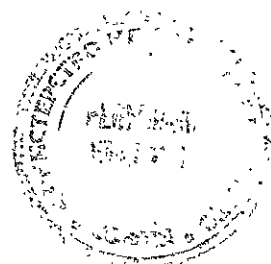
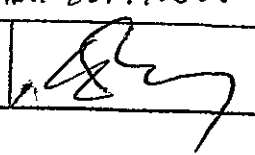


КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА



Balkanpharma-Dupniza AD

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-2271/15.08.00	
396/11.07.00	

ASPIRIN®
(АСПИРИН® /ACETYLSALICYLIC ACID)

1. **ИМЕ НА ЛЕКАРСТЕНОТО СРЕДСТВО**
ASPIRIN®
2. **КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ**
Acetylsalicylic acid 500 mg
3. **ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**
Таблетки

4. **КЛИНИЧНИ ДАННИ**

4.1. **ПОКАЗАНИЯ**

Болка и/или фебрилитет - Аспирин® е подходящ за симптоматично облекчаване на лек до умерен болков синдром при главоболие, при остри и хронични възпалителни заболявания на горните дихателни пътища; грип и други вирусни заболявания; остри инфекциозни болести, при температурни състояния от неясен произход и др;

Противовъзпалителен ефект:

При неревматични възпалителни и дегенеративни мускулно-ставни заболявания - симптоматично облекчаване на симптомите, като болка, оток, зачервяване и локално повишение на температурата при миалгии, мускулно-скелетни болки, спортни травми, бурсити, капсулити, тендинити и неспецифични остри тендосиновити;

Облекчаване на симптомите на възпаление при ревматоиден артрит, остър ставен ревматизъм, ювенилен артрит, синдром на Reiter, ставни симптоми при Лупус еритематодес, остеоартрит анкилозиращ спондилит, псориатичен артрит, фиброзити и др;

Антиагрегантен ефект:

Профилактика на тромбоемболични инциденти при пациенти с анамнеза за прекаран миокарден инфаркт или нестабилна ангина пекторис; при пациенти с анамнеза за преходни нарушения на мозъчното кръвообръщение и при пациенти след кардиоваскуларни хирургични интервенции;

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА УПОТРЕБА

При възрастни като аналгетично и антипиретично средство се приема по 1-2 таблетки от 500 mg при нужда. Може да се прилага по 1 таблетка на четири часа до максимална дневна доза до 3 g;

Като антиревматоидно средство - по 2 таблетки от 500 mg 3-4 пъти дневно, (до обща доза 3.5 до 4 g дневно).

Като антиагрегантно средство - 250 mg (1/2 таблетка) еднократно дневно;

При деца над 12 години само след лекарско предписание в 250 mg (1/2 таблетка) 2 до 3 пъти дневно; от 12 до 16 годишна възраст по 250 до 500 mg (1/2 до 1 таблетка) до 3 пъти дневно, максимална дневна доза при деца е 1,5 до 1,8 g разпределени в 3 до 6 приема.

Аспирин® се приема перорално по време или след хранене, с повече течност. Таблетките могат да се разтворят във вода преди приема.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Аспирин® е противопоказан: при; при настояща анамнеза за кървящи язви или други остри заболявания на стомашно-чревния тракт; при проблеми с кръвосъсирването като хемофилия, тромбоцитопения, хеморагични състояния и др.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ

Медикаментът не се препоръчва за редовна употреба при анамнеза за стомашна или дуоденална язва, гастрит, колит, холецистит, както и остри или хронични гастроентероколити; тежки бъбречни и чернодробни заболявания, възпаления с или без камъни на жлъчния мехур; обилна менструация или маточни кръвоизливи с различен произход; астма; Аспирин® не трябва да се прилага дълго време (над 10 дни) и/или във високи дози (повече от 8 таблетки за 24 часа, а за възрастни над 60 години повече от четири таблетки за 24 часа) без лекарско предписание;

При по-продължително прилагане (над 10 дни) да се контролира кръвното налягане, особено при хипертоници;

Не се препоръчва употребата на Аспирин® при деца под тригодишна възраст;

При деца от 3 до 12 години не се прилага, особено ако имат фебрилитет при грип или други вирусни инфекции като шарки, тъй като могат да предизвикат синдром на Рей.

Пациенти в напреднала възраст са по-чувствителни към салицилатите и при тях могат да се наблюдават по-често странични ефекти, поради което трябва да се прилагат в редуцирани дози;

Необходима е прецизна оценка на съотношението полза/риск преди назначаване на редовно лечение с Аспирин® при пациенти с анамнеза стомашна или дуоденална язва, гастрит, колит, холецистит, както и остри или хронични гастроентероколити; тежки бъбречни и чернодробни заболявания, възпаления с или без камъни в жлъчния мехур; обилна менструация или маточни кръвоизливи с различен произход; остра или хронична бъбречна недостатъчност; анемия; състояния предразполагащи към задръжка на течности - тежка сърдечно-съдова недостатъчност, артериялна хипертония и др; хипопротеинемии и дефицит на витамин К (повишава се риска от кръвоизливи); подагра (Аспирин® може да повиши серумното ниво на пикочната киселина и така да провокира пристъп на заболяването); астма и бронхоспастични състояния особено ако са провокирани от Аспирин® или други нестероидни противовъзпалителни препарати; тиреотоксикоза (може да се обостри при прием на високи дози салицилати).

Не трябва да се употребяват таблетки Аспирин®, които имат неприятна кисела миризма (подобна на миризма от оцет);

Препоръчва се спиране на терапията с Аспирин® поне 5 дена преди провеждане на хирургическа интервенция за предотвратяване на кръвотечения;

При лечение на артрити дозата не трябва да се променя по-често от един път седмично, тъй като за достигане на необходимите терапевтични нива е необходим най-малко седем дневен лечебен курс.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

При съвместна употреба на Аспирин® с други нестероидни противовъзпалителни средства се засилва значително риска от настъпване на стомашно-чревни странични ефекти и кръвоизливи;

Натриуретичният ефект на спиронолактон намалява при съвместна употреба с Аспирин®;

Диуретици и АСЕ-инхибитори в комбинация с НСПВС в това число и Аспирин® могат да предизвикат остра бъбречна недостатъчност;

При съвместна употреба с кортикостероидни препарати Аспирин® може да повиши риска гастро-интестинални улцерации, а кортикостероидите намаляват серумните нива на Аспирин®;

Пропранолол намалява противовъзпалителният ефект на Аспирин®;

Фенобарбитал намалява ефекта на Аспирин® поради ензимна индукция и ускорение на метаболизма му;

Едновременна дълготрайна употреба на Аспирин с ацетаминофен повишава сигнификантно риска от настъпване на аналгетична нефропатия, бъбречно-папиларна некроза, както и опасност от развитие на рак на бъбреците или на пикочния мехур;

Съвместната употреба със средства подкисляващи рН на урината, като амониев хлорид, витамин С, калиев и натриев фосфат намаляват плазмената концентрация на Аспирин® и трябва да се употребяват с повишено внимание при пациенти приемащи високи дози от медикамента за по-продължителен срок;

Алкохол или нестероидни противовъзпалителни средства, употребявани съвместно с Аспирин®, повишават риска от настъпване на гастроинтестинални странични явления;

Средствата алкализирани урината, като инхибиторите на карбоанхидразата, цитрати, натриев бикарбонат и други антиациди ускоряват екскрецията на Аспирин® и така намаляват плазмената му концентрация и съответно намаляват продължителността на терапевтичното действие;

Аспирин® може да измести хепарин или кумаринови или индандионови антикоагуланти от свързването им с плазмените белтъци и така да повиши нивото им в плазмата и в по-високи дози може да предизвика хипопротромбинемия, повишена антикоагулация и риск от кървене;

При съвместна употреба на Аспирин® с тромболитични препарати като антистрептаза, стрептокиназа, урокиназа и др. се удължава времето на кървене и се засилва риска от хеморагии;

При едновременна употреба с антиконвулсанти, като хидантоин, се повишават плазмените нива на последния, както ефективността му и/или токсичността му, поради което е необходима корекция на дозата на хидантоина;

Аспирин® може да намали терапевтичния ефект на орални антидиабетните средства и на инсулин, поради което се налага корекция на дозата им и повишено внимание при тази комбинация; Антиеметиците, включително антихистамините и фенотиазините могат да маскират признаците на Аспирин®-индуцирана ототоксичност;

Препарати като цефалоспоринови антибиотици и валпроева киселина могат да предизвикат хипопротромбинемия, а валпроевата киселина инхибира тромбоцитната агрегация. Съвместната им употреба с Аспирин® повишава риска от кървене;

Не се препоръчва съвместна употреба на Аспирин® с други ототоксични медикаменти, като например ванкомицин;

Не се препоръчва съвместна употреба на Аспирин® с антиагреганти поради повишение на риска от кървене;

Нуждите от витамин К могат да се повишат при пациенти получаващи високи дози Аспирин®.

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Не се препоръчва употребата на препарата от бременни жени, както и от жени в кърмачески период. Особено важно е да не се прилага в последните три месеца от бременността поради опасност от увреждане на плода или компликации по време на раждането;

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Няма данни за неблагоприятно повлияване на активното внимание, рефлексите и двигателната активност.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Аспирин® може да предизвика някои нежелани ефекти след по-продължителна употреба на дози над 1 g дневно.

От страна на стомашно-чревния тракт могат да се наблюдават дразнене, болки или киселини в стомаха; гадене и повръщане; неразположение или подуване на червата, повишено отделяне на газове; при по-продължителна употреба на високи дози може да предизвика скрити кръвоизливи в стомаха и червата, нарушения в кръвосъсирването, световъртеж, главоболие, шум в ушите, учестено

дишане (т.н. салицилово пиянство), сънливост, известна задръжка на течности в организма;

Алергични реакции: бронхоспазъм предизвикан от ацетизал - вероятно може да се прояви при пациенти с астма, алергии или полипи в носа, предизвикани от Аспирин®; ангиоедем или уртикария - при пациенти с идиопатична ангиоедема или уртикария; при продължителна употреба на по-високи дози може да се наблюдава хепатотоксичност, намаление на бъбречната функция - при болни с предварително увредена такава; намаление на протромбиновото време, метаболитна ацидоза др. признаци на тежка интоксикация;

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

При неволно поемане на високи дози Аспирин® се установява настъпване признаци на метаболитна ацидоза, ускорено дишане, дезориентация, световъртеж, зрителни смущения, смущения в слуха (шум или "пищене" в ушите), главоболие, гастроинтестинални смущения като гадене, повръщане и диария, намаляване на протромбиновото време с опасност от настъпване на хеморагии (при предиспозиция).

При тежка интоксикация с Аспирин® се наблюдават кървава урина, конвулсии, учестено и повърхностно дишане, халюцинации, възбуда и дори обърканост, необясним фебрилитет.

Лабораторно-инструментални отклонения при отравяне с Аспирин® са енцефалографски промени, метаболитна ацидоза, съпроводена с респираторна алкалоза, хипергликемия или хипогликемия (особено при деца), кетонурия, хипонатриемия, хипокалиемия и протеинурия.

Лечение - след изпразване на стомаха (чрез предизвикан емезис и стомашен лаваж), и прилагане на активни адсорбери (медицински въглен и др.) е наложителна хоспитализация, поради необходимост от предизвикване на усилена алкална диуреза, хемодиализа, перитонеална диализа или хемоперфузия при тежки случаи. Необходимо е венозно приложение на витамин К₁ и строго мониториране на болните.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

АТС Код - NO2B A 01 - Други аналгетици и антипиретици. Салицилова киселина и производни;

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

Аспирин® притежава аналгетичен, противовъзпалителен и антипиретичен ефект, а според приетата доза проявява и противоревматичен и антиагрегантен ефект.

Аналгетичният и антипиретичен ефекти се дължат на директно инхибиране на ензима циклооксигеназа и намаляване образуването на прекурсори на простагландини и тромбоксани от арахидоновата киселина в мястото на възпалението.

Аналгетичният ефект се дължи също и на един периферен механизъм блокиращ генерирането на болкови импулси (чрез инхибирането на простагландини и други субстанции, сенсibiliзиращи болковите рецептори към механични или химични дразнителни), както и на централен механизъм, действащ вероятно в хипоталамуса.

Противовъзпалителният (нестероиден) ефект на салицилатите се обяснява също отчасти с инхибиране отделянето на простагландини и други медиатори на възпалението "in loco" във възпалените тъкани; предполага се и участието на такива механизми като инхибиране миграцията на левкоцитите, инхибиране освобождаването и/или действието на лизозомни ензими, действие върху други клетъчни и имунологични процеси в клетките на съединителната тъкан и др.

Антипиретично действие на Аспирин® се обяснява с централно действие върху хипоталамичния терморегулаторен център, чрез инхибиране на простагландиновата синтеза в него, както и с предизвикване на кожна вазодилатация, увеличаваща потоотделянето.

Аспирин® в ниски дози има доказан антиагрегантен ефект, който се дължи на действието му като донор на ацетил за мембраните на тромбоцитите; функцията на тромбоцитите се повлиява и чрез инхибиране на ензима простагландин циклооксигеназа, като така се предотвратява образуването на мощният агрегант Тромбоксан А2. Многоцентрови, добре контролирани клинични проучвания доказват, че в по-ниски от обичайните (антиагрегантни дози) ацетизал предотвратява риска от настъпване на внезапна сърдечна смърт и/или нефатални миокардни инфаркти при пациенти с прекаран вече миокарден инфаркт или нестабилна ангина пекторис, а също така намалява риска от развитие на преходни нарушения на мозъчното кръвообращение и мозъчен инсулт в цялостната популация.

Предполага се, че гастроинтестиналната токсичност на салицилатите се дължи на първично намаляване активността на простагландините в стомашната лигавица и така неутрализиране на протективната им роля "ин локо", както и на директен дразнещ или ерозивен ефект върху лигавицата при перорална употреба.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Аспирин® се резорбира бързо и пълно през стомашно-чревния тракт след перорална употреба като ефервесцентната форма значително подобрява и ускорява усвояването на ацетизал. Установено е че се отделя чрез кърмата. Свързването с плазмените албумини е високо, поради което при намалено ниво на албумин в кръвта, бъбречна недостатъчност или бременност се установяват по-високи плазмени нива на ацетизал в кръвната плазма.

Метаболизира се интензивно в стомашно-чревния тракт и черния дроб. Плазменият полуживот на Аспирин® е 15 до 20 минути. Максимална плазмена концентрация се постига между 1-ви и 2-ри час след еднократен перорален прием, като се ускорява при ефервесцентната форма на препарата. Терапевтична плазмена концентрация за постигане на аналгетичен и антипиретичен ефект се постига и след прием на една таблетка. Елиминира се прадимно през бъбреците във вид на метаболити. Отстранява се с хемодиализа.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

5.3.1. Токсичност

Ацетилсалициловата киселина е слабо токсична. При перорално приложение при опитни животни (кучета, зайци и др.) започват да се наблюдават токсични прояви при дози над 0.4 g/kg, а леталитет се наблюдава при перорални дози над 0.7 g/kg.

5.3.1. Канцерогенност, мутагенност:

Не се установява канцерогенен ефект на ацетизал прилаган при плъхове в продължение на две години;

Мутагенните тестове *in vivo* не показват мутагенен ефект;

5.3.2. Бременност/репродуктивност:

Фертилитет - предизвикват повишен брой на фетусна резорбция

Бременност:

Първи триместър - Аспирин® преминава през плацентата, но изследванията "ин виво" не показват данни за тератогенност. Изследвания при животни показват, че се причиняват фисури на гръбначния стълб, малформации на централна нервна система, вътрешните органи и скелета, както и офталмологични дефекти, Трети триместър - при редовна употреба "ин виво" се повишава риска от синдром на преносването (опасност от увреждания на фетуса в резултат на плацентарна дисфункция в резултат на преносването). Прием на ацетизал, особено в последните две седмици от бременността може да повиши риска от фетусни или неонатални кръвоизливи, или преждевременно затваряне на дуктус артериозус на фетуса, причиняващо по всяка вероятност трайна пулмонална хипертония и сърдечна недостатъчност.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6. 1. Списък на помощните вещества в mg:

№	Наименование	Количество	Нормативен документ
1	Maize starch	100.00	Ph. Eur. 3

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни

6.3. Срок на годност

4 (четири) години от датата на производство

6.4. Условия на съхранение

На сухо и защитено от светлина място при температура под 25°C

6.5. Лекарствена форма и опаковка

Таблетки 500 mg по 20 броя в една опаковка

6.6. Препоръки при употреба

Препаратът не трябва да се употребява след изтичане срока на годност, указан на опаковката.

7. Производител

Вaіkanpharma-Dupniza AD
гр. Дупница, ул. "Самоковско шосе" N3
Тел. (0701) 2-42-81/82; 2-90-21/29
Факс: (0701) 2-23-65; 2-81-62

