

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име на лекарствения продукт

Aspirin Direkt

Аспирин Директ

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-5573/02.02.0	
619/09.04.2008	<i>[Signature]</i>

2. Количествен и качествен състав

Една таблетка съдържа 500 mg acetylsalicylic acid.

3. Лекарствена форма

Таблетка за дъвчене.

4. Клинични данни

4.1 Показания

Лека до умерена болка, напр. главоболие, зъбобол, мускулоскелетна болка, менструална болка; повишена температура.

4.2 Дозировка и начин на приложение

4.2.1 Дозировка

Възрастни:

500 – 1000 mg като еднократна доза (което съответства на 1 – 2 таблетки за дъвчене), която може да се повтори на интервали от 4 – 8 часа. Максимална дневна доза от 4 g не трябва да се превишава.

Деца над 12 години:

500 mg като еднократна доза, съответства на 1 таблетка за дъвчене. Ако е необходимо еднократната доза може да се повтори до 3 пъти дневно на интервали от 4-8 часа.

4.3 Противопоказания

Aspirin Direkt не трябва да се използва при деца под 12 годишна възраст, освен по изрично лекарско предписание.



Aspirin Direkt не трябва да се използва при следните обстоятелства:

- известна свръхчувствителност към лекарственото вещество acetylsalicylic acid или други салицилати;
- при наличие на хеморагична диатеза;
- при наличие на стомашна или дуоденална язва;
- последния триместър на бременността.

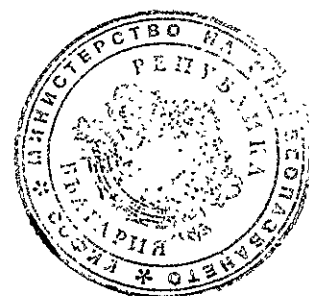
4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Aspirin Direkt може да се използва при следните обстоятелства само след строга преценка на отношението полза/риск:

- първи и втори триместър на бременността;
- по време на кърмене;
- свръхчувствителност към противовъзпалителни или противоревматични лекарства и други алергени;
- при едновременно лечение с антикоагуланти (напр. кумаринови деривати или хепарин – с изключение на лечение с хепарин с ниски дози);
- при наличие на тежко чернодробно или бъбречно увреждане;
- при пациенти с анамнестични данни за стомашно-чревни нарушения.

Лекарствените продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина трябва да се използват при деца и подрастващи с фебрилни заболявания само след внимателна оценка на отношението риск/полза поради възможността от развитие на синдром на Рей (Reye's syndrom), който е рядко, но сериозно заболяване. Синдром на Рей е възможно да се наблюдава при употреба на продукта при деца под 12 годишна възраст и се изразява в грипоподобна симптоматика, ангиоедема и тежки чернодробни увреждания.

Пациенти с бронхиална астма, хронично бронхо-спастично (обструктивно) дихателно заболяване, сенна треска, или оток на носната лигавица (назални полипи) могат да реагират на нестероидните аналгетици с астматични пристъпи, локализиран оток на кожата или лигавицата (Quincke's oedema) или уртикария по-често в сравнение с другите пациенти.



Хирургичните пациенти трябва да се консутират с лекуващите лекари по отношение употребата на Aspirin Direkt.

Продуктът съдържа натрий, който може да е вреден за пациенти на безсолна диета.

4.5 Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействия

Ефектите на следните лекарства са засилени:

- действието на антикоагуланти,
- ефектите на нестероидните противовъзпалителни лекарства,
- действието на сулфонилурей,
- ефектите на метотрексат,
- плазмените концентрации на дигоксин,
- ефектите на сулфонамиди и неговите комбинации,
- ефектите на валпроевата киселина.
- Ацетилсалициловата киселина може да повиши риска от стомашно-чревен кръвоизлив когато се приема едновременно с кортикостероиди или алкохол.

Ефектите на следните лекарства са намалени:

- антагонисти на алдостерона и бримкови диуретици,
- антихипертензивни,
- урикозурични лекарства.

Дори с ниски дози, ацетилсалициловата киселина намалява екскрецията на пикочна киселина. Това може да повлияе подагратата при пациенти, които вече имат по-ниска екскреция на пикочна киселина.

4.6 Бременност и кърмене

Употребата на салицилати през първите 3 месеца на бременността е свързана според няколко епидемиологични проучвания с повишен риск от малформации (вродена цепка на небцето, сърдечни малформации). Този риск вероятно е нисък след приложение на нормални терапевтични дози, проспективно проучване на около 32 000 двойки майка-дете не е установило никаква връзка на употребата на лекарството и повишена честота на малформации.



Салицилатите трябва да се приемат по време на бременност само след строга оценка на отношението риск/полза.

Приложението на салицилати във високи дози през последните 3-месеца на бременността ($> 300 \text{ mg/d}$) може да доведе до удължаване на бременността, преждевременно затваряне на артериалния проток и потискане на маточните контракции. Наблюдавана е повишена склонност към кръвоизливи при майката и детето.

Приложението на ацетилсалицилова киселина във високи дози ($> 300 \text{ mg/d}$) непосредствено преди раждане може да доведе до вътречерепни кръвоизливи, особено при недоносени новородени.

Салицилатите преминават в кърмата в малки количества. Тъй като до сега не са наблюдавани нежелани реакции при деца след инцидентна употреба, обикновено не е необходимо прекъсване на кърменето. Обаче при редовно използване на високи дози ($> 300 \text{ mg/d}$) кърменето трябва да бъде прекъснато рано, тъй като не могат да бъдат изключени рисковете, дължащи се на недостатъчна детоксикация на новороденото.

4.7 Влияния върху способността за шофиране и използването на машини

Няма.

4.8 Нежелани реакции

Нежеланите реакции, които се явяват често са стомашно-чревни нарушения като напр. гадене, диария, повръщане и леки стомашно-чревни кръвотечения, които в изключителни случаи могат да доведат до анемия. Рядко могат да се образуват стомашно-чревните язви при определени обстоятелства с кръвотечение и перфорация.

В редки случаи могат да се появят реакции на свръхчувствителност (напр. пристъпи от задух, кожни ерупции).

Описани са изолирани случаи на чернодробни (повишени трансаминази) и бъбречни функционални нарушения, хипогликемия и тежки кожни реакции.

Световъртеж и шум в ушите могат да се появят като симптоми на предозиране, специално при деца и пациенти в напреднала възраст.



Ацетилсалициловата киселина може да се свърже с повишен риск от кръвоизлив поради ефекта върху тромбоцитната агрегация.

4.9 Предозиране

Бързата медицинска помощ е критична за възрастните както и децата дори ако не се забелязват никакви белези или симптоми.

Има разлика между хроничното предозиране с нарушения предимно върху централната нервна система (“салицилизъм”) и острата интоксикация, главната характеристика на която е тежко нарушение на алкално-киселинното равновесие. Допълнително към нарушенията на алкално-киселинното равновесие, електролитния баланс (напр. загуба на калий), хипогликемия, кожни ерупции, стомашно-чревен кръвоизлив, симптомите могат да включват хипервентилация, шум в ушите, гадене, повръщане, увреждане на зрението и слуха, главоболие, световъртеж и обърканост.

При тежка интоксикация може да се появи делириум, тремор, задух, изпотяване, загуба на течности, хипертермия и кома.

При интоксикации с летален изход смъртта настъпва вследствие на дихателна недостатъчност.

Използваните методи за лечение на интоксикация с ацетилсалицилова киселина зависят от степента, етапа и клиничните симптоми на интоксикацията. Те съответстват на обичайните мерки за намаляване на абсорбцията на лекарственото вещество: ускоряване на екскрецията и мониториране на водния и електролитен баланс, увредената температурна регулация и дишане.

5. Фармакологични данни

5.1 Фармакодинамични свойства

Като салицилат ацетилсалициловата киселина принадлежи към групата на нестероидните аналгетици/противовъзпалителни. Като естер на салициловата киселина, ацетилсалициловата киселина е субстанция с аналгетични, антипиретични и противовъзпалителни свойства. Действието на активната съставка обхваща инхибиране на циклооксигеназата и следователно инхибиране синтеза на простагландин E2, простагландин I2 и тромбоксан A2.



Ацетилсалициловата киселина има изразен инхибиторен ефект върху тромбоцитната агрегация. Необратимата циклооксигеназна инхибиция е особено изразена при тромбоцитите, тъй като те не могат да ресинтезират този ензим. Счита се, че ацетилсалициловата киселина притежава и други инхибиторни ефекти върху тромбоцитите.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбцията на ацетилсалициловата киселина се извършва бързо и напълно след перорално приложение в зависимост от лекарствената форма. След прием на бързо освобождаващи се форми максималните плазмени концентрации се достигат след 0,3 – 2 часа (общ салицилат).

Ацетилсалициловата киселина се превръща в основния метаболит салицилова киселина по време и след абсорбцията. Ацетиловата група на ацетилсалициловата киселина започва да се разгражда хидролитично още по време на преминаването през стомашно-чревната лигавица, но този процес основно протича в черния дроб.

Плазменото свързване с протеин при хора е зависимо от концентрацията, установени са стойности от 66 – 98% (салицилова киселина).

След приложение на високи дози, ацетилсалицилова киселина се установява в церебрална, спинална и синовиална течност. Салициловата киселина преминава през плацентата и в кърмата.

Кинетиката на елиминиране на салициловата киселина е зависима от дозата тъй като метаболизмът е ограничен от капацитета на чернодробните ензими. Времето на полуетиминиране варира между 2 до 3 часа след ниски дози, достига до около 12 часа след обичайните аналгетични дози.

Главните метаболити са глицинов конюгат на салициловата киселина (салицилпикочна киселина), етерни и естерни глюкурониди на салициловата киселина (салицилфенол глюкуронид и салицилацетил глюкуронид), и гентизинова киселина и нейния глицинов конюгат. Салициловата киселина и нейните метаболити се екскретират предимно чрез бъбреците.

5.3 Предклинични данни за безопасност



а) Остра токсичност

Еднократният прием на дози > 10 g ацетилсалицилова киселина при възрастни и > 4 g при деца може да е летален. Смъртта обикновено настъпва в резултат на дихателна недостатъчност.

Плазмени концентрации от 300 – 350 mcg салицилова киселина/ml могат да доведат до токсични симптоми и концентрации от около 400 – 500 mcg салицилова киселина/ml може да доведе до коматозно-летални състояния.

б) Хронична токсичност

Ацетилсалициловата киселина и нейния метаболит салицилова киселина имат локално дразнещо действие върху лигавиците.

Ако има язви в стомашно-чревния тракт, повишената тенденция от кръвотечение създава риск от сериозно кръвотечение. Допълнително към тези нежелани реакции е установено увреждане на бъбреците при проучвания върху животни след остро или хронично приложение на високи дози.

в) мутагенен и туморогенен потенциал

Ацетилсалициловата киселина е изследвана за мутагенност и канцерогенност; не са установени доказателства за мутагенен или канцерогенен потенциал.

г) репродуктивна токсичност

Установено е, че салицилатите притежават тератогенни ефекти при много животински видове. Има съобщения за нарушения в имплантирането, ембриотоксични и фетотоксични ефекти и нарушения в запаметяващия капацитет на потомството след прием по време на бременността.

За данните от приложението при хора моля отнесете се към т. 4.6 Бременност и кърмене.

6 Фармацевтични данни

6.1 Помощни вещества

calcium stearat, maize starch, mannitol, жълта боя S (E110), aspartame, ascorbic acid, citric acid anhydrous, magnesium carbonate, mandarine juice flavour, orange



flavour, sodium аспартам, източник на фенилаланин, аскорбинова киселина, лимонена киселина, магнезиев карбонат, предварително желатинизирано нишесте, есенция от мандарина, портокалова есенция, натриев карбонат, натриева хидроксиметил целулоза, специална есенция, алуминиев оксид, хидратен

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия за съхранение

Да се съхранява при температура не по-висока от 30 °С.

6.5 Данни за опаковката

10 таблетки

6.6 Препоръки при употреба

Таблетките трябва да се дъвчат.

Да се съхраняват на места, недостъпни за деца.

7. Производител, притежател на разрешението за употреба

Bayer AG Leverkusen, Germany

8. Дата на първото разрешение за употреба

9600083 / 17.04.96

9. Дата на последната редакция на текста

юли 2000

