

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Acetylin C 400mg/240 mg effervescent tablets
Ацетилин С 400mg/240 mg ефервесцентни таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Активни вещества в една таблетка:
Ацетилсалицилова киселина (*acetylsalicylic acid*) 400 mg
Аскорбинова киселина (*ascorbic acid*) 240 mg

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ефервесцентна таблетка.
Външен вид - бяла или почти бяла таблетка.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Симптоматично лечение на заболявания и състояния, придружени с лек до умерен болков синдром и/или фебрилитет:

- главоболие, зъбобол;
- мускулни и ставни болки;
- остри възпалителни заболявания на горните дихателни пътища, вирусни инфекции, грип.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Продуктът е предназначен за перорално приложение. Таблетките се разтварят във вода преди употреба. Препоръчително е да се приемат по време или непосредствено след хранене.

Възрастни

Препоръчвана дневна доза – 1-2 таблетки, 3-4 пъти дневно.

Максимална дневна доза – 10 таблетки (общо съдържание на ацетилсалицилова киселина 4 g).

Деца над 12 годишна възраст

Препоръчвана еднократна доза - 15 mg/kg ацетилсалицилова киселина на всеки 6 часа или 10 mg/kg на всеки 4 часа (1 ефервесцентна таблетка).

Препоръчваната дневна доза - 60 mg/kg ацетилсалицилова киселина, разпределена в 4-6 равномерни приема (3-4 ефервесцентни таблетки).

Препоръчва се 400 mg ацетилсалицилова киселина като еднократна доза, съответстваща на 1 ефервесцентна таблетка.

Продължителност на приложение - средно 3 дни в случаите, при които се прилага като антипиретично средство и средно 5 дни като аналгетично средство.

Ацетилин С не трябва да се прилага при пациенти под 12 годишна възраст, освен по изрично лекарско предписание.

По-голяма продължителност на лечение се допуска след лекарско назначение.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активните вещества, други салицилати или към някое от помощните вещества на продукта;

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20110360
Разрешение №	14094 / 26. 07. 2011
Одобрение №	/



- Активна стомашна или дуоденална язва и/или анамнеза за скорошна гастро-интестинална хеморагия;
- Хеморагична диатеза, хемофилия, тромбоцитопения;
- Бронхиална астма „аспиринов“ тип или индуцирана от приложение на салицилати, други подобни субстанции, особено нестероидни противовъзпалителни средства;
- Едновременно приложение с метотрексат в дози 15 mg/седмично или по-високи;
- Тежка бъбречна недостатъчност;
- Тежка чернодробна недостатъчност;
- Тежка сърдечна недостатъчност;
- Първи и последен триместър на бременността;
- Деца под 12 годишна възраст.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Продуктът се прилага с внимание и след преценка на съотношението очаквана полза/потенциален риск при пациенти:

- на антикоагулантно лечение;
- с анамнестични данни за язви на гастро-интестиналния тракт, в това число хронична и/или рецидивираща язвена болест, както и при анамнеза за гастро-интестинални хеморагии;
- с бъбречни заболявания, при които е налице нарушение на бъбречната функция и такива с нарушена чернодробна функция;
- с известна свръхчувствителност към нестероидни противовъзпалителни средства, други антиревматични средства или други атопии.

Поради опасност от развитие на синдрома на Reye, този продукт, както и други, съдържащи ацетилсалицилова киселина, трябва да се прилагат при деца и подрастващи с особено внимание. При деца под 12 годишна възраст приложението на този продукт може влезе в съображение единствено, в случай, че други антипиретични средства, приложени в подходяща доза и продължителност са били неефективни.

Ацетилсалициловата киселина може да предизвика бронхоспазъм, астаматичен пристъп или други реакции на свръхчувствителност. Този риск е по-висок при пациенти с бронхиална астма, сенна хрема, назална полипоза или някои хронични белодробни заболявания, както и при лица с пруритус, уртикария или други кожни заболявания, свързани със свръхчувствителност към други алергени.

Ацетилсалициловата киселина, поради инхибиторния си ефект върху агрегацията на тромбоцитите, може да доведе до повишена склонност към кървене и до кръвоизливи по време и след хирургични интервенции, вкл. малки хирургични операции като зъбна екстракция.

При пациенти с подагра или такива с понижена екскреция на пикочна киселина е възможно ацетилсалициловата киселина да провокира подагрозен пристъп, в резултат на намалена екскреция на пикочната киселина.

Продуктът съдържа 231 mg натрий в една таблетка, което следва да бъде взето пред вид при лечение на пациенти с контролирана диета на натрий.



4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие
Лекарствени комбинации, които са противопоказани

Метотрексат, прилаган в дози > 15 mg/седмично

Противовъзпалителните средства понижават бъбречния клирънс на метотрексат, водят до изместването му от мястото на свързване с плазмените протеини, в резултат на което се повишават плазмените му концентрации и се усилва неговото хематотоксично действие.

Лекарствени комбинации, изискващи особено внимание

Метотрексат, прилаган в дози < 15 mg/седмично

Противовъзпалителните средства понижават бъбречния клирънс на метотрексат, водят до изместването му от мястото на свързване с плазмените протеини, в резултат на което се повишават плазмените му концентрации и се усилва неговото хематотоксично действие.

Кумаринови антикоагуланти и хепарин

Ацетилсалициловата киселина инхибира агрегацията на тромбоцитите, оказва улцерогенен ефект върху гастро-дуоденалната лигавица и води до изместване на оралните антикоагуланти от местата им на свързване с плазмените протеини, поради което при едновременно приложение е налице повишен риск от хеморагии.

Лекарствени продукти, съдържащи салицилати и прилагани във високи дози

Повишен риск от образуване на язви и гастро-интестинални хеморагии в резултат на синергичен ефект.

Бензбромарон, пробенецид и други урикозурични средства

Налице е понижен урикозуричен ефект, дължащ се на конкурентно елиминиране на пикочната киселина на ниво бъбречна тубулна екскреция.

Дигоксин

Повишени плазмени концентрации и увеличаване на риска от дигоксिनска интоксикация в резултат на намалената му тубулна екскреция.

Орални антидиабетни продукти и инсулин

Ацетилсалициловата киселина води до изместването им от мястото на свързване с плазмените протеини, в резултат на което може да настъпи хипогликемия. Ацетилсалициловата киселина притежава също известен хипогликемичен ефект. Необходимо е да влезе в съображение корекция на дозата на антидиабетните продукти.

Тромболитици и други антитромбоцитни агенти

При едновременно приложение с ацетилсалицилова киселина се удължава времето на кървене и е налице повишен риск от хеморагии.

Диуретици в комбинация с ацетилсалицилова киселина, в дневна доза ≥ 3 g

Намалена гломерулна филтрация в резултат на намаленото образуване на простагландини.

Глюкокортикостероиди за системно приложение, с изключение на такива прилагани за субституция при Адисонова болест

В хода на лечението с кортикостероиди е възможно понижение на плазмените концентрации на ацетилсалициловата киселина. Едновременното им приложение повишава риска от стомашно-чревни нежелани реакции.

АСЕ-инхибитори

Приложението на ацетилсалицилова киселина в дневни дози > 3g води до понижаване на гломерулната филтрация в резултат на намалено образуване на вазодилаторните простагландини. Допълнително се понижава антихипертензивния ефект на едновременно приеманите с нея антихипертензивни средства.

Валпроева киселина

Валпроевата киселина може да инхибира тромбоцитната агрегация, поради което при едновременно приложение с ацетилсалицилова киселина се повишава рискът от



хеморагии.

Поради изместване на валпроевата киселина от местата на свързване с плазмените протеини съществува риск от повишени плазмени концентрации и интоксикация с валпроева киселина

Алкохол

Повишен риск от увреждане на стомашната мукоза и удължаване времето на кръвене поради адитивен ефект.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Данните от проведени епидемиологични проучвания показват корелация между употребата на салицилати в първия триместър на бременността и повишен риск от малформации (незатваряне на твърдото небце, вълча уста, сърдечни малформации). При прием на препоръчаните терапевтични дози вероятно този риск не е висок. Салицилатите трябва да се приемат по време на бременността само след внимателна преценка на съотношението риск-полза.

Приложението на продукта във високи дози (над 300 mg дневно) в последния триместър на бременността може да доведе до удължаване на бременността, преждевременно затваряне на ductus arteriosus, потискане на маточните контракции, повишена склонност към кръвоизливи от страна на майката и детето, а приложението непосредствено преди раждането може да предизвика интракраниални кръвоизливи, особено при недоносени. Ацетилсалициловата киселина е противопоказана по време на трето тримесечие на бременността.

Кърмене

Салицилатите преминават в майчиното мляко в малки количества. До момента няма данни за поява на нежелани реакции при новородени след случайна употреба на продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина, поради което прекъсването на кърменето не е задължително.

При по-продължителен прием или лечение с високи дози, кърменето следва да се преустанови своевременно.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са наблюдавани неблагоприятни ефекти върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции в повечето случаи са дозо-зависими. Някои от тях се свързват с по-продължително приложение в дневни дози по-големи от 1g.

Следната терминология е била използвана при класифицирането на нежеланите ефекти по отношение на тяхната честота: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ to $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1,000$ to $< 1/100$), редки ($\geq 1/10,000$ до $< 1/1,000$), много редки ($< 1/10,000$), неизвестни (честотата не може да бъде определена от наличните данни)

Стомашно-чревни нарушения

Чести - коремна болка, киселини, диспепсия, гадене, повръщане, метеоризъм и коремен дискомфорт.

Нечести – хематемеза, мелена, окултни кръвоизливи, които могат да доведат до желязо-дефицитна анемия. Срещат се по-често при прием на високи дози. Могат да се наблюдават стомашно-чревни улцерации и перфорация.

Хепато-билиарни нарушения

Единични случаи – изолирани случаи на чернодробни функционални нарушения

Нарушения на нервната система



Нечести – световъртеж, шум в ушите, главоболие, сънливост. Обикновено се наблюдават при предозиране.

Нарушения на кръвта и лимфната система

Чести – тромбоцитопения и повишен риск от кръвоизливи в резултат на потискане на агрегацията на тромбоцитите

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Редки – потискане на бъбречната функция.

Неизвестни – бъбречна папиларна некроза.

Нарушения на имунната система

Чести - уртикария, кожни реакции на свръхчувствителност, анафилактични реакции, астма, оток на Квинке.

Изследвания

Много редки - повишени стойности на пикочна киселина и урея.

4.9 Предозиране

Предозирането (терапевтично или инцидентно) с ацетилсалицилова киселина може да доведе до интоксикация, която да бъде сериозна при лица в напреднала възраст и малки деца, като в някои случаи може да има фатален изход.

Клинични симптоми

Умерено тежка интоксикация – шум в ушите, нарушения на слуха, главоболие, световъртеж, обърканост. Корекцията на приеманата доза води до намаляване на силата им или до тяхното изчезване.

Тежка интоксикация – треска, хипервентиляция, кетоацидоза, респираторна алкалоза, метаболитна ацидоза, кома, сърдечно-съдов колапс, дихателна недостатъчност, тежка хипогликемия.

Лечение

Незехавна хоспитализация, стомашна промивка и прием на активен въглен, мониториране на показателите на алкално-киселинното равновесие, алкализирание на урината (рН на урината между 7.5-8), форсирана алкализирания диуреза при плазмени салицилови концентрации над 500 mg/l (3.6 mmol/l) при възрастни и 300 mg/l (2.2 mmol/l) при деца, хемодиализа, възстановяване на водния баланс, подходящо симптоматично лечение.

5 ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Нервна система, други аналгетици и антипиретици

АТС код: N02BA51

Ацетилсалициловата киселина оказва своето действие в резултат на директно инхибиране на ензима циклооксигеназа и намаляване образуването на прекурсори на простагландини и тромбоксани от арахидоновата киселина в мястото на възпаление, стимулиране отделянето на бета-ендорфини, потискане синтеза на ендогенни алгогени, понижаване прага на възбудимост в таламуса и провеждането на болкови екстеро- и интероцептивни импулси в ЦНС, влияние върху хипоталамуса и формирането на ендогенни пирогени.

Приложена в дневни дози между 0.3 и 1.0 g притежава изразен аналгетичен ефект, като повлиява болка произхождаща от екстероцептивните рецептори. Притежава и изразено противовъзпалително действие, приложена в дози между 4 и 8 g дневно.

Ацетилсалициловата киселина инхибира тромбоцитната агрегация, блокирайки синтеза на тромбоксан А2 в тях. Този ефект е най-силно изразен след прием на дневни дози между 75 и 300 mg дневно.



Аскорбиновата киселина като редокси-съединение е регулатор на окислително-редукционните процеси в организма. Необходима е за тъканното дишане. Участва във въглехидратната обмяна и тази на аминокиселините, в синтеза на стероиди в надбъбрека, активиране на протромбина и усвояването на желязото. Стимулира синтеза на специфични противомикробни антитоксини, повишава съдържанието на серумния комплемент, имащ значение за имунните процеси. Притежава положителен ефект върху левкоцитния имунен отговор.

Дневните нужди се повишават при тежък и изтощителен труд, при пушачи, инфекциозни болести.

5.2 Фармакокинетични свойства

Ацетилсалициловата киселина се резорбира бързо и пълно в гастро-интестиналния тракт след перорално приложение. По време и след резорбцията се конвертира в своя основен метаболит салицилова киселина. Максимални плазмени концентрации на ацетилсалицилова киселина се достигат 10-20 минути след приема, а за салициловата киселина – 0.3 – 2 часа след приема. Храната не повлиява бионаличността на ацетилсалициловата и салицилова киселина, но забавя резорбцията.

Ацетилсалициловата и салициловата киселина се свързват здраво и в значителна степен с плазмените протеини (50-80%), разпределят се бързо в телесните тъкани и течности. Елиминира се чрез чернодробен метаболизъм, като образуваните метаболити са салицилпикочна киселина, салицил фенолов глюкуронид, гентизинова киселина и гентизинпикочна киселина. Метаболизира се главно от чернодробните естерази чрез хидролиза и в по-малка степен в плазмата и еритроцитите. Естеразната активност е намалена при чернодробни заболявания и алкохолизъм.

Кинетиката на елиминиране на салициловата киселина показва зависимост от приложената доза, поради това че метаболизмът се лимитира от капацитета на чернодробните ензими. Времето на полуживот е между 2 и 3 часа след прием на ниски дози и до около 15 часа при прием на високи дози. Салициловата киселина и нейните метаболити се екскретират главно чрез бъбреците – гломерулна филтрация, активна тубулна секреция и пасивна тубулна реабсорбция. Алкализирането на урината води до увеличаване на уринната екскреция. Салициловата киселина се открива в кърмата и преминава през плацентата.

Аскорбиновата киселина се резорбира почти напълно в гастро-интестиналния тракт. Максимални плазмени концентрации се достигат между 1-ви и 4-ти час. Разпределя се интензивно във всички клетки на тялото. Свързва се с плазмените протеини в около 25%. Метаболизира се в черния дроб до дехидроаскорбинова киселина. Преминава през плацентата и се излъчва в кърмата. Елиминира се основно с урината, количеството на екскретираното с урината количество се увеличава при дневен прием надвишаващ 100 mg.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Ацетилсалициловата киселина е слабо токсична. Стойностите на LD₅₀ след перорално приложение са както следва:

Мишки – 250 mg/kg

Плъхове – 200 mg/kg

При продължително многократно дозиране са установени промени в бъбречния паренхим и гастро-интестиналната лигавица.

Няма данни за мутагенна активност и канцерогенно действие.

Има данни за ембриотоксично и тератогенно действие – предизвиква повишен брой фетусни резорбции, гръбначно-мозъчни фисури, незатваряне на твърдото небце, малформации на паренхимни органи.



Няма данни за ембриотоксично и тератогенно действие на аскорбиновата киселина, както и за мутагенна активност.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Безводна лимонена киселина
Безводен натриев дихидроген цитрат
Натриев хидроген карбонат
Манитол
Пропилен гликол
Безводен силициев диоксид
Фумарова киселина
Полоксамер
Бехеноил полиоксил глицериди

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

2 (две) години.

6.4 Специални условия на съхранение

При температура под 25° С.
Тубата да се затваря плътно, за да се предпазва от влага.
Да се съхранява на място недостъпно за деца.

6.5 Данни за опаковката

Полипропиленови туби с десикант, съдържащи 10 таблетки; кутия с 1 туба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Не са известни.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Юни 2011

