

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВНОКАРАНИЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-4671/08.01.02г.	
616/18.12.01	<i>Делю</i>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ

UPSARIN C

УПСАРИН С

ефервесцентни таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

ACETYLSALICYLIC ACID 0.330 g

ASCORBIC ACID 0.200 g

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ефервесцентна таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични индикации

Симптоматично лечение на лека до умерена болка и/или
фебрилни състояния.

4.2. Дозировка и приложение

Приложение само за възрастни и деца с тегло 30 kg или повече
(около 10 години).

Перорално приложение

Една ефервесцентна таблетка се разтваря напълно в чаша с
подсладена или обикновена вода, мляко или плодов сок и се
изпива веднага.

Редовното приложение води до избягване на флукуациите на
болка или температура. Необходим е интервал от поне 4 часа
между приложенията.



Поради наличието на витамин С, да се избягва приложението в края на деня.

- Лека до умерена болка и/или температурни състояния

Възрастни: максималната дневна доза е 3 g.

По индикация: една или две таблетки от 330 mg като, ако е необходимо дозата се повтаря след 4 часа, без да се превишават девет ефервесцентни таблетки на ден.

Пациенти в напреднала възраст: максималната дневна доза е 2 g.

По индикация: една или две таблетки от 330 mg, като ако е необходимо дозата се повтаря след 4 часа, без да се превишават шест ефервесцентни таблетки на ден.

Деца: максималната дневна доза при деца е 50 mg/kg.

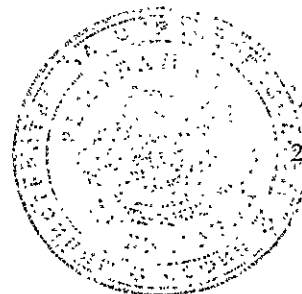
По индикация: между 30 и 50 kg (от 10 до 15 години): една таблетка от 330 mg, като ако е необходимо дозата се повтаря след 4 часа, без да се надвишават шест ефервесцентни таблетки на ден.

Приблизителната възраст по отношение на теглото е указана само ориентировъчно.

4.3. Противопоказания

Лекарството е противопоказано при следните обстоятелства:

- когато се прилага в аналгетични, антипиретични или противовъзпалителни дози (≥ 500 mg на прием дневно), това лекарство е противопоказано в и от шестия месец на бременността.
- известна алергия към салицилатите и вещества с подобна активност: особено нестероидни противовъзпалителни средства,
- активна пептична язва,
- някакво вродено или придобито хеморагично заболяване,
- хеморагичен риск,



- в комбинация с метотрексат, ако последния се употребява в дози надвишаващи 15 mg седмично (виж раздел “Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие”);
- в комбинация с орални антикоагуланти, когато салицилатите се използват във високи дози (≥ 3 g дневно) за лечение на ревматични смущения (виж “Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие”)
- бъбречни камъни по време на употреба на високи дози витамин С (повече от 1 g)

Като общо правило, това лекарство не трябва да се прилага в комбинация с:

- орални антикоагуланти, когато салицилатите се използват в малки дози (< 3 g дневно при възрастни), при лечение на болка или температура,
- други нестероидни противовъзпалителни средства (за високи дози аспирин, т.е. ≥ 3 g дневно при възрастни),
- хепарин,
- тиклопидин,
- урикозурични средства

(виж 4.5. Взаимодействия с други лекарства и други форми на взаимодействия)

Употребата на това лекарство не се препоръчва по време на кърмене.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Предпазни мерки при употреба:



- ефервесцентни таблетки 330 mg се употребяват само при възрастни и деца с тегло 30 kg или повече (около 10 години). За деца под 30 kg. съществуват по-подходящи концентрации.
 - аспирин не се препоръчва при пациенти с подагра
- Аспирин трябва да се прилага с внимание при следните случаи:
- данни в анамнезата за стомашна или дуоденална язва или гастроинтестинални кръвоизливи
 - бъбречно увреждане
 - астма: началото на астматичните пристъпи в определени индивиди може да е свързано с алергия към нестероидни противовъзпалителни средства или към аспирин. В тези случаи лекарството е противопоказано.
 - метрорагия или менорагия (риск от увеличено менструално кръвотечение или продължителност на менструалния период).
 - употреба на интраутеринни приспособления (виж раздел Взаимодействия с други лекарства и други форми на взаимодействия)

С оглед на антиромбоцитното действие на аспирин, което започва при много ниски дози и продължава няколко дни, пациентите са с опасност от хеморагични рискове, които настъпват дори при малки хирургични интервенции (напр. Зъбна екстракция).

Тъй като е бил наблюдаван Reye синдром при деца с вирусни заболявания (особено варицела и грипopodobни заболявания), които са приемали аспирин; като предпазна мярка приложението трябва да се избягва при деца с такива заболявания.



В случай на безсолни или с ниско съдържание на сол диети, съдържанието на натрий:485 mg трябва да се има предвид при дневния прием.

4.5. Взаимодействия с други лекарства и други форми на взаимодействия

ПРОТИВОПОКАЗАНИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

- Орални антикоагуланти

Салицилатите във високи дози (≥ 3 g дневно при възрастни): повишават риска от кръвоизливи (потискат тромбоцитните функции и увреждат гастроинтестиналния тракт в допълнение към изместването на оралните антикоагуланти от местата на свързване с плазмените протеини).

- Метотрексат използван в дози ≥ 15 mg седмично

Увеличена хематологична токсичност на метотрексат (намален бъбречен клирънс на метотрексат причинен от противовъзпалителните средства най-общо и изместване на метотрексат от местата на свързване с плазмените протеини от салицилатите).

КОМБИНАЦИИ, КОИТО НЕ СЕ ПРЕПОРЪЧВАТ

- Орални антикоагуланти

Увеличен риск от кръвоизливи (потискане на тромбоцитните функции и увреждане на гастродуоденалната лигавица).

Салицилати в ниски дози: необходимо е мониториране, особено на времето на кръвене.



- Други НСПВС

(включително салицилати по 3 g дневно или повече при възрастни)

Увеличен риск от разязвявания и гастроинтестинални кръвоизливи (адитивен синергизъм)

-Хепарин

Увеличен риск от кръвоизливи (потискане на тромбоцитните функции и увреждане на гастроинтестиналната лигавица от салицилати).

-Тиклопидин

Увеличен риск от кръвоизливи (синергизъм на антитромбоцитната активност).

Ако комбинацията не може да се избегне е необходимо стриктно клинично и лабораторно мониториране (с измерване на времето на кръвене).

- Урикозурични средства

Benzbromarone, probenecide

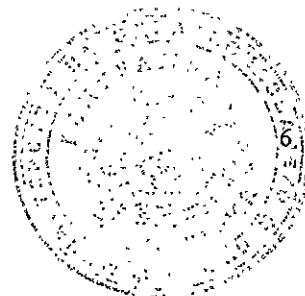
Намален урикозуричен ефект (конкуриране с елиминацията на пикочна киселина в бъбречните тубули).

Да се употребява друг аналгетик.

КОМБИНАЦИИ, ЗА КОИТО СЕ ИЗИСКВАТ ПРЕДПАЗНИ МЕРКИ

-Антидиабетични средства

Insulin, chlorpropamide



Увеличени хипогликемични ефекти при високи дози на ацетилсалицилова киселина (хипогликемично действие на ацетилсалициловата киселина и заместване на антидиабетичните средства от местата на свързване с плазмените протеини).

Пациентите трябва да се информирани и да се изисква стриктно самостоятелно мониториране на нивата на кръвната захар.

- Глюкокортикоиди (прилагани системно)

Намаляване на кръвните нива на салицилатите по време на лечение с кортикостероиди и риск от предозирание със салицилати след спиране на тяхната употреба (тъй като елиминацията на салицилатите се увеличава с кортикостероидите).

Дозите на салицилатите се коригират по време на едновременно приложение на глюкокортикоиди и след като комбинираната терапия се прекъсне.

-Диуретици, АКЕ инхибитори

При високи дози салицилати: остра бъбречна недостатъчност при дехидрирани пациенти (намалена гломерулна филтрация чрез редуцирана синтеза на бъбречни простагландини). В допълнение намален антихипертензивен ефект.

Рехидратиране на пациентите и мониториране на бъбречната функция при започване на терапията.

-Интерферон- α

Действието на интерферон може да се потисне.



Предпочита се използването на несалицилатни аналгетици и антипиретици.

-Methotrexate използван в ниски дози - по-малки от 15 mg/седмично

Увеличава хематологичната токсичност на метотрексат (намалява бъбречния клирънс на метотрексат чрез противовъзпалителни лекарства най-общо и измества метотрексат от местата на свързване с плазмените протеини на салицилатите).

Пълната кръвна картина трябва да се мониторира седмично през първите седмици на комбинираната терапия.

Увеличеното проследяване е необходимо при случай на увреждане, дори леко на бъбречната функция, както и при пациенти в напреднала възраст.

-Pentoxifylline

Увеличен риск от кръвоизлив.

Изисква се стриктно клинично проследяване и често измерване на времето на кръвене.

КОМБИНАЦИИ, КОИТО ТРЯБВА ДА СЕ ИМАТ ПРЕДВИД

-Интраутеринни приспособления

Риск (спорен) от намалена ефективност

-Тромболитици

Увеличен риск от кръвоизливи

-Локални гастроинтестинални лекарства като магнезий, алуминий и калциеви соли, окиси и хидроокиси



Увеличена бъбречна екскреция на салицилатите чрез алкализация на урината.

- Възможни взаимодействия с Дипирадамол, Метоклопрамид, Метопролол, Златни препарати, Сулфанил-уреини хипогликемични средства, Валпроева киселина.

4.6. Бременност и кърмене

БРЕМЕННОСТ

Тератогенният ефект на аспирин е наблюдаван при опити с животни.

Клинични данни, отнасящи се до малформации (първо тримесечие на бременността)

-Аспирин като симптоматично лечение

Резултатите от изследванията изключват ефекти на малформация особено към аспирин, когато се приема през първите месеци на бременността.

-Аспирин при продължителна терапия

Понастоящем няма достатъчно данни за да се оценят малформациите предизвикани от аспирин, когато е прилаган като продължителна терапия в доза повече от 150 mg дневно по време на първите месеци от бременността

Клинични данни, отнасящи се до феталната токсичност (второ и трето тримесечие на бременността):

По време на 4-ти и 5-ти месеци, анализът на големия брой бременности изложени на краткотрайно лечение не е отбелязал особени ефекти на фетална токсичност. Само чрез



епидемиологични изследвания може да се валидизира отсъствието на риск.

По време на 6-тия месец на бремеността, аспирин като аналгетик, антипиретик и противосъзпалително средство в дози (≥ 500 mg на прием дневно), подобно на останалите инхибитори на простагландиновата синтеза, може да изложи:
-плода на:

*кардиопулмонарна токсичност с преждевременно затваряне на артериалния канал и белодробна хипертония;

*бъбречни дисфункции, които могат да доведат до бъбречни увреждания с олигохидрамнион.

-майката и детето в края на бремеността на удължаване времето на кървене

Този антиагрегантен ефект може да се прояви даже и при много ниски дози.

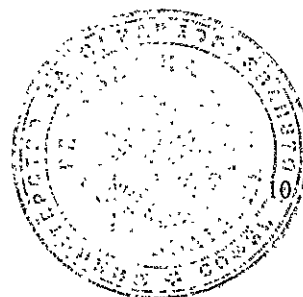
Следователно:

-по време на първите 5 месеци от бремеността:

- аспирин като симптоматично лечение може да се предпише при нужда;
- като предпазна мярка за предпочитане е да не се използва в хронична терапия и в дози надвишаващи 150 mg дневно.

- по време на 6-тия месец от бремеността и след това:
независимо от изключително ограничения брой на кардиологични и гинекологични приложения, които изискват специфично мониториране, всички лекарства съдържащи аспирин са **противопоказани** от 6-ти месец на бремеността.

КЪРМЕНЕ



Не се препоръчва прием на аспирин по време на кърмене, тъй като преминава в кърмата.

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

няма

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

-Ефекти върху централната нервна система:

- шум в ушите
- усещане за намален слух
- главоболие, което обикновено е признак на предозиране

-Гастроинтестинални ефекти:

- стомашни язви
- гастроинтестинални кръвотечения, които са видими (хематемеза, мелена и др.) или окултни и причина за желязо-дефицитна анемия. Колкото по-високи са дозите, толкова по-голяма е честотата на кръвоизливите, които настъпват.

-Хематологични ефекти:

хеморагичен синдром (кървене от носа, кървене на венците, пурпура и др.) с удължено време на кървене. Действието продължава от 4 до 8 дни след като се спре употребата на аспирин. Може да предизвика риск от кървене при пациенти подложени на хирургични операции.

-Реакции на свръхчувствителност:

сенсibiliзирани реакции: едем на Квинке, уртикария, астма, анафилактични реакции.



-Други: коремни болки

-Високи дози витамин С (над 1 g) могат да предизвикат образуване на оксалатни камъни и камъни от пикочна киселина при определени индивиди, като могат да увеличат хемолизата на пациенти с дефицит на G6PD при форми на хронична хемолиза.

4.9. Предозиране

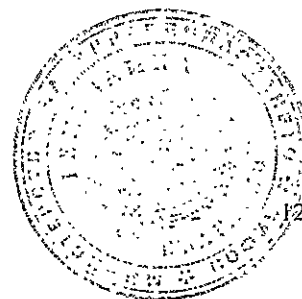
Предозирането се наблюдава при пациенти в напреднала възраст и особено при малки деца (терапевтично свръхдозирание или често наблюдавано инцидентно отравяне) когато може да е фатално.

Клинични симптоми:

- умерено отравяне: шум в ушите, усещане за намален слух, главоболие, вертиго, гадене са симптоми на предозирание и те могат да се контролират чрез намаляване на дозата.
- тежко отравяне: температура, хипервентилация, кетоза, респираторна алкалоза, метаболитна ацидоза, циркулаторен колапс, дихателна недостатъчност, значима хипогликемия.

Лечение:

- незабавен прием в болница,
- бързо елиминиране чрез стомашна промивка на погълнатите количества
- мониториране на алкално-киселинното равновесие,
- форсирана алкална диуреза и хемодиализа или перитонеална диализа ако е необходимо
- симптоматично лечение



5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Периферен АНАЛГЕТИК

АНТИПИРЕТИК

(N. Централна нервна система)

Ацетилсалицилова киселина:

Ацетилсалициловата киселина има антипиретични, аналгетични, противовъзпалителни и антиревматични ефекти. Тя проявява тези ефекти чрез потискане на ензимната продукция на простагландини и освобождаването им от клетките. Ацетилсалициловата киселина може също да потиска активирането и функцията на неутрофилите в техните антиревматични действия.

Аскорбинова киселина (Витамин С):

Попълва нуждите на организма от аскорбинова киселина.

Недостигът на аскорбинова киселина предизвиква скорбут, който при възрастните се проявява с гингивит, придружен с кръвоизливи с различни локализации.

Аскорбиновата киселина участва също така при различните клетъчно-оксидоредукционни реакции.

5.2. Фармакокинетични особености

Ацетилсалицилова киселина:

Ацетилсалицилова киселина се хидролизира в плазмата до активен метаболит, салицилова киселина. Салициловата киселина се свързва екстензивно с плазмените протеини.

Пикови плазмени концентрации се достигат след 2 до 4 часа.

Елиминирането чрез урината увеличава рН на урината.

Полуживотът на салициловата киселина е от 3 до 9 часа и е дозо-зависим.



Витамин С - резорбира се добре. Ако се преима в по-големи количества от необходимото, излишъкът се елиминира с урината.

5.3 ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Тъй като активните съставки – ацетилсалицилова киселина и аскорбинова киселина са известни отдавна и се прилагат при хора от много години, предклинични данни за безопасност не са приложени.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Помощни вещества

Glycine

Anhydrous citric acid

Sodium hydrogen carbonate

Sodium benzoate

Polyvidone

За една ефервесцентна таблетка с гелителна черта от 3.501 g

Една ефервесцентна таблетка съдържа 485 mg натрий.

6.2. Несъвместимости

Няма

6.3. Срок на годност

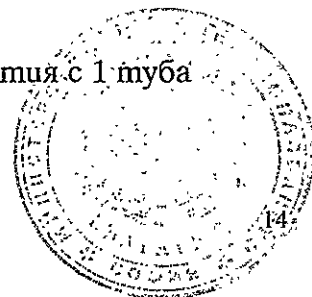
3 години

6.4. Специални мерки за съхранение

Да се съхранява под 25°C.

6.5. Данни за опаковката

Туби (полипропиленови) с по 10 таблетки, кутия с 1 туба



Туби (полипропиленови) с по 10 таблетки, кутия с 2 туби

6.6. Указания за употреба

Няма специални изисквания

7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

Laboratoires UPSA – a Bristol-Myers Squibb Company

8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Bristol-Myers Squibb Company, USA

9. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

МАРТ 1992 Г.

11. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

2000 Г.

