова недостатність.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, порушення орієнтації.

З боку органів слуху: порушення слуху, дзвін у вухах (тинітус).

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: транзиторна печінкова недостатність, підвищення рівня трансаміназ печінки.

Метаболічні порушення: гіперурикемія з відповідними лабораторними показниками та клінічними проявами (напади подагри).

Термін придатності.

4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у стрипі; по 3 або 10 стрипів у картонній упаковці.

По 30 таблеток у стрипі; по 1 або 4 стрипи у картонній упаковці.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

ТОВ «КУСУМ ФАРМ».

Місцезнаходження.

Україна, 40020, м. Суми, вул. Скрябіна, 54.