

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ASPISAL

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество :

Acetylsalicylic acid 325.0 mg

USP 23

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕСНАЗДАНИЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-6432/27.11.02	
627/22.10.2002	<i>Менюф.</i>

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки филмирани

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

1. Болка и/или фебрилни състояния

Аспизал е показан за облекчаване на лека и умерена болка от различен произход, като главоболие, зъбобол, менструални болки, миалгии, костно-мускулни болки, болка и възпаление, съпровождащи други неревматични възпалителни състояния, ревматични заболявания - остър и хроничен ревматоиден артрит, ювенилен артрит, остеоартрит и сродни ревматични заболявания.

2. повишена телесна температура.

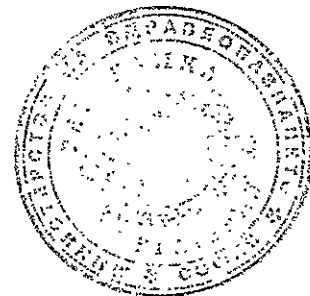
3. Аспизал е показан за профилактика на миокардния инфаркт при пациенти с нестабилна ангина пекторис и за предпазване от реинфаркт.

4. Профилактика на тромбоемболизъм - намаляване на риска от тромбоемболизъм след ортопедични операции, при пациенти с изкуствени сърдечни клапи или артерио-венозен шънт.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Препоръчвана доза за възрастни :

Аналгетик/антипиретик – единична перорална доза 325 до 650 mg на всеки четири часа при нужда; максимална дневна доза - до 8-10 таблетки дневно.



Антиревматик – 3.6 до 5.4 g дневно, разпределими в отделни приеми; при остър ревматичен пристъп до 7.8 g дневно в отделни приеми, перорално.

Антиагрегант – доза 325 mg дневно.

Приемането на лекарствения продукт трябва да става след хранене или с храна, с оглед избягване на стомашно дразнене.

Препоръчва се таблетките винаги да бъдат приемани с пълна чаша вода /240 ml/.

Препоръчва се Аспизал да не бъде назначаван преди изтичането най-малко на седем дни от извършена тонзилектомия или хирургична намеса в устната кухина. Аспизал не трябва да бъде поставян директно върху зъбната или невенечната повърхност.

Деца под 12 годишна възраст: при ревматологични заболявания (ювенилен хроничен артрит) - по лекарско предписание. Дозировка: от 7 до 12 години - доза 1 таблетка до 3 пъти дневно.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина и/или други НСПВС, както и към помощните вещества на лекарствения продукт. ;

Бременност;

Кърмене;

Кървяща язва или други хеморагични състояния;

Ерозивен гастрит или пептична язва;

Хемофилия;

Хронична бъбречна недостатъчност; продуктът е противопоказан при тежка бъбречна недостатъчност (Cl cr под 10 ml/min).

Тромбоцитопения;

- Глюкозо-6-фосфат-дехидрогеназна недостатъчност

- бронхиална астма, алергия, назална полипоза

Деца под 7 годишна възраст.

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Децата, особено тези с повишена температура и дехидратация, могат да бъдат по-чувствителни към токсичните ефекти на салицилатите. Малките деца, както и тези в училищна възраст не трябва да приемат този лекарствен продукт при заболяване от варицела или грип , преди консултация с лекар.



Редица изследвания показват, че използването на аспирин може да бъде свързано с развитие на синдром на Reye при деца с остри фебрилни състояния, по-специално грип и варицела.

Пациенти в напреднала възраст могат да бъдат също по-чувствителни към токсичните ефекти на салицилатите, вероятно поради намалена бъбречна функция. Могат да бъдат необходими по-ниски дози от тези, които обикновено се препоръчват за възрастни, особено при продължително лечение или при употреба на дълго-действащи салицилати / като холиновите и магнезиеви салицилати /. Използването на този лекарствен продукт трябва да става много внимателно при следните заболявания и състояния:

*Анемия – поради повишен риск от гастро-интестинални кръвоизливи;
псевдоанемията може да бъде резултат на периферна вазодилатация;

*Състояния, предразполагащи към задръжка на течности, като например компрометирана сърдечна функция или хипертония;

*Подагра;

*Нарушена чернодробна функция

*Хипопротромбинемия или хиповитаминоза К

*Нарушена бъбречна функция

*Тиреотоксикоза;

Изброените по-долу показатели трябва да бъдат използвани за периодично контролиране на статуса в хода на лечението с аспирин-съдържащи лекарствени продукти / могат да бъдат използвани и други тестове при някои пациенти, в зависимост от състоянието/;

*Хематокрит;

*Чернодробни функционални тестове

*Концентрации на Mg в серума;

*Серумни концентрации на салицилатите

Взаимодействие с диагностични тестове

Резултатите от тези взаимодействия могат да бъдат както следва:



*Определяне на глюкоза в урината с помощта на тест с меден сулфат – могат да бъдат отчетени фалшиво-положителни резултати при хронично приложение на дози , еквивалентни на съдържание на салицилати 2.4 g или повече;

*Глюкозо-ензимен тест за определяне на глюкоза в урината – фалшиво-отрицателни резултати могат да бъдат отчетени при хронично приложение на дози , еквивалентни на съдържанието на салицилати от 2.4 g и повече;

*Промяна на резултатите при определяне на пикочна киселина в серума;

Промени в някои физиологични показатели:

*Време на кръвене – може да се удължи след 4.7 дневно приложение на аспирин, тъй като потиска агрегацията на тромбоцитите;

*Промяна в стойностите на чернодробните ензими /А1АТ , АsАТ , АР/;

*Протромбиново време – може да бъде удължено при приемане на високи дози салицилати;

*Серумен холестерол и концентрации на калия – могат да бъдат понижени;

*Серумни нива на пикочна киселина – могат да се повишат или понижат;

*Серумни концентрации на Т3 и Т4 – могат да се понижат.

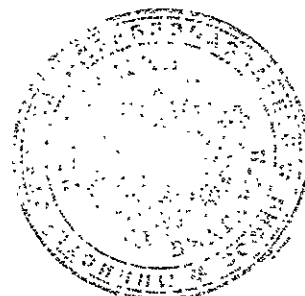
4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Едновременното приложение на Аспизал с някои от по-долу изброените лекарства, може да доведе до нежелани лекарствени взаимодействия :

*Ацетаминофен или фенацетин – продължително едновременно приложение сигнификантно повишава риска от аналгетична нефропатия, бъбречна папиларна некроза;

*При едновременно продължително приложение с адренокортикостероиди , глюкокортикостероиди и АКГХ, се наблюдават по-ниски плазмени концентрации на салицилатите, изискващи повишаване на дозата им, поради засилване екскрецията на салицилатите от тези лекарства;

*Алкохолът и други нестероидни противовъзпалителни средства и аналгетици при едновременно приложение с Аспизал могат да доведат до повишен риск от гастроинтестинални нежелани реакции, включително улцерации и гастроинтестинални кръвоизливи;



*Аминогликозидни антибиотици, буметадин, капреомицин, цисплатин, етакринова киселина, фуросемид, ванкомицин – при едновременно приложение със салицилати се повишава потенциалният риск от ототоксични ефекти;

*Антиацидни средства, при продължително приложение във високи дози и средства, алкализиратци урината – повишаване екскрецията на салицилатите с урината и намаляване на плазмените им концентрации;

*Антикоагуланти / кумарин или индандионови деривати / или хепарин, стрептокиназа или урокиназа – повишава се рискът от кървене, тъй като аспирин измества от местата на свързване с плазмените протеини антикоагулантите и повишава относително техните плазмени концентрации и съответно фармакологичната им активност;

*Орални антидиабетични средства или инсулин - едновременното приложение с аспирин усилва хипогликемичните им ефекти

* Антиеметични средства - едновременното приложение маскира симптомите на предизвиканата от салицилатите ототоксичност

*Аскорбинова киселина – аспирин повишава уринната екскреция на аскорбиновата киселина.

*Антиконвулсанти (валпроева киселина, фенитоин) - аспирин измества тези лекарства от местата за свързване с плазмените протеини и повишава плазмените им концентрации

* АСЕ-инхибитори, бета-блокери - аспирин понижава действието им

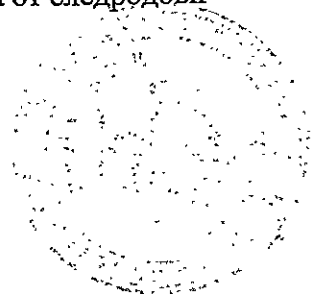
* Диуретици - продуктът понижава диуретичното действие

* Урикозурични средства (пробенецид и сулфинпиразон) - понижава се урикозуричното действие на продуктите

* Метотрексат - усилват се както желаните, така и нежеланите действия на метотрексат

4.6 Бременност и кърмене

Салицилатите преминават през плацентата. Има съобщения, че прилагани по време на бременността могат да повишат риска от поява на вродени дефекти при човека. Хроничното приложение на високи дози салицилати може да доведе до удължена гестация, повишен риск от преносване на бременността / риск от увреждания на плода или смърт, предизвикана от намаляване на плацентарната функция, ако преносването на бременността е по-значително / и повишава риска от следродови



кръвоизливи при майката. Освен това, прилагането на аспирин повишава значително риска от кръвоизливи на фетуса и новороденото.

Проблеми при човека при приемане на установените средни аналгетични дози не са документирани; трябва да бъде отбелязан и възможният риск за кърмачето, тъй като салицилатите се екскретират с майчиното мляко.

При продължително приемане на високи дози салицилати, те могат да предизвикат редица нежелани ефекти при кърмачето.

Лекарственият продукт не трябва да се прилага по време на бременност (абсолютно противопоказано е приложението през третия триместър на бременността) и при кърмене (ако приложението на продукта е крайно наложително, кърменето трябва да се спре).

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма негативни ефекти.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Салицилатите могат да понижат функцията на бъбреците.

Аспирин-предизвиканият бронхоспазъм е много вероятен при лица с триадна астма, аспирин-предизвикани алергии и назална полипоза.

Ангиоедем и уртикария могат да бъдат наблюдавани при пациенти с анамнеза за рецидивиращ ангиоедем или уртикария.

Реакции на свръхчувствителност са още и кожните обриви, пруритус, остра анафилактична реакция.

Гастроинтестинални нежелани реакции - гадене, повръщане, коремни болки, гастро-интестинално кървене, улцерации се наблюдават по-често при лечение с аспирин, отколкото при използването на други салицилати, като тяхната честота се увеличава с увеличаване продължителността на лечението и е в пряка зависимост от приложената доза.

Концентрация на салицилати в плазмата (мкг/мл)	Ефект
195-200	Лека интоксикация /шум в ушите , намаление на слуха/
250	Хепатотоксичност/ патологична промяна в чернодробните проби/
250	Намаляване на бъбречната функция
300	Намаляване на протромбиновото време
310	Глухота
350	Хипервентилация
>400	Метаболитна ацидоза, други признаци на тежка интоксикация

4.9 Предозиране

Салицилизъм / лека степен на интоксикация / - намаление на слуха , диария / тежка или продължителна / , виене на свят , сънливост , главоболие / силно или продължително / , паметови нарушения , гадене и повръщане , стомашни болки , необичайни или неконтролируеми потрепвания на ръцете , проблеми със зрението.

Тежка интоксикация – хематурия , конвулсии , халюцинации , нервност , необясним фебрилитет, понякога достигащ много високи стойности. Промяна в поведението , сънливост или уморемост , тахипнея или хиперпнея при децата.

Лабораторна находка - аномалии в енцефалограмата , нарушение в алкално киселинното състояние , хипер- или хипогликемия , кетонурия, хипонатриемия , хипокалиемия , протеинурия.

Лечение – освобождаване на стомаха от неговото съдържание , посредством стомашна промивка , кислородотерапия , вливане на инфузионни разтвори , прилагане на симптоматични средства.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

АТС код -N02BA 01; B01AC 06

Фармако-терапевтична група - аналгетици/антипиретици, група на салициловата киселина и производни

5.1 Фармакодинамични свойства

Аспизал притежава аналгетично , противовъзпалително и антипиретично действие. Лекарственият продукт инхибира ензима циклооксигеназа и намалява образуването на прекурсори на простагландините и тромбоксаните от арахидоновата киселина. Води до аналгезия от периферен тип , посредством блокиране генерирането на болковите импулси , както и чрез централно действие , най-вероятно оказвайки ефекти върху хипоталамуса. Точният механизъм на противовъзпалителното действие все още не е достатъчно изяснен. Потискане миграцията на левкоцитите , освобождаването и/или действието на лизозомните ензими и повлияване на други клетъчни и имунологични процеси в мезенхима и съединителната тъкан , вероятно играят роля в противовъзпалителната активност на продукта.

Ацетилсалициловата киселина вероятно дължи своя температуропонижаващ ефект на централното си действие върху терморегулаторния център в хипоталамуса, предизвиквайки периферна вазодилатация , която води до усилване на периферния кожен кръвоток, потене и отделяне на топлина. Ацетилсалициловата киселина е инхибитор на тромбоцитната агрегация.

Действа върху тромбоцитите , инхибирайки ензима простагландин циклооксигеназа в тях , потиска образуването на агрегиращия агент тромбоксан А2.



5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция – бърза и пълна след перорално приложение , приемът на храна намалява скоростта на резорбцията , без да променя степента и ;

Степен на свързване с плазмените протеини – висока / с плазмените албумини /.

Метаболизъм – хидролизира се в голяма степен в гастро-интестиналния тракт и черния дроб ;

Полуживот – 15-20 минути , бързо се хидролизира до салицилати ;

Tmax – 1-2 часа след единична орална доза ;

Време за достигане на steady-state нива – 7 дни

Терапевтични плазмени концентрации – 25-50 $\mu\text{g/ml}$ / аналгетично и антипиретично действие / ; 150-300 $\mu\text{g/ml}$ / противовъзпалително действие /.

Екскреция – бъбречна , основно под формата на свободна салицилова киселина и под формата на конюгирани метаболити ; в майчиното мляко – под формата на салицилати. Максимални концентрации на салицилатите / 173-483 $\mu\text{g/ml}$ / са установени между 5 и 8- час след приемане от страна на майката на единична доза от порядъка на 650 mg аспирин. Времето на полуелиминиране от майчиното мляко е 3.8-12.5 часа след еднократна доза от 650 mg аспирин.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Изследванията върху животни са показали , че салицилатите водят до вродени дефекти , включително фисури на гръбначния стълб и черепа , лицеви дефекти , очни дефекти , малформации на ЦНС , на вътрешните органи и скелета / по-специално на прешлените и ребрата /.

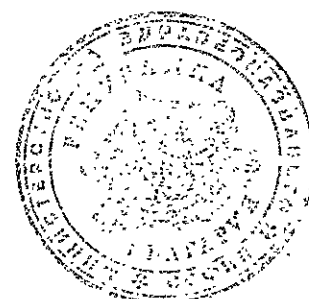
В изследванията върху животни , салицилатите водят до повишаване броя на феталните резорбции.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества и техните количества

Microcrystalline cellulose	29.0 mg	USP 23
Starch	24.0 mg	USP 23

Филмово покритие



Hydroxupropyl methylcellulose	0.60 mg	USP 23
Polyethylen Glycol	0.10 mg	USP 23
Propylene Glycol	0.04 mg	USP 23

6.2 Физико-химични несъвместимости

Няма данни.

6.3 Срок на годност

3 / три / години

6.4 Специални условия на съхранение

Съхранява се при температура под 30° С.

6.5 Данни за опаковката

100 филмирани таблетки с тънкослойно покритие се опаковат в 75 см 3 прозрачна HDPE банка

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Generica Inform Impex ,
"Sultan tepe" № 19
1124 Sofia , Bulgaria

ПРОИЗВОДИТЕЛ

LNK INTERNATIONAL , INC ,
Hauppauge , NY , USA

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ЗЛАХМ

.....

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

.....

10. ДАТА НА ЧАСТИЧНА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКТА - 13.05.1998 г.

