

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА
ACETYSAL®

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ
Acetysal®

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ
Лекарствено вещество в една таблетка: Acetylsalicylic acid - 500 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА
Таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ
4.1. ПОКАЗАНИЯ

За симптоматично лечение на възпалителни, простудни заболявания и други състояния, придружени с лек до умерен болков синдром и/или фебрилитет:

- остри и хронични възпалителни заболявания на горните дихателни пътища, грип и вирусни инфекции;
- главоболие, мигрена;
- временно облекчаване на болките при: миалгии, артралгии, спортни травми, бурсити, капсулит, тендинити и неспецифични остри тендосиновити;
- зъбобол и болки след стоматологични процедури;
- менструални болки.

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА УПОТРЕБА

Приема се перорално по време или непосредствено след хранене, с достатъчно количество течност. Таблетките могат да се разтворят в чаша вода преди приема.

Възрастни: по 1-2 таблетки от 500 mg през 6-8 часа (максимална дневна доза - 3 g) за кратък период (от 1 до 3-4 дни).

Деца над 12 години: по 1/2 до 1 таблетка (250 - 500 mg) при нужда.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- свръхчувствителност към активното и/или към някое от помощните вещества на продукта;
- активна стомашна и дуоденална язва и/или данни за скорошно кървене от гастроинтестиналния тракт;
- нарушения в кръвосъсирването като хемофилия, тромбоцитопения, хеморагична диатеза;
- анамнестични данни за астма, индуцирана от приложението на салицилати или субстанции с подобно действие, особено нестероидни противовъзпалителни лекарствени продукти;

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-12721/3-04/2006	
692/17.03.06	<i>М. М. М.</i>



- едновременно приложение с метотрексат при дози над 15 mg/седмично за пациент;
- първи и трети триместър на бременността.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗА УПОТРЕБА

Acetysal[®] трябва да се прилага само след внимателна преценка риск/полза в следните случаи:

- деца под 12 годишна възраст;
- известна свръхчувствителност към други нестероидни противовъзпалителни средства;
- бронхиална астма, назална полипоза, алергични заболявания и атопии;
- увредена бъбречна и/или чернодробна функция;
- анамнестични данни за стомашно-чревни язви, включително хронична или рецидивираща язвена болест или за стомашно-чревни кръвоизливи;
- едновременно лечение с антикоагуланти.

Приложение на ацетилсалицилова киселина при деца под 12 години може да става само под лекарско наблюдение. При деца и подрастващи до 12 години със заболявания, протичащи с много висока температура (като грип, варицела или други вирусни инфекции), Acetysal[®] трябва да се назначава само ако другите антипиретични продукти не са дали ефект. Ако по време на лечението с Acetysal[®] се появи мъчителна, упорито повръщане, гърчове и нарушение в съзнанието, трябва да се мисли за развитие на синдрома на Рей и приложението му да се прекрати незабавно.

Необходима е прецизна оценка на съотношението полза/риск преди назначаване на редовно лечение с Acetysal[®] при пациенти с анамнеза за язвена болест, гастрит, колит, холецистит, както и остри или хронични гастроентероколити; тежки бъбречни и чернодробни заболявания; обилна менструация или маточни кръвоизливи с различен произход; остра или хронична бъбречна недостатъчност; анемия, дефицит на витамин К (повишава се риска от кръвоизливи); подагра (ацетилсалициловата киселина може да повиши серумното ниво на пикочната киселина и така да провокира пристъп на заболяването); астма и бронхоспастични състояния; тиреотоксикоза (може да се обостри при прием на високи дози салицилати).

Хроничното приемане на алкохол повишава риска от гастроинтестинално кървене при едновременно приемане с ацетилсалицилова киселина.

Препоръчва се прекратяване на терапията с Acetysal[®] поне 5 дни преди провеждане на хирургични интервенции с цел ограничаване на хеморагични усложнения.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

При едновременна употреба на Acetysal[®] с други нестероидни противовъзпалителни средства, кортикостероиди или алкохол се повишава рискът от настъпване на нежелани ефекти от страна на стомашно-чревния тракт (улцерации,



кървене). Кортикостероидите намаляват серумните нива на ацетилсалициловата киселина.

При съвместна употреба на Acetysal[®] с тромболитични продукти като антистрептаза, стрептокиназа, урокиназа и др. се удължава времето на кървене и се засилва риска от хеморагии.

Acetysal[®] може да измести хепарина, кумариновите и индандионови антикоагуланти от свързването им с плазмените протеини и така да повиши нивото им в плазмата и риска от кървене.

Не се препоръчва съвместна употреба на Acetysal[®] с антиагреганти поради повишение на риска от кървене.

Някои продукти като цефалоспоринови антибиотици и валпроева киселина могат да предизвикат хипопротромбинемия, а валпроевата киселина инхибира тромбоцитната агрегация. Съвместната им употреба с Acetysal[®] повишава риска от кървене.

Acetysal[®] може да засили хипогликемичния ефект на оралните сулфанилурейни антидиабетни средства, поради което се налага корекция на дозата им и повишено внимание при тази комбинация.

Натриуретичният ефект на спиронолактон намалява при съвместна употреба с Acetysal[®].

Acetysal[®] намалява бъбречния клирънс на метотрексат и така може да повиши плазмените му концентрации до токсични, поради което не се препоръчва съвместната им употреба.

Acetysal[®] отслабва ефекта на урикозуричните лекарствени продукти (пробенецид, сулфинпиразон).

Едновременната употреба с антиациди, H₂-блокери и антихолинергични продукти намалява резорбцията на Acetysal[®].

Фенобарбитал намалява ефекта на Acetysal[®] поради ензимна индукция и ускорение на метаболизма му.

Acetysal[®] намалява чернодробния клирънс на зидовудин, като се повишава риска от токсичност.

Едновременното приемане с тетрациклини може да доведе до образуване на нерезорбируеми комплекси. Това изисква интервал от най-малко 1-3 часа между приема на различните лекарствени продукти.

Едновременна дълготрайна употреба на Acetysal[®] с ацетаминофен повишава сигнификантно риска от настъпване на аналгетична нефропатия, бъбречно-папиларна некроза.

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

Нуждите от витамин К могат да се повишат при пациенти получаващи високи дози Acetysal[®].



4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Бременност:

Acetysal® не бива да се използва в първите и последните три месеца на бременността, поради опасност от увреждане на плода и хеморагични усложнения по време на раждането. През останалото време Acetysal® трябва да се прилага във възможно най-ниски дози и само след лекарско назначение и при внимателна оценка на съотношението полза/риск.

Употреба по време на кърмене

Ацетилсалициловата киселина преминава в майчиното мляко в малки количества. Обикновено не се налага прекъсване на кърменето. При редовен прием или при прием на високи дози, кърменето трябва да се преустанови.

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Не оказва влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Нежеланите ефекти на ацетилсалициловата киселина са дозо-зависими. Acetysal® може да предизвика някои нежелани реакции след по-продължителна употреба на дози над 1 g дневно.

От страна на стомашно-чревния тракт могат да се наблюдават: киселини, диспепсия, абдоминални болки; гадене и повръщане; подуване на корема, повишено отделяне на газове; при по-продължителна употреба на високи дози може да предизвика окултни стомашно-чревни кръвоизливи.

Реакции на свръхчувствителност: бронхоспазъм, ринити, уртикария, ангиоедем или анафилактичен шок – по-често при пациенти с астма, с назални полипи и тежка атопия.

Нарушения в кръвосъсирването: тромбоцитопения, удължаване на протромбиновото време.

При по-продължителна употреба на по-високи дози може да се наблюдава *хепатотоксичност, намаляване на бъбречната функция* (особено при болни с предварително увредена такава) и в единични случаи ренална папиларна некроза.

Сърдечно-съдови и биохимични - продължително приемане на дози над 1g дневно могат да предизвикат дискретно повишение на систолното артериално налягане, както и повишение на плазменото ниво на пикочната киселина и уреята.

Приемането на високи дози може да доведе до световъртеж, главоболие, шум в ушите, учестено дишане, сънливост, известна задръжка на течности в организма, стомашно-чревни язви с кървене.

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

При предозирание могат да се наблюдават някои от следните симптоми: настъпване признаци на метаболитна ацидоза, ускорено дишане, дезориентация, световъртеж, зрителни смущения, нарушения в слуха (шум или “пищене” в ушите), главоболие, гастроинтестинални смущения като гадене, повръщане и диария.



протромбиновото време с опасност от настъпване на хеморагии (при предиспозиция) и др.

При тежка интоксикация с Acetysal® се наблюдават хематурия, конвулсии, учестено и повърхностно дишане, халюцинации, превъзбуда и дори обърканост, необясним фебрилитет.

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

Лечение – при пациенти в съзнание: изпразване на стомаха (чрез предизвикано повръщане и стомашен лаваж), и прилагане на активни абсорбенти (медицински въглен и др.). Наложителна е хоспитализация, поради необходимост от постоянен контрол и поддържане на респираторната и сърдечно-съдова функция и контрол на алкално-киселинното равновесие и електролитния баланс. Ускорено отделяне се постига чрез предизвикване на усилена алкална диуреза, хемодиализа, перитонеална диализа или хемоперфузия при тежки случаи. При необходимост може да се приложи глюкоза, витамин К, натриев хлорид, калий под формата на интравенозни инфузии. При гърчова симптоматика се прилага диазепам.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

АТС код: N02BA 01; B01AC 06

Ацетилсалициловата киселина 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 тромбосани 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 на място във възпалените тъкани. Предполага се и участието на такива механизми като инхибиране миграцията на левкоцитите, инхибиране освобождаването и/или действието на лизисомни ензими, действие върху други клетъчни и имунологични процеси в клетките на съединителната тъкан и др.

Антипиретично действие на ацетилсалициловата киселина 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.

Ацетилсалициловата киселина в ниски дози (100 - 380 mg) 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. Резултатите от редица многоцентрови, контролирани клинични проучвания показват, че в по-ниски от обичайните дози, ацетилсалициловата киселина намалява риска от настъпване на внезапна сърдечна смърт и/или нефатални миокардни инфаркти при пациенти с преживян вече миокарден инфаркт или с нестабилна стенокардия, а също така намалява риска от развитие на преходни нарушения на мозъчното кръвообръщение 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, както и на директен иритативен или ерозивен ефект върху лигавицата при перорална употреба.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Абсорбция:

Ацетилсалициловата киселина се резорбира бързо и почти напълно в стомашно-чревния тракт (80-100%). Храната не повлиява бионаличността на нехидролизираната ацетилсалициловата киселина и салицилата, но забавя резорбцията.

Разпределение:

Ацетилсалициловата киселина се разпределя бързо във всички тъкани и телесни течности. Обемът на разпределение е 0.15-0.2 L/kg. С плазмените протеини се свързва в 50-80%. Концентрацията в синовиалната течност е 78% от плазмената концентрация. Преминава лесно хематоенцефалната и плацентарна бариера. Максимална плазмена концентрация се постига между 1-ви и 2-ри час след еднократен перорален прием. Терапевтичните серумни нива на салициловата киселина са 150-300 µg/ml. T_{1/2} на ацетилсалициловата киселина - 15 до 20 мин; на салициловата киселина – 2-20 ч, в зависимост от дозата.

Метаболизъм:

Ацетилсалициловата киселина се хидролизира главно от чернодробните естерази и в по-слаба степен в плазмата и еритроцитите. Естеразната активност е намалена при заболявания на черния дроб и особено при алкохолизъм.

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 тубулна секреция и пасивна тубулна реабсорбция. Времето на полуелиминиране е 4.7-9 часа (средно 6 часа). При ниско рН на урината и при потисната бъбречна функция се удължава полуживота на ацетилсалициловата киселина. Чрез алкализирание на урината може да се увеличи екскрецията на салицилата. Установява се и излъчване в кърмата.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Токсичност:

Ацетилсалициловата киселина е слабо токсична.



LD₅₀ при перорално приложение: при плъхове - 200 mg/kg; при мишки – 250 mg/kg; при кучета – 700 mg/kg; при зайци – 1010 mg/kg.

LD₅₀ при интраперитонеално приложение: при мишки - 167 mg/kg; при плъхове – 340 mg/kg.

LD₅₀ при интравенозно приложение: при кучета – 681 mg/kg.

Канцерогенност/мутагенност

Няма данни за туморогенен и карциногенен ефект върху мишки и плъхове. Не е установено мутагенно действие при използване на стандартни бактериални тестове (Ames Salmonella test), при максимални концентрации, препоръчвани за тези тестове.

Репродуктивност и бременност:

Фертилитет - предизвиква повишен брой на фетусна резорбция.

Бременност –

Първи триместър - ацетилсалициловата киселина 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 се повишава риска от синдром на преносването (опасност от увреждания на фетуса в резултат на плацентарна дисфункция в резултат на преносването). Прием на ацетилсалицилова киселина, 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 у новороденото.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА

Maize starch

Sodium starch glycollate

6.2. ФИЗИКО-ХИМИЧНИ НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Не са известни.

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

4 (четири) години от датата на производство.

6.4. СПЕЦИАЛНИ УСЛОВИЯ НА СЪХРАНЕНИЕ

При температура под 25⁰ С.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. ДАННИ ЗА ОПАКОВКАТА

10 таблетки от 500 mg в блистер от PVC/алуминиево фолио.

По 2 блистера в картонена кутия.



6.6. ПРЕПОРЪКИ ПРИ УПОТРЕБА

Виж т. 4.2.

Да не се употребява след изтичане срока на годност.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Актавис" ЕАД,

1000 гр. София, България

Бул. "Княгиня Мария Луиза" № 2

Бизнес център ЦУМ

Тел. 02 9321 762

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 от ЗЛАХМ

Reg № 20000692

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

01.05.1984 г.

10. ДАТА НА ЧАСТИЧНА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Февруари, 2006 г.

