



## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. **ИМЕ НА ПРОДУКТА** ASPIREX tabl. 325 mg  
(АСПИРЕКС табл. 325 мг)

2. **КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ НА АКТИВНО  
ДЕЙСТВАЩАТА СЪСТАВКА**

Всяка таблетка аспирекс съдържа като активна съставка 325 мг acetylsalicylic acid.

3. **ФАРМАЦЕВТИЧНА ФОРМА**  
Таблетки

4. **КЛИНИЧНИ ДАННИ**

4.1. Терапевтични индикации

- слаба и средно силно изразена болка (мускулна, зъбобол)
- главоболие и мигрена
- ревматоидни артрити
- болка при менструация
- повишена температура при простуда и грип

4.2. Дозиране и начин на приложение

Аспирекс се приема след разтваряне в чаша вода.

4.2.1. Възрастни и деца над 12 години

- **Като аналгетик или антипиретик:** препоръчаната доза при възрастни и деца над 12 години е 1 – 2 таблетки през 4 – 6 часа; максимум 12 таблетки дневно.
- **Като противовъзпалително средство:** – препоръчаната доза е 1 – 3 таблетки през 4 – 6 часа; максимум 16 таблетки дневно.
- **Ревматоиден артрит и ревматоидна треска:** – препоръчаната доза е 2 – 3 таблетки през 4 – 6 часа дневно; максимум 18 таблетки дневно.

4.2.2. Деца до 12 години

**Използването на аспирекс трябва да се избягва при деца под 12 години при повишена температура и вирусни заболявания, поради опасност от синдрома на Рей.**

Аспирекс се използва при деца от 6 до 12 години само при лечение на хронични заболявания, като ювенилен хроничен артрит, болест на Кавасаки или други състояния при които ползата надхвърля риска. Препоръчаната доза е 60

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № К-5525/02.02.02	
619/09.04.02	





мг/кг/дневно разделена в еднакви дози през 6 – 8 часа, максималната дневна доза е 100 мг/кг/дневно.

#### **4.2.3. Старческа възраст**

Дозата трябва да се намали при пациенти в старческа възраст.

#### **4.2.4. Дозиране при бъбречна недостатъчност**

Дозата трябва да се намали при пациенти с бъбречна недостатъчност. При пациенти с гломерулна филтрация под 10 мл/мин, Аспирекс не бива да се прилага.

#### **4.2.5. Дозиране при чернодробна недостатъчност**

Аспирекс не бива да се прилага при тежка чернодробна недостатъчност.

#### **4.2.6. Дозиране при диализа**

След хемодиализа се препоръчва приемането на допълнителна доза.

### **4.3. Противопоказания**

1. Свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина
2. Диспепсия, пептична язва
3. Астма, назални полипи, ринити, уртикария
4. Заболявания свързани с намалено кръвосъсирване, хемофилия, тромбоцитопения
5. Подагра
6. Бъбречна недостатъчност
7. Чернодробна недостатъчност
8. Бременност и лактация
9. Дефицит на глюкозо-6-фосфат дехидрогеназата

### **3.1. Специални предупреждения**

⇒ Аспирекс не бива да се приема от деца под 12 год. И подрастващи при варицела и други вирусни заболявания поради опасност от синдрома на Рей. Аспирекс може да се дава на деца под 12 год. само по изрично предписание на лекар;

⇒ пациенти с астма или назални полипи са податливи към развитието на реакции на свръхчувствителност;

⇒ да се използва с внимание при алкохолизъм, чернодробна и бъбречна дисфункция, анемия и други заболявания на хемopoетичната система. Пациентите





трябва да бъдат предупреждавани за повишаване риска от нежелани ефекти ако приемат по 75 мл алкохолни концентрати дневно и аспирекс.

⇒ аспирекс трябва да се използва с внимание при дехидратирани пациенти и при неконтролирана хипертония. Аспирекс, както и останалите НСПВ лекарствени продукти, когато се използват във високи дози могат да намалят ефекта на антихипертензивните лекарства;

⇒ високи дози аспирекс може да предизвика хемолитична анемия при пациенти с глюкозо-6-фосфат дехидрогеназен дефицит;

⇒ дефицит на витамин К;

⇒ аспирекс може да повлияе ефекта на инсулин и глюкагон при лечение на диабет;

⇒ Аспирекс не бива да се приема една седмица преди и след хирургична интервенция

### 3.2. Взаимодействия с други медицински продукти или други форми на взаимодействия

Салицилатите се свързват във висок процент с плазмените протеини и могат да бъдат изместени от редица лекарства от местата на свързване с плазмените протеини, което води до повишаване ефекта и риск от токсичност.

**Acetazolamide и Ammonium chloride:** повишаване салицилатната интоксикация.

**Антиагреганти, пеницилини, дипиридамол, валпроена киселина, тромболитици, хепарин:** повишен риск от хеморагии.

**Алкохол, други НСПВ и кортикостероиди** повишават ефекта на ацетилсалициловата киселина върху стомашно-чревния тракт, което може да доведе до повишен риск от нежелани ефекти, улцерация и кървене.





**Антикоагуланти:** ацетилсалициловата киселина повишава ефектите на кумариновите антикоагуланти.

**Антидиабетни:** повишава ефектите на оралните сулфонилурейни антидиабетни лекарства; наложително е да се коригира дозата и да се мониторира нивата на кръвната захар.

**Кортикостероиди:** ацетилсалициловата киселина се елиминира по-бързо при едновременно прилагане с кортикостероиди; дозата трябва да се мониторира.

**Метотрексат:** повишава се токсичността на метотрексат при едновременно прилагане с ацетилсалицилова киселина.

**Пробенцид, Сулфинпиразон:** ацетилсалицилова киселина намалява ефектите на урикозуричните лекарства.

**Спиринолактон:** ацетилсалицилова киселина намалява фармакологичната активност на спиринолактон.

**Зидовудин:** намалява се чернодробния клирънс на зидовудин и се повишава риска от токсичност; не се препоръчва едновременното приемане на аспирекс и зидовудин.

**Повлиаване на лабораторни показатели. Фалшиви резултати могат да се наблюдават при следните показатели:** амилаза, AST, ALT, пикочна киселина, PBI, пикочна VMA (повечето тестове), катехоламини, глюкоза в урината (Benedict's, Clinitest), CO<sub>2</sub> съдържание, глюкоза (на гладно), калий, нива на тромбоцитите и тироидните тестове.

### 3.3. Бременност и кърмене

#### Бременност

Ацетилсалицилова киселина е класифицирана в категория C/ D.

На продуктите съдържащи ацетилсалицилова киселина трябва да има следния надпис:

- 4 -





*“Изключително важно е да не се приема ацетилсалицилова киселина през третото тримесечие на бременността, освен ако не е изрично предписано от лекар, поради нежелани ефекти върху плода и усложнено протичане на раждането.”*

#### Бременност

При експерименти с животни е установен тератогенен ефект, който не е потвърден при хора. Хроничното използване на високи дози може да доведе до нежелани ефекти. Високи дози ацетилсалицилова киселина могат да доведат до преждевременно затваряне на дуктус артеиозус у плода, развитие на артериална хипертония и ядрен иктер у новороденото.

При използване на ацетилсалицилова киселина дори в ниски дози близо до термина на раждане се повишава риска от хеморагии. Не трябва да се използва Аспирекс през третото тримесечие на бременността. През първото и второто тримесечие на бременността трябва да се избягва хроничното използване на Аспирекс, особено в дози надвишаващи обичайните терапевтични дози.

#### Кърмене

Ацетилсалициловата киселина се отделя в майчиното мляко. Продуктът може да се дава на кърмещи жени само под лекарски контрол, поради опасност от нежелани ефекти от страна на кърмачето.

#### 3.4. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма отбелязани.

#### 3.5. Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите ефекти на ацетилсалициловата киселина са дозо-зависими.

**Често се наблюдават** – дразнене на стомашната мукоза и абдоминална болка, диспепсия, гадене и повръщане. По-рядко дразненето на стомашната мукоза може да доведе до ерозия, улцерация и кървене от стомашно-чревния тракт. Тези ефекти се потенцират от алкохол.





Реакции на свръхчувствителност, като бронхоспазъм, ринити, уртикария, ангиоедема, анафилактичен шок, се наблюдават по-често при астматици, пациенти с назални полипи и тежка атопия.

Тинити и намаляване на слуха, намалена бъбречна функция, намалено протромбиново време и хепатотоксичност се наблюдават по-често при серумни нива на продукта над 200 mcg/mL и особено при възрастни пациенти при прием и на ниски дози.

*Рядко се наблюдават* – ренална папиларна некроза, особено при хроничен прием на високи дози.

#### 4.8. Предозирине

Продължителното приемане на дози превишаващи препоръчаните може да доведе до нефро- и хепатотоксичност; при остро предозирине може да се развие фатална чернодробна и ренална некроза. Симптомите на предозирине са от страна на ЦНС, кожата, алкално-киселинен дисбаланс, електролитен дисбаланс, шок и включват: замаяност, тинити, изпотяване, гадене и повръщане, хипервентилация, висока температура и неспокойствие.

Токсични серумни нива са над 35 mg/dL.

**Лечение:** стомашна промивка и предизвикване на емеза, рехидратация и форсирана алкална диуреза. Стомашна промивка с активиран въглен се прилага, когато е възможно осъществяването и в рамките на 1 час след приема, пациентът е в съзнание без наличие на гърчове и със запазени дихателни рефлексии. Важно е да се поддържа адекватна диуреза и да се коригира алкално-киселинния дисбаланс и серумните електролити, особено калий. Хемодиализа и перитонеална диализа са ефективни при тежко предозирине (100 mg/dL) с бъбречна недостатъчност, белодробна едема, продължителни ЦНС нарушения, тежък алкално-киселинен и електролитен дисбаланс и коагулопатия. За алкализиране на урината се прилага инфузия с натриев бикарбонат, особено при пациенти при които диализата е противопоказана. При необходимост може да се приложи декстроза, витамин К, натриев хлорид и калий под форма на интравенозна инфузия. При гърчове се





прилага диазепам. Хипертермията трябва да се коригира и при нужда да се приложи изкуствена вентилация.

## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1. Фармакодинамични свойства

Ацетилсалициловата киселина проявява аналгетична, противовъзпалителна и антипиретична активност вследствие инхибиране на синтеза на простагландини. Ефективността на ацетилсалициловата киселина и нейният основен метаболит (салицилат) се дължи отчасти на способността да инхибира необратимо циклооксигеназата, както и на антиоксидантните и свойства. Ензимът циклооксигеназа катализира превръщането на арахидонова киселина в ендопероксиди; в терапевтични дози се потиска образуването на простагландини и тромбосани, но не и на левкотриени. Ацетилсалициловата киселина инхибира тромбоцитната агрегация. В големи дози (5 г/дневно) повишава секрецията на пикочна киселина, докато в ниски дози (2 г/дневно) намалява тази секреция.

### 5.2. Фармакокинетични свойства

#### 5.2.1. Абсорбция

Ацетилсалициловата киселина, след перорално приложение се резорбира почти напълно (80-100%) в стомаха и тънките черва. Храната не повлиява бионаличността на нехидролизираната ацетилсалицилова киселина и салицилата, но забавя абсорбцията. Част от ацетилсалициловата киселина се хидролизира до салицилат в чревната стена.

#### 5.2.2. Разпределение

Ацетилсалициловата киселина се разпределя бързо във всички тъкани и телесни течности. Обемът на разпределение е 0.15—0.2 L/kg. Обемът на разпределение се повишава с повишаване на дозата. С плазмените протеини се свързва в 50-80%. Концентрацията в синовиалната течност е 78% от плазмената концентрация. Плазмената концентрация на ацетилсалициловата киселина намалява бързо с повишаване плазмените нива на салицилата.





Терапевтичните серумни нива на салицилова киселина са : 150-300 mcg/mL.  $t_{1/2}$ : ацетилсалицилова киселина - 15-20 мин; салицилова киселина - 2-20 ч, в зависимост от дозата.

### 5.2.3. Метаболизъм

Елиминира се главно чрез чернодробен метаболизъм до салицилова киселина, салицил фенолен глюкуронид, салицил ацил глюкуронид, гентизова киселина и гентизурейна киселина. Кинетиката е от нулев порядък, следствие на което постоянните плазмени нива се увеличават непропорционално с дозата.

Ацетилсалициловата киселина се хидролизира главно от чернодробните естерази и в по-слаба степен в плазмата и еритроцитите. Ектеразната активност е намалена при заболявания на черния дроб и особено при алкохолизъм. Количеството на нехидролизираната ацетилсалицилова киселина в плазмата корелира с аналгетичната активност.

### 5.2.4. Екскреция

Ацетилсалициловата киселина и нейните метаболити се екскретират главно през бъбреците. Екскрецията на непроменено лекарство зависи от дозата и рН на урината (5.6% до 35.6%). Реналната екскреция включва гломерулна филтрация, активна ренална тубуларна секреция и пасивна тубуларна реабсорбция. Времето на полу-елиминиране е 4.7 - 9 часа (средно 6 часа). При ниско уринарно рН и потисната ренална функция се удължава полу-живота на ацетилсалициловата киселина. Чрез алкализирание на урината може да се увеличи екскрецията на салицилата.

### 5.3. Предклинични данни за безопасност

Пероралното LD50	Интраперитонеалното LD50
при плъхове - 1200 мг/кг при зайци - 1010 мг/кг при мишки - 815 мг/кг при кучета - 700 мг/кг	при плъхове - 390 mg/kg







Няма данни за туморигенен и карциногенен ефект върху мишки и плъхове. Няма мутагенно действие при използване на стандартни бактериални тестове (Ames Salmonella test), в концентрации максималните препоръчвани за тези тестове. Няма данни за тератогенност на ацетилсалициловата киселина при хората. Има данни, че във високи дози ацетилсалициловата киселина е тератогенна при мишки, плъхове, кучета, котки и маймуни.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1. Наименование и количество на помощните вещества

Starch Ph. Eur. III – 0.036 g

### 6.2. Несъвместимости

Няма отбелязани

### 6.3. Срок на годност

24 месеца

### 6.4. Начин на съхранение

Да се съхранява на сухо място недостъпно за деца при температура до 30° C.

### 6.5. Вид и естество на опаковката

Прозрачна пластмасова екологично чиста бутилчица, със специално защитена при отваряне капачка и междинна диафрагма между таблетките и капачката.

### 6.6. Инструкции за транспортиране

Да не противоречат на начина на съхранение.

## 7. ПРОИЗВОДИТЕЛ И ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

A&S PHARMACEUTICAL CORP.,  
480 BARNUM AVENUE, BRIDGEPORT,  
CT 06608, USA

BORA 1001 CO.,  
1124 СОФИЯ  
УЛ. МИЗИЯ 19

## 8. ДАТА НА ПЪРВАТА РЕГИСТРАЦИЯ В БЪЛГАРИЯ

№ 9600001/02.01.1996г.

## 9. СТРАНИ В КОИТО ЛЕКАРСТВЕНИЯТ ПРОДУКТ Е РЕГИСТРИРАН

САЩ - №1216901/1971г.

РУСИЯ - П-8-242 № 002528/1992г.

ГРУЗИЯ - № R 0000777/2001г.

## 10. ДАТА НА ПОСЛЕДНАТА ПОПРАВКА НА ТЕКСТА : Януари 2002

