

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРНА ЗАДА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20050906
Разрешение №	30875 / 09-09-2015
Одобрение №	

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АСПИРИН 500 mg таблетки  
ASPIRIN 500 mg tablets

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 500 mg ацетилсалицилова киселина (acetylsalicylic acid)

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка.

Бяла, кръгла таблетка, означена от едната страна с кръста на BAYER, а от другата с - „Аспирин 0,5“.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1 Терапевтични показания

За облекчение на симптомите при главоболие, зъбобол, болки в гърлото, менструални болки, болки в мускулите и ставите, болки в гърба, лека артритна болка.

При простуда или грип за симптоматично лечение на болка и повишена телесна температура.

#### 4.2 Дозировка и начин на приложение

##### Дозировка

Възрастни:

500 – 1000 mg като еднократна доза (което съответства на 1 – 2 таблетки), която може да се повтори на интервали от 4 – 8 часа. Максималната дневна доза от 4 g не трябва да се превишава.

Аспирин 500 mg не трябва да се приема повече от 3 дни без консултация с лекар.

##### Начин на приложение

За перорално приложение.

За предпочитане е таблетките да се вземат след хранене, с голямо количество течност.

#### 4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към ацетилсалицилова киселина, към други салицилати или към някои от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- остри стомашно-чревни язви;
- наличие на хеморагична диатеза;
- наличие на анамнестични данни за астма, предизвикана от прилагане на салицилати или други субстанции с подобно действие, преди всичко нестероидни противовъзпалителни лекарства;
- комбинация с метотрексат при дози от 15 mg/седмично или повече (вижте точка 4.5);
- през последното тримесечие от бременността;
- тежка бъбречна недостатъчност;



- тежка чернодробна недостатъчност;
- тежка неконтролируема сърдечна недостатъчност.

Ацетилсалицилова киселина не трябва да се прилага при пациенти под 16 годишна възраст, освен по изрично лекарско предписание.

#### 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Ацетилсалицилова киселина може да се използва при следните обстоятелства само след строга преценка на отношението полза/риск:

- свръхчувствителност към други аналгетици, противовъзпалителни или антиревматични лекарства и в присъствие на други алергени;
- анамнестични данни за стомашно-чревни язви, включително хронична или рецидивираща (повтаряща се) язвена болест или анамнестични данни за кървене от стомашно-чревния тракт;
- при едновременно лечение с антикоагулантни средства (вж. точка 4.5 „Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие“);
- нарушена чернодробна функция;
- пациенти с нарушена бъбречна функция или пациенти с нарушена сърдечно-съдова циркулация (напр. бъбречно съдово заболяване, конгестивна сърдечна недостатъчност, хиповолемия, голяма операция, сепсис или големи хеморагични събития), тъй като ацетилсалициловата киселина може допълнително да повиши риска от бъбречно увреждане или остра бъбречна недостатъчност;

Ацетилсалициловата киселина може да провокира появата на бронхоспазъм и да предизвика астматични пристъпи или други реакции на свръхчувствителност. Рискови фактори са настояща бронхиална астма, сенна хрема, полипи в носа или хронична обструктивна белодробна болест. Това се отнася също и за пациенти с алергични реакции (напр. кожни реакции, сърбеж, уртикария) към други субстанции.

Вследствие на задържащия си ефект върху агрегацията на тромбоцитите, който продължава до няколко дни след приема, ацетилсалициловата киселина може да доведе до тенденция за повишено кървене по време и след хирургична операция (вкл. малки операции, напр. екстракции на зъб).

При ниски дози ацетилсалициловата киселина намалява отделянето на пикочна киселина. Това може да отключи подагра у пациенти, които имат вече склонност към намалено екскретиране на пикочна киселина.

Лекарствени продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина, не трябва да се използват при деца и юноши при наличие на вирусни инфекции с или без повишена температура, без консултация с лекар. При определени вирусни заболявания, особено грип А, В и варицела, съществува риск от развитие на синдром на Рей – много рядко, но сериозно заболяване, изискващо незабавна медицинска помощ. Рискът може да се увеличи, ако ацетилсалицилова киселина се приема при тези заболявания, въпреки че не е доказано наличие на такава връзка. Появата на продължително повръщане при тези заболявания може да е признак на синдром на Рей.

При пациенти, страдащи от тежък глюкозо-6-фосфат дехидрогеназен дефицит (G6PD), ацетилсалициловата киселина може да предизвика хемолиза или хемолитична анемия. Фактори, които могат да увеличат риска от хемолиза са напр. високи дози, треска или остри инфекции.

#### 4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

##### **Противопоказани взаимодействия:**

**Метотрексат, прилаган в дози от 15 mg/седмично или повече:**

Повишена хематологична токсичност на метотрексат (намален бъбречен клирънс на метотрексат от противовъзпалителни агенти най-общо и изместване на метотрексат при свързването му с плазмени протеин от салицилатите) (вижте точка 4.3).

##### **Комбинации, изискващи специално внимание при прилагане:**

**Метотрексат, прилаган в дози под 15 mg/седмично:**



Повишена хематологична токсичност на метотрексат (намален бъбречен клирънс на метотрексат от противовъзпалителни агенти най-общо и изместване на метотрексат от свързването му с плазмения протеин от салицилатите).

**Антикоагуланти, тромболитици/други инхибитори на тромбоцитната агрегация/хемостатици:**  
Повишен риск от кървене.

**Други нестероидни противовъзпалителни продукти със салицилати при високи дози:**  
Повишен риск от язви и кървене от стомашно-чревния тракт вследствие на синергичния ефект.

**Селективни инхибитори на обратимото захващане на серотонинна (SSRI):**  
Повишен риск от кървене от горните отдели на стомашно-чревния тракт поради възможен синергичен ефект.

**Дигоксин:**  
Плазмените концентрации на дигоксина се повишават вследствие намаляване отделянето през бъбреците.

**Антидиабетични продукти, в т. ч. инсулин, сулфанилурейни средства:**  
Повишен хипогликемичен ефект при високи дози ацетилсалицилова киселина посредством хипогликемичното действие на ацетилсалициловата киселина и изместване на сулфанилурейните средства от свързването им с плазмените протеини.

**Диуретици в комбинация с ацетилсалицилова киселина при високи дози:**  
Понижена гломерулна филтрация чрез понижен бъбречен синтез на простагландини.

**Системни глюкокортикоидни средства, с изключение на хидрокортизона, използван като заместваща терапия при болестта на Адисон:**  
Понижените нива на салицилатите в кръвта по време на лечението с кортикостероиди поради повишено елиминиране на салицилати от кортикостероиди и риск от салицилатно предозиране след спиране на това лечение.

**Инхибитори на ангиотензин конвертиращия ензим в комбинация с високи дози ацетилсалицилова киселина:**  
Намалена гломеруларна филтрация чрез инхибиране на вазодилаторните простагландини и оттам намален антихипертензивен ефект.

**Валпроева киселина:**  
Повишена токсичност на валпроевата киселина вследствие на изместването ѝ от мястото на свързване с плазмените протеини.

**Алкохол:**  
Повишено увреждане на стомашно-чревната лигавица и удължено време на кървене вследствие допълнителните ефекти на ацетилсалициловата киселина и алкохола.

**Урикозурични средства, като бензбромарон, пробенецид:**  
Понижен урикозуричен ефект (конкурентност на елиминация на пикочна киселина през бъбречните тубули).

#### **4.6 Фертилитет, бременност и кърмене**

##### **Бременност**

Инхибирането на простагландиновия синтез може да повлияе неблагоприятно на бременността и/или ембрионалното/фетално развитие. Данни от епидемиологични проучвания предполагат увеличен риск от аборт и малформации след употребата на инхибитор на простагландиновия синтез в ранна бременност. Счита се, че рискът се увеличава с дозата и продължителността на лечение. Наличните данни не подкрепят връзката между приема на ацетилсалицилова киселина и повишен риск от



помятане. За ацетилсалициловата киселина наличните епидемиологични данни относно малформации не са еднозначни, но повишен риск от гастросхизис не може да се изключи. Едно проспективно изпитване с експозиция при ранна бременност (1-ви – 4-ти месец) на около 14 800 двойки майка-дете не установява никаква връзка с повишената честота на малформации.

Изпитвания с животни показват репродуктивна токсичност (вж „Предклинични данни за безопасност“).

Лекарствени продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина не трябва да се използват по време на първо и второ тримесечие на бременността, освен ако не е абсолютно необходимо. Ако лекарствени продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина се използват от жена, опитваща се да забременее, или по време на първо и второ тримесечие на бременността, дозата трябва да е възможно най-ниска и продължителността на лечение да е възможно най-кратка.

**По време на трето тримесечие всички инхибитори на простагландиновия синтез може да причинят на фетуса:**

- кардиопулмонална токсичност (с преждевременно затваряне на дуктус артериозус и белодробна хипертония);
- бъбречна дисфункция, която може да прогресира до бъбречна недостатъчност с олигохидроамниоза

**Инхибитори на простагландиновия синтез могат да изложат и майката и детето, в края на бременността, на:**

- възможно удължаване на времето на кървене - антикоагулационен ефект, който може да се появи дори след много ниски дози
- потискане на маточните контракции, което да доведе до забавено и продължително раждане

Следователно ацетилсалициловата киселина е противопоказана по време на третото тримесечие на бременността.

#### Кърмене

Салицилатите и техните метаболити преминават в майчиното мляко в малки количества. Тъй като досега не са наблюдавани нежелани реакции при новородени след краткотрайна употреба, обикновено не е наложително прекъсване на кърменето. При редовен прием на високи дози, кърменето трябва да се прекъсне своевременно.

#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Аспирин не повлиява или повлиява пренебрежимо способността за шофиране и работа с машини.

#### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

Изброените нежелани лекарствени реакции (НЛР) се основават на спонтанни постмаркетингови доклади за всички разновидности на Аспирин, включително за перорално кратко- и дългосрочно лечение, поради това не е подходящо групиране според трите категории на честота CIOMS.

Нарушения на горната и долна част на стомашно-чревния тракт, като чести признаци и симптоми на диспепсия, стомашно-чревна и коремна болка, рядко – стомашно-чревно възпаление, стомашно-чревна язва, потенциално, но много рядко, водеща до хеморагична стомашно-чревна язва и перфорация, със съответните лабораторни и клинични признаци и симптоми.

Поради своя инхибиторен ефект върху тромбоцитите, ацетилсалициловата киселина може да бъде свързана с повишен риск от кървене. Наблюдавано е кървене, като периперативен кръвоизлив, хематоми, епистаксис, уrogenитално кървене, кървене от венците. Рядко до много рядко са докладвани сериозни кръвоизливи, като стомашно-чревен кръвоизлив, мозъчен кръвоизлив (особено



при пациенти с неконтролирана хипертония и/или на съпътстващо лечение с антихемостатици), които в единични случаи могат да са потенциално животозастрашаващи.

Кръвоизливът може да причини остра и хронична постхеморагична анемия/желязо-дефицитна анемия (поради напр. скрито микрокръвене) със съответните лабораторни и клинични признаци и симптоми, като астения, бледност, хипоперфузия.

Реакции на свръхчувствителност със съответните лабораторни и клинични прояви включват астма синдром, леки до умерени реакции потенциално засягащи кожата, дихателните пътища, стомашно-чревния тракт и сърдечно-съдовата система, включително симптоми като обрив, уртикария, оток, сърбеж, ринит, назална конгестия, сърдечно-респираторен дистрес, и много рядко, тежки реакции, включително анафилактичен шок.

Много рядко се съобщава за преходно чернодробно нарушение с повишаване на чернодробните трансминази.

Докладвани са световъртеж и шум в ушите, които може да са признак на предозиране.

Хемолиза и хемолитична анемия са докладвани при пациенти с тежък глюкозо-6-фосфат дехидрогеназен дефицит (G6PD).

Бъбречно увреждане и остра бъбречна недостатъчност са докладвани също така.

#### Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев” № 8

1303 София

тел.: +359 2 8903417

уебсайт: [www.bda.bg](http://www.bda.bg)

## 4.9 Предозиране

Салицилатната токсичност (> 100 mg/kg/дневно в продължение на 2 дни може да предизвика токсичност) може да е резултат от хронична, терапевтично придобита интоксикация и от потенциално животозастрашаващи остри интоксикации (предозиране), вариращи от случайно поглъщане при деца до случайни интоксикации.

**Хроничното** отравяне със салицилати може да бъде скрито, тъй като признаците и симптомите са неспецифични. Лека хронична салицилатна интоксикация, или салицилизъм, обикновено се появява едва след многократна употреба на големи дози. Симптомите включват замайване, световъртеж, шум в ушите, глухота, изпотяване, гадене и повръщане, главоболие, и объркване, и могат да се контролират чрез намаляване на дозата. Шум в ушите може да се появи при плазмени концентрации от 150 до 300 микрограма/ml. По-сериозни нежелани реакции се появяват при концентрации над 300 микрограма/ml.

Типична характеристика на **остра интоксикация** е тежко нарушение на киселинно-алкалния баланс, който може да варира с възрастта и тежестта на интоксикация. Най-честата проява при деца е метаболитна ацидоза. Тежестта на отравяне не може да бъде оценена само от плазмената концентрация. Абсорбцията на ацетилсалицилова киселина може да бъде забавена поради намаляване на изпразване на стомаха, образуване на конкреции в стомаха или в резултат на поглъщане на стомашно-устойчиви таблетки. Мерките, които трябва да се вземат при интоксикация с ацетилсалицилова киселина се определят от степента, етапа и клиничните симптоми и в съответствие



със стандартните техники при отравяне. Първите мерки трябва да бъдат ускорено отделяне на лекарството, както и възстановяване на електролитния и киселинно-алкалния метаболизъм.

Поради комплексните патофизиологични ефекти на салицилатното отравяне, признаците и симптомите/открития при клинични изпитвания могат да включват:

Признаци и симптоми	Открития при клинични изпитвания	Терапевтични мерки
<b>Лека до средна интоксикация</b>		Стомашна промивка, многократно приложение на активен въглен, форсирана алкална диуреза
Тахипнея, хипервентилация, респираторна алкалоза	Алкалемия, алкалурия	Възстановяване на водно-електролитния баланс
Диафореза		
Гадене, повръщане		
<b>Средна до тежка интоксикация</b>		Стомашна промивка, многократно приложение на активен въглен, форсирана алкална диуреза, хемодиализа в тежки случаи
Респираторна алкалоза с компенсаторна метаболитна ацидоза	Ацидемия, ацидурия	Възстановяване на водно-електролитния баланс
Хиперпирексия		Възстановяване на водно-електролитния баланс
Респираторни: варират от хипервентилация, некардиогенен белодробен оток до респираторен арест, асфиксия		
Сърдечно-съдови: варират от дисритмия, хипотония до сърдечно-съдов арест	напр. Кръвно налягане, промяна в ЕКГ	
Водно-електролитна загуба: дехидратация, олигурия до бъбречна недостатъчност	напр. хипокалиемия, хипернатриемия, хипонатриемия, променена бъбречна функция	Възстановяване на водно-електролитния баланс
Нарушен глюкозен метаболизъм, кетоза	Хипергликемия, хипогликемия (особено при деца) Повишени нива на кетони	
Шум в ушите, глухота		
Стомашно-чревни: стомашно-чревно кървене		
Хематологични: варират от тромбоцитно инхибиране до коагулопатия	напр. Удължаване на РТ, хипопротромбинемия	
Неврологични: токсична енцефалопатия и депресия на ЦНС с прояви вариращи от сънливост, объркване до кома и гърчове		



## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: нервна система, други аналгетици и антипиретици, салицилова киселина и производни

АТС код: N02B A01

#### Механизъм на действие

Ацетилсалициловата киселина принадлежи към групата на киселинните нестероидни противовъзпалителни лекарствени продукти с аналгетични, антипиретични и противовъзпалителни свойства. Механизмът ѝ на действие се основава на необратимото инхибиране на циклооксигеназните ензими, включени в простагландиновия синтез.

#### Фармакодинамични ефекти

Ацетилсалициловата киселина в перорални дози обикновено от 0,3 до 1,0 g се прилага за облекчаване на болка и леки фебрилни състояния, като простуда и грип, за понижаване на температурата, както и за облекчаване на ставни и мускулни болки.

Тя също така се използва при остри и хронични възпалителни заболявания, като ревматоиден артрит, остеоартрит и анкилозираш спондилит.

Ацетилсалициловата киселина потиска агрегацията на тромбоцитите чрез блокиране на синтеза на тромбоксан А2 в тромбоцитите. Следователно тя се използва при различни съдови заболявания в дози обикновено от 75 до 300 mg дневно.

### 5.2 Фармакокинетични свойства

#### Абсорбция

След перорален прием ацетилсалициловата киселина се абсорбира бързо и напълно от стомашно-чревния тракт. По време и след абсорбиране ацетилсалициловата киселина се преобразува в нейния главен активен метаболит салицилова киселина. Максимални плазмени концентрации се достигат след 10-20 минути за ацетилсалициловата киселина и респ. 0,3-2 часа за салициловата киселина.

#### Разпределение

Както ацетилсалициловата киселина, така и салициловата киселина се свързват в голяма степен с плазмените протеини и се разпределят много бързо във всички части на тялото.

#### Биотрансформация

Салициловата киселина навлиза в майчиното мляко и преминава през плацентата.

#### Елиминиране

Салициловата киселина се елиминира чрез чернодробен метаболизъм; метаболитите включват салицилова киселина, салицилфенолов глюкуронид, салицилацилов глюкуронид, гентизинова киселина и гентизин-пикочна киселина.

Елиминационните кинетични показатели на салициловата киселина зависят от дозата, тъй като метаболизмът е ограничен от капацитета на ензимите на черния дроб. Следователно елиминационният полуживот варира между 2 до 3 часа след ниски дози и до 15 часа след високи дози. Салициловата киселина и нейните метаболити се екскретират главно чрез бъбреците.

### 5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничният профил на безопасност на ацетилсалициловата киселина е много добре документиран.



В тестове с животни салицилатите предизвикват увреждания на бъбреците във високи дози, но без други органни увреждания. Ацетилсалициловата киселина е широко изследвана *in vitro* и *in vivo* за мутагенност и канцерогенност: не са установени данни за мутагенен или канцерогенен потенциал.

При проучвания с животни салицилатите упражняват тератогенни ефекти върху различни животински видове. Описани са нарушения в имплантацията, ембриотоксични и фетотоксични ефекти и нарушения в запаметяващия капацитет на потомството след пренатална експозиция.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

Целулоза на прах  
Царевично нишесте

### **6.2 Несъвместимости**

Неприложимо.

### **6.3 Срок на годност**

5 години.

### **6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява под 30°C.

### **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

Аспирин 500 mg се предлага в блистери и картонени опаковки, съдържащи 10, 20, 40, 50 или 100 таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

### **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне**

Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

## **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Байер България ЕООД  
ул. Резбарска № 5, 1510 София  
България

## **8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

П-5662/07.09.2009  
(Регистрационен номер: 20030406)





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

Дата на първо разрешаване: 10 юни 2003 г.

Дата на последно подновяване: 07 септември 2009 г.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

06/2015

