

ПРИЛОЖЕНИЕ I
КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АСЕТЫЛИН 500 mg tablets
АЦЕТИЛИН 500 mg таблетки



2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа активно вещество ацетилсалицилова киселина (acetylsalicylic acid) 500 mg.

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Симптоматично лечение на остри възпалителни заболявания на горните дихателни пътища, протичащи с фебрилитет (грип и други вирусни инфекции), както и състояния, съпроводени със слаби до умерени болки: невралгии, зъбобол, главоболие, мигрена;
- Остър ревматоиден артрит, ревматоиден полиартрит, възпалителни и дегенеративни ставни заболявания, неврити, полиневрити;
- Профилактика на инфаркт на миокарда и мозъчен инсулт при рискови пациенти;
- Профилактика на следоперативни тромбози.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Ацетилин таблетки се приема по време или след хранене, с достатъчно количество течности.

За възрастни:

- За симптоматично повлияване на болка и температура - по 1-2 таблетки 3 пъти дневно. Максимална дневна доза – 3 g.
- При остри и хронични възпалителни заболявания - по 2 таблетки 3 пъти дневно.
- Като антиагрегант - по ½ таблетка дневно.

За деца над 12 години:

- За симптоматично повлияване на болка и температура – ½ до 1 таблетка дневно при нужда.
- Като противовъзпалително средство – по 1 таблетка 3 пъти дневно.

Не се препоръчва употребата на Ацетилин при деца под 12-годишна възраст поради риск от развитие на синдрома на Reye (вж. точка 4.3 и 4.4).

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество, салицилати или към някое от помощните вещества на продукта;
- Стомашна и дуоденална язва;
- Хеморагична диатеза, тромбоцитопения, хемофилия.



- Бъбречна недостатъчност и оксалурия;
- Деца под 12-годишна възраст.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Едновременната употреба на други салицилати или нестероидни противовъзпалителни средства с ацетилсалицилова киселина трябва да се избягва поради засилване на риска от сериозни нежелани реакции.

- При пациенти с известна свръхчувствителност към други нестероидни противовъзпалителни средства поради възможността от развитие на кръстосани алергични реакции;
- При такива с бронхиална астма, назална полипоза, алергични заболявания и атопии, поради повишен риск от поява на реакции на свръхчувствителност;
- В случаи на генетично обусловена глюкозо-6-фосфат-дехидрогеназна недостатъчност, поради възможна поява на хемолитична анемия;
- При наличие на стомашно-чревни заболявания (напр. гастрит);
- При пациенти с чернодробни и/или бъбречни заболявания;
- Приемът на ацетилсалицилова киселина продължително време може да доведе до увреждане на бъбреците, поради което е необходимо да се контролира периодично бъбречната функция при такива пациенти;
- Приемът на ацетилсалицилова киселина при деца до 12 години с простудни заболявания, грип и други вирусни инфекции, протичащи с повишена температура, е свързан с повишен риск от развитие на синдром на *Reye*. Той се характеризира с продължително повръщане, дехидратация, нарушения на съзнанието, гърчове, което изисква незабавно интензивно лечение. Ацетилсалициловата киселина при деца може да се използва само при изрично лекарско предписание;
- Съществува кръстосана свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина и природни пеницилини;
- Рискът от стомашно кървене се повишава при лечение с ацетилсалицилова киселина на пациенти с хроничен алкохолизъм.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременното приложение на ацетилсалицилова киселина с други лекарства може да доведе до засилване или отслабване на ефекта им.

- Едновременното приложение на ацетилсалицилова киселина с глюкокортикостероиди, други нестероидни противовъзпалителни средства или алкохол повишава риска от кървене от стомашно-чревния тракт.
- Ацетилсалициловата киселина може да засили хипогликемичния ефект на сулфанилурейните продукти, поради което е необходимо да се контролира нивото на глюкозата в кръвта при нужда от прилагането ѝ при пациенти с диабет.
- При комбиниране на ацетилсалицилова киселина с метотрексат се повишава хематотоксичността на последния, поради намаления му бъбречен клирънс и изместването му от плазмените протеини.
- Ацетилсалициловата киселина може да потенцира ефекта на антикоагулантите и антитромботичните лекарства (напр. производни на кумарина, хепарин, дипиридамол и сулфинпиразон), при което се повишава риска от поява на хеморагии. При необходимост от съвместното им приложение е необходимо да се контролира по-често протромбиновото време.
- Ацетилсалициловата киселина отслабва ефекта на спиронолактон и фуросемид в резултат на намалена гломерулна филтрация от повишения синтез на бъбречните простагландини.



- Антихипертензивният ефект на ACE-инхибитори и други антихипертензивни продукти се антагонизира в резултат на задръжка на електролити при едновременното им приложение с ацетилсалицилова киселина в дози 1-2 g дневно.
- Ефектът на урикозуричните средства (пробенецид, сулфинпиразон) може да бъде понижен поради конкурентните взаимодействия върху елиминирането на пикочната киселина през бъбречните тубули.
- Плазмените концентрации на дигоксин, барбитурати и литиеви соли могат да се повишат при едновременния им прием с ацетилсалицилова киселина.
- Антиациди, H₂-блокери и антихолинергични средства намаляват резорбцията на ацетилсалицилова киселина при едновременната им употреба.
- Едновременното приемане с тетрациклини може да доведе до образуване на нерезорбируеми комплекси, поради което е необходимо да се спазва интервал от най-малко 1-3 часа между приема на отделните лекарства.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Не се препоръчва прилагането на Ацетилин в III-то тримесечие на бременността, тъй като може да предизвика удължаване на времето на кървене при майката и детето. През първите 6 месеца от бременността Ацетилин трябва да се прилага във възможно най-ниските дози веднъж дневно и само след внимателна оценка на съотношението риск/полза и при строги медицински показания.

Кърмене

Ацетилсалициловата киселина се екскретира в майчината кърма, поради което се препоръчва преустановяване на кърменето при прием на продукта.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Ацетилин не оказва влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нарушения на кръвоносната и лимфна системи - удължаване на времето на кървене, тромбцитопения, желязодефицитна и апластична анемия;

Нарушения на имунната система – реакции на свръхчувствителност, уртикария и други кожни обриви, ринити, ангиоедема, последвана от бронхоспазъм. Лица, свръхчувствителни към ацетилсалицилова киселина, могат да имат кръстосана свръхчувствителност към други нестероидни противовъзпалителни средства. Рядко и предимно при деца може да се развие синдром на *Reye*;

Нарушения на нервната система – при продължителна употреба е възможна поява на световъртеж, главоболие, обратими зрителни нарушения, шум в ушите;

Респираторни нарушения – При пациенти със свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина може да се провокира бронхоспазъм. Това е най-често свързано с наличие на назални полипи при такива пациенти. Комбинацията от свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина, астма и назални полипи е известна като аспиринова триада;

Стомашно-чревни нарушения – най-често се срещат гадене, повръщане, диспепсия, стомашна болка. Тяхната честота може да бъде намалена при прием на лекарствения продукт по време или след хранене. Възможни са случаи на асимптомно кървене от стомашно-чревния тракт, което в редки случаи, при ненавременно диагностициране, може да доведе до развитие на желязодефицитна анемия;

Хепато-билиарни нарушения – чернодробните прояви обикновено са леки, изразени с преходно леко до умерено повишаване на чернодробните ензими. Продължителния



прием на високи дози ацетилсалицилова киселина може да доведе до чернодробни увреждания;

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища – обратимо намаляване на реналния кръвоток, рядко е възможно увреждане на бъбречните функции.

4.9 Предозиране

Основни симптоми:

Гадене, повръщане, стомашни болки, световъртеж, главоболие, объркване, шум в ушите и хипервентилация с респираторна алкалоза. При по-продължителен прием на високи дози ацетилсалицилова киселина се наблюдават потискане на ЦНС, хиперпирексия, респираторна и метаболитна ацидоза, язви на стомаха, токсична циркулаторна и бъбречна недостатъчност, мозъчен и белодробен оток, кома. При деца е възможна и хипогликемия.

Лечение на предозирането

- при възможност елиминиране на нерезорбираното количество (внимателна стомашна промивка);
- необходимо е проследяване на киселинно-алкалното равновесие, електролитния баланс, кръвната глюкоза и тяхното коригиране при необходимост;
- интензивни медицински грижи (обдишване, вливане на течности);
- ускоряване на отделянето на приетото вещество чрез алкализиране на урината, форсирана диуреза, хемодиализа или перитонеална диализа;
- в случай на поява на гърчове са показани антиконвулсивни средства (диазепам).

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Други аналгетици и антипиретици. Салицилова киселина и производни, АТС код NO2BA01

Ацетилсалициловата киселина проявява аналгетичен ефект по отношение на екстеро- и проприоцептивни видове болки (произхождащи от кожата, опорно-двигателния апарат, зъбите). Има изразен противовъзпалителен (противоревматичен) и умерен антипиретичен ефект. В ниски дози (50-380 mg) потиска тромбоцитната агрегация. Има известен холекинетичен и хипогликемичен (при диабетици) ефект. Във високи дози стимулира дишането, понижава нивото на протромбина в кръвта (конкурентен антагонизъм с витамин К) и засилва екскрецията на пикочна киселина (урикозуричен ефект).

Основен момент в механизма на действие на ацетилсалициловата киселина е инхибиране на циклооксигеназата, което води до блокиране синтеза на ендопероксиди, простагландини и тромбоксани. Аналгетичният ефект има предимно периферен механизъм - липсата на простагландини и ендопероксиди намалява чувствителността на сетивните нервни окончания към алгогенните медиатори и екзогенните нокси. Противовъзпалителният ефект на ацетилсалициловата киселина е обусловен преди всичко от потискане синтеза на ендопероксиди и простагландини в самото огнище на възпалението. Определена роля играе също стабилизирането на лизозомните мембрани, инхибиране на хиалуронидазата, декупелуване на окислителното фосфорилиране и други.

Антипиретичното ѝ действие е свързано с понижаване нивото на простагландините Е и Д в централната нервна система, които опосредстват влиянието на екзогенни и ендогенни пирогени върху терморегулаторния център в хипоталамуса. Освен това ацетилсалициловата киселина потиска образуването, освобождаването и преминаването в ЦНС на пирогените, които се образуват от бактериални



ендотоксини и неутрофилните левкоцити. Нарушеният синтез на простагландини и повишаване нивото на левкотриени лежи в основата и на нежеланите ефекти на продукта.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция: Ацетилсалициловата киселина се резорбира бързо и пълно в стомашно-чревния тракт. В организма се превръща в салицилат, но през първите 20 минути след резорбция ацетилсалицилова киселина е основната форма на лекарството в плазмата.

Разпределение: С плазмените протеини се свързва в 80 до 90%. Разпределя се в повечето тъкани на организма. Има голям обем на разпределение (около 170 ml/kg). При увеличаване на плазмените концентрации се наблюдава насищане на свързващите участъци на плазмените протеини и обема на разпределение нараства. Премахва лесно хематоенцефалната и плацентарната бариери.

Метаболизъм: Метаболизира се основно в черния дроб чрез хидролиза с образуване на салицилова киселина и последваща конюгация с глицин или глюкуронид.

Екскреция: Времето на полуживот на ацетилсалицилова киселина варира от 2 до 4½ часа. Елиминирането се извършва предимно през бъбреците под формата на свободна салицилова киселина (85% при алкална, 10% при кисела урина). С урината се екскретира 50% от въведеното количество под форма на различни конюгати и отчасти в непроменен вид. Ацетилсалициловата киселина преминава в майчината кърма.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Ацетилсалициловата киселина взаимодейства с ДНК *in vitro*: в ниски концентрации - с фосфатните групи в структурата на ДНК А-Т базите, а във високи концентрации - с G-C-двойките.

Ацетилсалициловата киселина не проявява мутагенно действие при *Ames Salmonella* тест. С или без метаболитна активация ацетилсалициловата киселина индуцира хромозомни аберации при култивирани фибробласти. Няма данни за канцерогенен потенциал при изследвания върху плъхове и мишки.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Целулоза, микрокристална; натриев нишестен гликолат; силициев диоксид, колоиден безводен; магнезиев стеарат.

6.2 Несъвместимости

Няма данни

6.3 Срок на годност

- за опаковка блистер PVC/алуминиево фолио - 4 години;
- за опаковка банка от полипропилен x 100 таблетки - 2 години.

Продуктът да не се употребява след изтичане срока на годност, отбелязан върху опаковката.

6.4 Специални условия на съхранение

В оригиналната опаковка, на сухо и защитено от светлина място, при температура под 25°C.



6.5 Данни за опаковката

- 10 таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио, по 2 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.
- 100 таблетки в банка от полипропилен.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20020212

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

23.12.1993 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Октомври 2008 г.

