

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ASPEGIC 1000 mg, powder for oral solution in a single dose-sachet

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

DL-LYSINE ACETYLSALICYLATE

(съответстващ количествено на acetylsalicylic acid 1000 mg)

1800 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Прах за перорален разтвор в саше за еднократен прием

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към	
нарием № 96 58 / 21.09.04 г.	
660/13.07.04	мечка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични индикации

- симптоматично лечение на слаба или средно силна болка и/или фебрилитет
- симптоматично лечение на възпалителни и дегенеративни заболявания на опорно-двигателния апарат.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Само за възрастни

Начин на приемане

Перорално приложение.

Изпива се веднага след пълното разтваряне на сашето в голяма чаша вода, мляко, или сок.

Дозировка

- При лечение на слаба до средно силна болка и/или фебрилитет

♦ За възрастни и деца с тегло около и над 50 kg (около 15 години):
Максималната дневна доза е 3g ацетилсалицилова киселина, тоест 3 сашета на ден.

Обичайната доза е 1 саше x 1g, като дозировката може да се повтори, но след интервал не по-малък от 4 часа. При всички случаи да не се надвишава вземането на три сашета на ден.

Пациенти в напреднала възраст:

Максималната препоръчана дневна доза е 2 g ацетилсалицилова киселина, тоест 2 сашета на ден.

Обичайната доза е 1 саше x 1g, като дозировката може да се повтори, но след интервал не по-малък от 4 часа. При всички случаи да не се надвишава вземането на 2 сашета на ден.

Честота на употреба

4 — Болка и фебрилитет: Рецидивите при болка или фебрилитет могат да се избегне чрез редовно повтаряне на дозата. Дозите се вземат поотделно през интервал не по-малък от 4 часа.

Редовната употреба предотвратява появата на рецидиви при болка и фебрилитет. Дозите се вземат през интервал не по-малък от 4 часа.

Продължителност на употреба: пациентите трябва да са информирани, че в случай на фебрилитет да не употребяват



ацетилсалицилова киселина повече от 3 дни, или 5 дни в случай на болка без консултация с лекар или стоматолог.

- Възпалителни и дегенеративни заболявания на опорно-двигателния апарат: Дневната доза е максимум от ~~4 до 6 g~~ 3 до 6 g дневно, разделени през целия ден на 3-4 приема, приемани през интервал не по-малък от 4 часа.

Указание: ~~Едно саше от 1000 g на всеки 6 часа.~~

Дозировката се редуцира при пациенти в напреднала възраст.

4.3 Противопоказания

Този лекарствен продукт не трябва да се употребява в следните случаи:

- при известна алергия към ацетилсалицилова киселина или към другите помощни вещества,
- анамнеза за астма, предизвикана от употребата на салицилати или субстанции с подобни свойства, по-специално нестероидни противовъзпалителни средства,
- последния триместър от бременността (≥ 500 mg/ доза на ден) (виж. Бременност и кърмене),
- активна пептична язва,
- придобити или органични хеморагични нарушения,
- хеморагичен риск,
- *тежка чернодробна недостатъчност,*
- *тежка бъбречна недостатъчност*
- *неконтролирана тежка сърдечна недостатъчност,*
- в комбинация с метотрексат, ако последния е използван в дози по-високи от 15 mg на седмица (виж Лекарствени взаимодействия)
- в комбинация с перорални антикоагуланти, в случай, че салицилати се използват в големи дози (~~≥ 3 g на ден~~); (виж Лекарствени взаимодействия), особено при лечение на ревматични заболявания.

Ако сте бременна или планирате да забременеете, ацетилсалицилова киселина се използва само след консултация с лекар. При установена бременност по време на употреба на ацетилсалицилова киселина, е необходимо да се консултирате с лекар.

~~Това лекарство не се препоръчва:~~

~~когато се използва съвместно с:~~

- ~~— Перорални антикоагуланти (за аспирин дози < 3 g на ден при възрастни);~~
- ~~— Други нестероидни противовъзпалителни лекарства (при високи дози аспирин ≥ 3 g на ден при възрастни);~~
- ~~— хепарин;~~
- ~~— тиклопидин;~~
- ~~— урикозурични средства~~

~~(виж: Лекарствени и други форми на взаимодействие)~~

~~— по време на кърмене~~

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба.

Предпазни мерки при употреба:

- ~~— Сашета от 1000 mg не са подходящи за деца под 15 години.~~



~~— Употребата на аспирин при пациенти с подагра не е препоръчителна~~

Аспирин се използва много внимателно в случай на:

~~— минали заболявания с гастритна или дуоденална язва или гастроинтестинално кървене~~

~~— бъбречна недостатъчност.~~

~~— астма: при някои пациенти астматичния пристъп може да доведе до алергия към нестероидни противовъзпалителни лекарства или към аспирин, който в този случай е противопоказан.~~

~~— метрорагия или менорагия (риск от обилно и продължително кървотечение по време на менструация)~~

~~— употреба на интраутеринно средство (виж: Лекарствени и други форми на взаимодействия)~~

- При едновременна употреба с други лекарствени средства, и за да се избегне риска от предозиране, е необходимо в състава на лекарствените продукти да не присъства ацетилсалицилова киселина.

- При продължителна употреба на високи дози аналгетици, при поява на главоболие да не се вземат дози по-високи от приеманите.

Редовната употреба на аналгетици, особено комбинация от аналгетици може да доведе до бъбречни лезии с риск от бъбречна недостатъчност.

- При някои случаи на тежки форми на G6PD недостатъчност, високи дози на ацетилсалицилова киселина могат да причинят хемолiza. Употребата на ацетилсалицилова киселина при наличие на G6PD недостатъчност се извършва под медицински контрол.

- Строг медицински контрол се извършва при следните състояния:

- анамнеза за пептична язва, гастрит или гастро-интестинално кървене .

- бъбречна или чернодробна недостатъчност,

- астма: при някои пациенти астматичния пристъп може да е свързан с алергия към нестероидни противовъзпалителни лекарства или към ацетилсалицилова киселина, като в този случай лекарствения продукт е противопоказан,

- метрорагия или менорагия (риск от обилно и продължително кървотечение по време на менструация),

- употреба на интраутеринно средство (виж: Лекарствени и други форми на взаимодействия),

- Гастро-интестинално кървене или язви/перфорация могат да се появят по всяко време на лечението, независимо че симптоми за това не се наблюдават както по време на употребата на лекарствения продукт, така и преди това. Относителния риск се увеличава при пациенти в напреднала възраст, при пациенти с ниско тегло, и пациенти, подлежащи на лечение с антикоагуланти или тромбоцитни инхибитори (виж Лекарствени взаимодействия).

При наличие на гастро-интестинално кървене лечението се прекъсва веднага.

- Независимо, че инхибиторният ефект на ацетилсалициловата киселина върху тромбоцитната агрегация се наблюдава при много ниски дози, и персистира няколко дни след последния прием, препоръчително е пациентите да бъдат предупреждавани за възможен риск от кървене дори и при малки хирургически интервенции (напр. екстракция на зъб).



Ацетилсалициловата киселина променя нивата на пикочна киселина (в аналгетична дози, ацетилсалициловата киселина увеличава нивата на пикочната киселина чрез потискане нейната екскреция; в дози, използвани в ревматологията, ацетилсалициловата киселина има урикозуричен ефект).

При високи дози в ревматологията, е препоръчително да се наблюдава за признаци на предозиране. При наличие на шум в ушите, намаление на слуха или замаяност, дозировката и лечението се коригират.

- Поради наличие на лактоза, този лекарствен продукт е противопоказан при конгенитална галактоземия, глюкозо-галактозен синдром на малабсорбция, или лактазна недостатъчност.

- Ако сте бременна или планирате да забременеете, ацетилсалицилова киселина се използва само след консултация с лекар. При установена бременност по време на употреба на ацетилсалицилова киселина, е необходимо да се консултирате с лекар.

4.5 Лекарствени и други форми на взаимодействие

Поради това, че притежават свойства на тромбоцитни антиагреганти, са описани следните взаимодействия между : ацетилсалицилова киселина и нестероидни противовъзпалителни средства, ticlopidine и clopidogrel, tirofiban, eptifibatid и abciximab, и iloprost.

Поради увеличен риск от кървене, употребата на няколко тромбоцитни антиагреганти, както и комбинацията с хепарин или аналогови средства (hirudin), перорални антикоагуланти и тромболитици, изискват особено наблюдение, осигурявайки постоянен клиничен и лабораторен контрол.

- ПРОТИВОПОКАЗАНИ КОМБИНАЦИИ:

+ **Перорални антикоагуланти** (при високи дози ацетилсалицилова киселина $\geq 3g$ на ден при възрастни): изместване на пероралните антикоагуланти от плазмените протеини.

+ **Метотрексат при дози по-големи от 15 mg на седмица:**

Нарастване на хематологичната токсичност на метотрексата (намален бъбречен клирънс на метотрексата, и изместване на метотрексата от плазмените протеини от ацетилсалициловата киселина.

- Непрепоръчителни комбинации

+ **Перорални антикоагуланти**

Ниски дози ацетилсалицилова киселина: увеличен риск от кървене (потискане функцията тромбоцитите и увреждане на гастроудоденалната мукоза). Изисква се наблюдение, особено времето на кървене.

+ **Други нестероидни противовъзпалителни средства:**

Високи дози ацетилсалицилова киселина (над 3g/дневно): увеличен риск от гастро-интестинално кървене и язви (адитивен синергизъм)



+ Хепарин (парентерална употреба)

Увеличен риск от хеморагия (подтискане на тромбоцитната функция и увреждане на гастродуоденалната мукозна мембрана, резултат от ацетилсалициловата киселина).

За аналгетично и антипиретично действие да се използват средства, различни от ацетилсалициловата киселина, например парацетамол.

+ Урикозурични агенти (benzobromarone, probenecid)

Относно benzobromarone: ацетилсалицилова киселина в дозировка не повече от 3g/дневно. Намаляване на урикозуричния ефект поради отделяне на пикочна киселина в бъбречните тубули.

Да се използва друг аналгетик.

- Комбинации, изискващи предпазни мерки при употреба

+ Антидиабетични средства: инсулин

Увеличен хипогликемичен ефект при високи дози на ацетилсалицилова киселина (поради хипогликемичния ефект на ацетилсалициловата киселина).

Да се информира пациента и да се следят нивата на глюкозата.

+ Диуретици:

При високи дози ацетилсалицилова киселина (над 3g дневно): остра бъбречна недостатъчност при дехидратирани пациенти (намалена гломерулна филтрация, дължаща се на редукция в синтеза на бъбречните простагландини). Следователно и намаляване на антихипертензивния ефект.

Хидратиране на пациента и изследване на бъбречната функция при започване на лечението.

+ Кортикостероиди (глюкокортикостероиди) (системно приложение), други освен хидрокортизон, използван като заместителна терапия при болест на Addison:

Понижени нива на салицилати в кръвта по време на лечение с кортикостероиди и риск от предозиране с ацетилсалицилова киселина след прекъсване на лечението (кортикостероидите ускоряват елиминирането на ацетилсалицилова киселина). Необходимо е коригиране на дозата на ацетилсалицилова киселина по време на едновременната им употреба и след прекъсване на лечението с глюкокортикостероиди.

+ Ангиотензин конвертиращи ензимни инхибитори и ангиотензин II антагонисти:

Високи дози ацетилсалицилова киселина (над 3g/дневно): остра бъбречна недостатъчност при високо-рискови пациенти (в напреднала възраст или при дехидратирани пациенти) поради намалена гломерулна филтрация, причинена от потискане на вазодилаторните простагландини от салицилатите.

Хидратиране на пациента и изследване на бъбречната функция при започване на лечението.

+ Метотрексат при дози по-малки от 15 mg на седмица



Нарастване на хематологичната токсичност на метотрексата (намален бъбречен клирънс на метотрексата, и изместването му от плазмените протеини от ацетилсалициловата киселина)

Веднъж седмично лабораторен контрол на кръвната картина по време на комбинирана употреба през първите няколко седмици. Засилен контрол при пациенти в напреднала възраст и при пациенти с леко отклонение в бъбречната функция.

КОМБИНАЦИИ, ПРИ КОИТО ТРЯБВА ДА СЕ ВНИМАВА:

+ Интраутеринно средство

Високи дози ацетилсалицилова киселина (над 3g/дневно): спорен е въпросът за намаляване сигурността на втутеринната спирава.

+ Антиацити: магнизиеви, алуминииви и калцииви соли, окиси и хидроксицити.

Увеличена бъбречна екскреция на ацетилсалицилова киселина поради алкализация на урината.

4.6 Бременност и кърмене

БРЕМЕННОСТ

Изследвания проведени при животни са доказали тератогенните свойства на ацетилсалициловата киселина.

Първи и втори триместър:

- непостоянна употреба на ацетилсалицилова киселина: резултати от епидемиологични проучвания изключват появата на тератогенни малформации, причинени при употребата на ацетилсалицилова киселина.

- При по-продължително лечение с аспирин:

До сега няма достатъчно данни относно тератогенните свойства на ацетилсалицилова киселина при постоянна употреба в дози над 150 mg на ден по време на първия триместер от бременността.

Следователно:

- Ацетилсалициловата киселина може при необходимост да се предписва в отделни случаи в обичайна дозировка.

- Като предпазна мярка, препоръчително е да се избягва употребата на ацетилсалицилова киселина в доза над 150 mg/дневно при постоянно лечение.

Клинични данни, свързани с фетална токсичност (втори и трети триместер)

По време на 4-тия и 5-тия месец от бременността е направен анализ на голям брой жени, при които приемът на аспирин е бил краткотраен. Резултатите от това проучване не са открили особена токсичност за плода. Въпреки това епидемиологични проучвания могат да докажат липсата на риск при употребата на аспирин през този период

Трети триместер:

Подобно на всички инхибитори на простагландин синтезата, употребата на ацетилсалицилова киселина в дози по-големи или равни на 500 mg/дневно, могат да подложат:

- плода на:



* кардиопулмонарна токсичност с преждевременно затваряне на ductus arteriosus и пулмонарна хипертензия

*бъбречна дисфункция, която може да прогресира до бъбречна недостатъчност с олигохидрамнион.

- майката и бебето (към края на бременността) – увеличено време на кървене. Това потискане на агрегацията на тромбоцитите съществува дори и при много малки дози.

Следователно:

С изключение на много редки случаи (кардиологични или гинекологични), когато се изисква консултация с лекар или специализирано наблюдение, всички лекарствени средства, съдържащи ацетилсалицилова киселина са противопоказани през последния триместър от бременността.

КЪРМЕНЕ

Тъй като ацетилсалициловата киселина преминава в млякото, този лекарствен продукт не се препоръчва по време на кърмене.

4.7 Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Не оказва влияние.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

- Гастроинтестинални реакции:

- коремна болка,
- явно гастроинтестинално кървене (хематемеза, мелена и т.н.) или окултно кървене, водещо до желязо-дефицитна анемия. Тези реакции са по-чести при по-високи дози,
- стомашни улцерации и перфорации.

- Влияние върху централната нервна система:

- главоболие, световъртеж,
 - чувство за намалиние на слуха,
 - шум в ушите,
- Симптоми, характерни при предозиране

- Хематологични реакции:

- синдром на кървене (кървене от носа, гингиворагия, пурпура и т.н.) с увеличаване времето на кървене. Тази реакция продължава от 4 до 8 дни след прекъсване употребата на аспирин. Това може да доведе до риск от кървене в случаи на хирургическа интервенция.

- Реакции на свръхчувствителност

- Уртикария, кожни реакции, астма, анафилактични реакции, ангиоедем.

4.9 Предозиране

Предозирането може да бъде фатално при хора в напреднала възраст особено при малки деца (терапевтично предозиране или честа случайна интоксикация).

+ Клинични симптоми:



Умерено предозиране: симптомите за предозиране са: шум в ушите, чувство за намаление на слуха, световъртеж и главоболие; могат да се контролират чрез намаляване на дозата.

Тежка интоксикация:

Предозирането при деца може да бъде фатално при еднократна доза от 100 mg/kg.

Симптомите са: треска, хипервентилация, кетоацидоза, респираторна алкалоза, метаболитна ацидоза, кома, кардиоваскуларен шок, респираторна недостатъчност, остра хипогликемия.

Лечение:

- Пациента незабавно се отвежда в болница
- Погълнатото лекарство се отстранява бързо чрез промивка на стомаха и прием на активен въглен
- Контрол върху киселинния баланс
- Алкализизиране на урината (pH между 7.5 и 8) с хемодиализа при тежка интоксикация.
- Симптоматично лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

ПЕРИФЕРЕН АНАЛГЕТИК

АНТИПИРЕТИК

ПРОТИВОВЪЗПАЛИТЕЛНО СРЕДСТВО — при високи дози

(N. Централна нервна система)

(M. Локомоторен апарат)

ДРУГИ АНАЛГЕТИЦИ И АНТИПИРЕТИЦИ

ATC N02 BA 01

~~Лизин ацетилсалицилат (LAS), подобно на аспирин, има аналгетично, антипиретично, противовъзпалително и антиагрегантно действие.~~

~~Ацетилсалициловата киселина принадлежи към групата на нестероидните противовъзпалителни средства с аналгетично, антипиретично, противовъзпалително действие.~~

~~LAS действа чрез инхибиране на ензима циклооксигеназа, което води до блокиране синтезата на простагландините (PG) и тромбоксана.~~

~~Неговото действие се базира на инхибиране на ензима циклооксигеназа, което води до блокиране синтезата на простагландините.~~

~~Ацетилсалициловата киселина потиска тромбоцитната агрегация чрез блокиране на тромбоксан A2 тромбоцитната синтеза.~~

~~Аналгетичния ефект има предимно периферен механизъм. Потискане синтезата на PG намалява чувствителността на сетивните нервни окончания към алгогенни медиатори, като ендопероксиди, някои простагландини, брадикинин и др.~~

~~Противовъзпалителния ефект е свързан с потискане синтезата на PG в зоната на възпалението. Инхибира се активността на ензима циклооксигеназа, под влияние на който от арахидоновата киселина се получават ендопероксиди, а от тях простагландини и тромбоксани.~~



~~Антипиретичното му действие е свързано с бързо и ефективно намаляване на телесната температура. Осъществява се чрез потискане на образуването, освобождаването, проникването в ЦНС и действието върху терморегулаторните центрове в хипоталамуса на различни пирогени. Антипиретичният му ефект е свързан и с потискане синтеза на PG.~~

~~LAS има същите свойства като аспирин, но за разлика от него има по-добра стомашно-чревна поносимост поради съдържанието на лизин.~~

5.2 Фармакокинетични свойства

~~След абсорбция lysine acetylsalicylate се разпада на ацетилсалицилова киселина и лизин.~~

~~Ацетилсалициловата киселина се абсорбира бързо и се хидролизира до салицилова киселина в плазмата. Последната се свързва към плазмените протеини. Максималните концентрации в кръвта достигат след 2 или 4 часа. Отделянето в бъбреците се увеличава с pH на урината. Времето на полу-разпад на салициловата киселина е от 3 до 9 часа и зависи от дозата.~~

~~Тъй като DL-lysine acetylsalicylate се разтваря веднага и изцяло във вода, след абсорбция се разпада на ацетилсалицилова киселина.~~

Абсорбция

~~Ацетилсалициловата киселина се абсорбира бързо и изцяло веднага след перорален прием. Максимална плазмена концентрация се достига след 15-40 минути.~~

~~Бионаличността на ацетилсалициловата киселина варира според дозата: около 60 % за дози под 500 mg, и 90 % за дози над 1g поради наситена чернодробна хидролиза.~~

~~Ацетилсалициловата киселина се хидролизира бързо до салицилова киселина (активен метаболит)~~

Разпределение

~~Ацетилсалициловата киселина и салициловата киселина се разпределят бързо в тъканите. Преминават плацетарната бариера и се намират в майчиното мляко.~~

~~Салициловата киселина се свързва с плазмените протеини (около 90 %). Времето на полу-разпад на ацетилсалициловата киселина е 15-20 минути, и за салициловата киселина е от 2 до 4 часа.~~

Метаболизъм – екскреция

~~Ацетилсалициловата киселина се метаболизира изцяло в черния дроб. Отделя се главно в урината под формата салицилова киселина и глюкорониди, както и под формата на salicyluric acid и gentisic киселини.~~

5.3 Предклинични данни за безопасност

~~Мутагенен и карциногенен потенциал.~~

~~Резултатите от проведените ин витро и ин vivo предклинични проучвания с ацетилсалицилова киселина показват липса на мутагенен ефект.~~



В проведените за продължителен период от време проучвания при плъхове и мишки, демонстрират липсата на карциногенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Помощни вещества

Glycine	200 mg
Mandarin flavouring*	40 mg
Ammonium glycyrrhizinate	6 mg

Състав на mandarin flavouring: lactose, orange juice, essential oil of mandarin.

6.2 несъвместимости

Няма

6.3 Срок на годност

3 години

6.3 Специални указания за съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.4 Опаковка

Първична опаковка: хартия, алуминий, полиетилен

Вторична опаковка: картонена кутия

Опаковка от 20 броя сашета.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Sanofi - Synthelabo OTC

9, rue du President Allende

94258 Gentilly Cedex

France

8. ПРОИЗВОДИТЕЛ

SANOFI WINTHROP INDUSTRIE

196, avenue du Marechal Juin

45200 AMILLY

FRANCE

9. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

20020129

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА

13.02.2002

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Януари 2004

