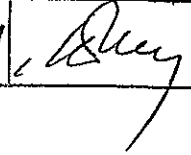


МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-4223/18.10.01г.

612/25.09.01



**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА
НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**



1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АСПИСЕВТ ASPISEVT

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една таблетка съдържа:

Acetylsalicylic acid 500 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

4. ФАРМАКО-ТЕРАПЕВТИЧНА ГРУПА

АТС - N02BA01; B01AC06

Аналгетици/антипиретици, Салицилова киселина и производни

5. КЛИНИЧНИ ДАННИ

5.1. Показания

- симптоматично средство при лека и умерена болка от различен произход и температурни състояния, свързани с простудни заболявания, грип;

- противовъзпалително средство при остър ставен ревматизъм, остър и хроничен ревматоиден артрит и обострена остеоартроза и дегенеративни ставни заболявания;

- като антиагрегант за профилактика на острия миокарден инфаркт и тромбемболизъм.

5.2. Дозировка и начин на приложение

Препоръчвани дози при възрастни:

- аналгетик/антипиретик - 500-1000 mg при нужда; МДД – 3 g (500 mg на всеки 4 часа);

- противовъзпалително средство - дневна доза 1000 mg на всеки 8 - 6 часа;

- антиагрегант (точната доза е все още неуточнена) - препоръчва се ежедневен прием на 100-350 mg в зависимост от вида на заболяването.

Препоръчвани дози при деца над 12 годишна възраст:

- аналгетик/антипиретик - 250-500 mg при нужда;

- противовъзпалително средство - дневна доза 1000 mg на всеки 8 часа;



МДД – 1,5-2,0g, разпределени в 3-4 равномерни приема;

Таблетките се приемат с достатъчно количество течност (240 ml) по време или след хранене.

5.3. Противопоказания

- свръхчувствителност към някой от компонентите на препарата, салицилати и нестероидни противовъзпалителни средства;
- алергични заболявания и атопии, назална полипоза, бронхиална астма;
- бременност и кърмене;
- ерозивен гастрит, пептична язва и кървяща язва, други хеморагии;
- хемофилия;
- тромбоцитопения, левкопения;
- глюкозо-6-фосфат-дехидрогеназна недостатъчност;
- деца до 12 годишна възраст.

5.4. Специални указания и предпазни мерки при употреба

В детската възраст при фебрилни състояния и дехидратация е повишена чувствителността към токсичните ефекти на продукта. Приемът на Асписевт е свързан с развитието на синдрома на Reye при деца с остри фебрилни състояния (грип и варицела).

При лицата в напреднала възраст също е налице повишена чувствителност към токсичните ефекти на салицилатите (най-вероятно поради ограничената бъбречна функция) се препоръчва използването на по-ниски дози, особено в случаите на продължително лечение.

Прилага се с внимание при точно прецизиране на индикациите при анемия, състояния, свързани със задръжка на течности, чернодробни и бъбречни заболявания, хипопротромбинемия, вит. К недостатъчност, тиреотоксикоза. В хода на продължително лечение се препоръчва контролиране стойностите на хематокрита, чернодробната и бъбречна функция, по възможност плазмените концентрации на салицилатите, следи се за поява на окултни кръвоизливи.



Таблетките Асписевт не трябва да се поставят върху зъбния емайл и венечната лигавица.

При продължително приложение на Асписевт във високи дози е възможно да се компрометират резултатите при следните лабораторни изследвания:

- глюкоза в урината (фалшиво-положителни резултати при тест с меден сулфат и фалшиво-отрицателни резултати при използване на ензимен тест);
- серумни нива на урея;
- времето на кървене и протромбиновото време може да бъде удължено след прием на Асписевт в продължение на 4-7 дни поради потискане агрегацията на тромбоцитите;
- при продължително приложение на Асписевт може да се наблюдава промяна в стойностите на АІАТ, АsАТ, АР, серумните нива на холестерол и натрий (понижение), пикочна киселина (повишение или понижение); серумни нива на Т₃ и Т₄ (понижение).

Помощното вещество Wheat starch (пшенично нишесте) може да представлява опасност за хора с глутенова ентеропатия.

5.5. Лекарствени и други взаимодействия

- ацетаминофен и фенацетин - повишен риск от аналгетична нефропатия, бъбречна папиларна некроза;
- адренокортикоиди, глюкокортикоиди, АСТН - повишен улцерогенен ефект и понижаване плазмените нива на салицилатите поради повишена екскреция;
- други аналгетици/антипиретици, НСПВС - повишен риск от гастроинтестинални нежелани лекарствени реакции и реакции на свръхчувствителност;
- аминокликозидни антибиотици, цисплатин, етакринова киселина, фуросемид - повишен риск от ототоксичност;
- пеницилини и цефалоспорици - забавяне на екскрецията им и удължаване на антибиотичния им ефект;



- антиацидни средства и средства, алкализиращи урината - понижаване на плазмените концентрации на салицилатите, поради повишена екскреция;
- антикоагуланти – повишен риск от хеморагии поради синергизъм по отношение на антиагрегантното действие. Необходимост от засилен клиничен и лабораторен контрол;
- орални андиабетични средства и инсулин - повишаване на хипогликемичния им ефект;
- орални антиконцепционни средства - намалени плазмени нива и полуживот на Асписевт;
- фенитоин - увеличена плазмена концентрация и ефекти на последния;
- аскорбинова киселина - повишена уринна екскреция на последната и увеличени плазмени нива на салицилатите и усилване на ефектите им.

5.6. *Употреба по време на бременност и в периода на кърмене*

Салицилатите преминават през плацентата. Има данни, че приложението им след 6^{ти} месец на бременността е свързано с риск от конгенитални дефекти. Продължителното приложение във високи дози води до удължаване на гестацията, увреждания на фетуса в резултат на понижаване функцията на плацентата поради удължената продължителност на бременността и повишаване риска от антенатални хеморагии при майката. Приложението на ацетилсалицилова киселина в последните 2 седмици на бременността се съпътства от риск за фетални и неонатални хеморагии. Потенциалният риск от нежелани лекарствени реакции при кърмачето трябва да бъде взет под внимание при продължителното приложение на ацетилсалицилова киселина при кърмещи жени, тъй като салицилатите се екскретират с майчиното мляко.



5.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Не повлиява негативно психосоматичния статус, но при тези категории лица трябва да бъдат взети пред вид някои от възможните нежелани лекарствени реакции, особено при приложение на високи дози - шум в ушите, световъртеж, главоболие, нарушения в равновесието.

5.8. Нежелани лекарствени реакции

Гастро-интестинални смущения - гадене, повръщане, болка, улцерации и хеморагии.

Реакции на свръхчувствителност - кожни обриви, пруритус, уртикария, бронхоспазъм, ангиоедем.

Ацетилсалицилова киселина-индуциран бронхоспазъм може да се развие при пациенти с триадна астма, назална полипоза. Ангиоедем и уртикария могат да се развият по-често при пациенти с анамнестични данни за алергични заболявания и атопии.

От страна на нервната система - главоболие, световъртеж, шум в ушите, нарушения в равновесието и зрението.

Други - хипопротромбинемия, хемолитична анемия, тромбоцитопения, учестено дишане, увреждане на бъбречната и чернодробна функция, синдром на Reye.

5.9. Предозиране

Видът на нежеланите лекарствени реакции и степента на предозиране показва следната корелация с плазмената концентрация на салицилатите:

Плазмени концентрации

($\mu\text{g/ml}$)

195-200
250

250

300

310

350

>400

НЛР

Шум в ушите, нарушения в слуха
Хепатотоксичност (промяна в чернодробните функционални проби)

Понижена бъбречна функция
Намалено протромбиново време
Глухота

Хипервентилация

Метаболитна ацидоза, признаци на тежка интоксикация



Лека степен - намаляване на слуха, диария, виене на свят, сънливост, главоболие, паметови нарушения, гадене и повръщане, стомашни болки, неконтролируеми потръпвания и тремор на дланите, нарушения в зрението.

Тежка степен - хематурия, конвулсии, халюцинации, раздразнителност, необяснима температура, в някои случаи много висока.

Лабораторна находка - нарушения в алкално-киселинното състояние, хипер- или хипогликемия, кетонурия, хипонатриемия и хипокалиемия, протеинурия.

Лечение - стомашна промивка, симптоматични средства, кислородолечение, интравенозни вливания.

6. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ЕФЕКТИ

6.1. Фармакодинамика

Притежава противовъзпалително, аналгетично и антипиретично действие. Инхибира ензима циклооксигеназа и така понижава образуването на прекурсорите на простагландините и тромбосан. Аспириновата аналгезия е както от периферен (отсъствието на простагландини и ендопероксиди намалява чувствителността на сетивните нервни окончания към алгогенните медиатори и екзогенни нокси) и централен тип (вероятно в резултат на ефект върху таламуса). Точният механизъм на неговото противовъзпалително действие е недостатъчно изяснен. Потиска миграцията на левкоцитите, потиска освобождаването (посредством стабилизиране на лизозомните мембрани) и действието на лизозомалните ензими, както и други клетъчни и имунологични процеси в мезенхимната и съединителна тъкан. Вероятно антипиретичното му действие е свързано с повлияване на терморегулаторния център в хипоталамуса и предизвикването на периферна вазодилатация. Салицилатите потискат агрегацията на тромбоцитите, посредством потискане на ензима простагландин циклооксигеназа в тях и образуването на агрегация-агент тромбосан A_2 .



Аналгетичната и антипиретична активност се проявява при плазмени концентрации 25-50 µg/ml, а противовъзпалителното действие при концентрации от порядъка на 150-300 µg/ml.

6.2. Фармакокинетични данни

Резорбция - след перорално приложение се резорбира бързо и в значителна степен; едновременният прием на храна намалява скоростта, без да променя степента на резорбция;

Свързване с плазмените протеини - висока степен, основно с албуминната фракция;

Метаболизъм - в значителна степен се метаболизира в гастроинтестиналния тракт и черния дроб;

Време на полуелиминиране - 15-20 min; бързо се хидролизира до салицилати;

t_{max} - 1-2 h след еднократна доза;

Време за постигане на равновесно състояние - 7 дни

Елиминиране - бъбречна екскреция, първоначално като свободна салицилова киселина и конюгати, в майчиното мляко - под формата на салицилати. Максимални концентрации в майчиното мляко - 173-483 µg/ml между 5 и 8 час след прием на единична доза 650 mg.

6.3. Предклинични данни за безопасност

LD₅₀ след перорално приложение при мишки – 1,1 g/kg т.м.

LD₅₀ след перорално приложение при плъхове – 1,5 g/kg т.м.

В опити върху животни е установено, че салицилатите предизвикват конгенитални дефекти, вкл. фисури на гръбначния стълб и черепа, очни дефекти, малформации на ЦНС, вътрешните органи и скелета (най-често на прешлените и ребрата).

Повишава броя на феталните резорбции.

7. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

7.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Cellulose, microcrystalline	69,0 mg
Talc	6,0 mg
Wheat starch	35,0 mg



7.2. Физико-химични несъвместимости

Няма данни.

7.3. Срок на годност

4 (четири) години.

7.4. Специални условия на съхранение

В оригинални опаковки, на сухо и защитено от слънчева светлина място при температура под 25°C.

7.5. Данни за опаковката

10 броя таблетки в блистер от цветно PVC/алуминиево фолио.

2 броя блистери заедно с листовка се опаковат в картонена кутия.

8. ПРОИЗВОДИТЕЛ И ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗР. ЗА УПОТРЕБА

“Българска роза Севтополис” АД

бул. “23^{ти} Шипченски полк” 110

6100 Казанлък, България

тел. (0431) 2 10 92, 2 10 98

факс (0431) 4 80 34

9. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА – 02.05.1996 г.

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА АКТУАЛИЗАЦИЯ - 01.10.2001 г.

