

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АЦЕСАЛ ПРОТЕКТ 100 mg стомашно-устойчиви таблетки
ACESSAL PROTECT 100 mg gastro-resistant tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка стомашно-устойчива таблетка съдържа 100 mg ацетилсалицилова киселина (acetylsalicylic acid).

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчива таблетка.

Бели, кръгли, двойноизпъкнали филмирани стомашно-устойчиви таблетки.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

АЦЕСАЛ ПРОТЕКТ е показан при възрастни за:

- лечение на нестабилна стенокардия и остър миокарден инфаркт, като част от стандартната терапия;
- профилактика на повторен миокарден инфаркт, тромбоемболизъм след хирургични и други интервенции на артериални кръвоносни съдове, като АСВВ, РТСА, преходни исхемични атаки и мозъчен инфаркт след поява на продромални симптоми;
- за намаляване на риска от първичен миокарден инфаркт при лица със сърдечно-съдов риск, като захарен диабет, хиперлипидемия, артериална хипертония, затлъстяване, тютюнопушене, напреднала възраст.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Нестабилна стенокардия

Дневната доза, с която се постига адекватно инхибиране на тромбоцитната агрегация е между 100-160 mg.

Препоръчителна доза - 100 mg веднъж дневно.

Остър инфаркт на миокарда

Дневната доза, с която се постига адекватно инхибиране на тромбоцитната агрегация е между 75-300 mg.

Препоръчителна доза - 100 mg веднъж дневно.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20150051
Разрешение №	B6/MK/MK-4912
Одобрение №	20-12-2019



Профилактика на повторен миокарден инфаркт
Препоръчвана дневна доза – 300 mg веднъж дневно.

Профилактика след хирургични и други инвазивни интервенции на артериалните съдове
Дневната доза варира в диапазона 100-300 mg.
Препоръчвана доза - 100 mg веднъж дневно.

Профилактика на преходни исхемични атаки и мозъчен инфаркт
Дневната доза варира в диапазона 30-300 mg.
Препоръчвана доза - 100 mg веднъж дневно.

Профилактика на първичен миокарден инфаркт
Препоръчвана доза – 100 mg веднъж дневно или 300 mg през ден.

Начин на приложение

Таблетките се приемат преди хранене с голямо количество течност.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Свръхчувствителност към други салицилати;
- Анамнеза за бронхиална астма, предизвикана от прием на салицилати или вещества с подобно действие, особено НСПВС и лекарства от групата аналгетици-антипиретици;
- Активна стомашна и дуоденална язва и/или анамнеза за скорошна гастро-интестинална хеморагия;
- Хеморагична диатеза, хемофилия, тромбоцитопения;
- Едновременно приложение с метотрексат, прилаган в доза ≥ 15 mg/седмично (вижте точка 4.5);
- Първи и последен триместър на бременността (вижте точка 4.6).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Този лекарствен продукт трябва да бъде прилаган с особено внимание и точна оценка на съотношението полза/риск при:

- Лица, приемащи антикоагуланти;
- Пациенти с анамнеза за стомашни и чревни язви, вкл. хронична или рецидивираща язвена болест, или гастро-интестинални кръвоизливи;
- Болни с нарушения на бъбречната или чернодробната функция;
- Пациенти с известна свръхчувствителност към НСПВС или други атопии.

Ацетилсалициловата киселина може да провокира бронхоспазъм, астматичен пристъп или да предизвика други реакции на свръхчувствителност. Рискът 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 различни 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, при които елиминирането на пикочната киселина е нарушено, лечението с ацетилсалицилова киселина може да провокира подагрозен пристъп.

Педиатрична популация

Поради опасност от развитие на синдрома на Reye, този продукт, както и други лекарства, съдържащи ацетилсалицилова киселина, не трябва да се приемат от деца и юноши, особено при заболявания, протичащи с висока температура, освен в случаите, при които е бил назначен от лекар и другите терапевтични мерки са се оказали неуспешни.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Ацетилсалициловата киселина може да взаимодейства с други едновременно прилагани лекарства, поради което при лечение с този продукт е необходимо да се има предвид следната информация:

Противопоказани комбинации

Метотрексат, прилаган в доза ≥ 15 mg седмично - противовъзпалителните лекарства понижават бъбречния клирънс на метотрексат, а ASA го измества от местата на свързване с плазмените протеини, което води до повишаване на неговите плазмени концентрации и развитие на хемотоксичност (вижте точка 4.3).

Лекарствени комбинации, изискващи повишено внимание

Метотрексат, прилаган в доза < 15 mg седмично - противовъзпалителните лекарства понижават бъбречния клирънс на метотрексат, а ASA го измества от местата на свързване с плазмените протеини, в резултат на което се повишават плазмените му концентрации, а рискът от хемотоксичност нараства;

Кумаринови антикоагуланти и хепарин - повишен риск от кръвоизливи в резултат на адитивен инхибиторен ефект върху тромбоцитната агрегация и изместване на пероралните антикоагуланти от местата на свързване с плазмените протеини;

Урикозурични средства (бензбромарон), пробенецид - понижен урикозуричен ефект в резултат на конкурентни взаимодействия с пикочната киселина на ниво бъбречна тубулна екскреция;

Дигоксин – повишаване на плазмените му нива вследствие намаляване на бъбречната екскреция;

Орални антидиабетни продукти и инсулин - усилване на хипогликемичния им ефект в резултат на аналогичен ефект от страна на ASA и изместване на сулфанилурейните средства от местата на свързване с плазмените протеини;

Тромболитици и други антитромбоцитни средства - повишен риск от хеморагии;

Системни глюкокортикоиди (с изключение на случаите, в които се прилагат за субституиращо лечение) - повишаване клирънса на хронично прилаганата във високи дози ASA. Това може да доведе до понижаване на серумните нива на салицилата или да повиши риска от салицилова токсичност при прекратяване приема на кортикостероида.

ASA трябва да се прилага с особено внимание при едновременна употреба с глюкокортикостероиди при пациентите, страдащи от хипопротромбинемия.

При едновременен прием на системни глюкокортикоиди и ASA се повишава рискът от стомашно-чревни улцерации и хеморагии;

Валпроева киселина – повишена токсичност на последната, поради изместването ѝ от местата на свързване с плазмените протеини;



Ибупрофен – адитивен ефект по отношение на инхибирането на тромбоцитната агрегация;

Алкохол – повишен риск от увреждане на стомашната лигавица и удължаване времето на кървене в резултат на адитивен ефект.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Резултатите от проведени епидемиологични проучвания дават основание приложението на салицилати в първия триместър на бременността да бъде свързано с повишен риск от развитие на малформации в плода, като непълно затваряне на твърдото небце, сърдечни дефекти и др., макар че в проучване обхващащо 32 000 двойки майка-новородено не е установен повишен риск от малформации след прием на продукта в препоръчаните дневни дози. Въпреки това, салицилатите трябва да бъдат прилагани в периода на бременността само след строга оценка на съотношението потенциална полза за майката-възможен риск за плода.

Приложението им във високи дози през последния триместър може да доведе до удължаване на бременността, непълно затваряне на ductus Botali и потискане на контрактилитета на матката. Налице е повишена склонност към кръвоизливи, както от страна на майката, така и от страна на новороденото.

Приложението на високи дози ASA (>300 mg дневно) непосредствено преди раждането създава риск от интракраниални кръвоизливи, особено при недоносени.

Кърмене

Салицилатите се екскретират в малки количества в майчиното мляко. До момента не са установени нежелани реакции при новородени след случайна или еднократна употреба от страна на майката.

При редовно приложение или прием на високи дози е необходимо преустановяване на кърменето.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Ацесал Протект не повлиява способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са групирани на базата на система- орган- клас. В рамките на всяка органа система честотата на нежеланите реакции се определя като: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), много редки ($< 1/10\ 000$) и с неизвестна честота (не може да се определи от наличните данни)

Нарушения на кръвта и лимфната система	<p><i>Чести:</i> Засилена склонност към кървене.</p> <p><i>Редки:</i> Тромбоцитопения, гранулоцитоза, апластична анемия</p> <p><i>С неизвестна честота:</i> Случаи на кървене с удължено време на кървене, като епистаксис, гингивално кървене. Симптомите могат да персистират за един период от 4-8 дни след прекратяване приема на ацетилсалицилова киселина. В резултат може да се наблюдава повишен риск от кървене при хирургични процедури.</p>
--	--



	Съществуващо (хематемеза, мелена) или окултно гастроинтестинално кървене, което може да доведе до желязо-дефицитна анемия (по-често при по-високи дози).
Нарушения на имунната система	<i>Редки:</i> Реакции на свръхчувствителност, ангиоедем, алергичен оток, анафилактични реакции включително шок.
Метаболизъм и нарушения на храносмилателната система	<i>С неизвестна честота:</i> Хиперурикемия
Нарушения на нервната система	<i>Редки:</i> Вътречерепен кръвоизлив <i>С неизвестна честота:</i> Главоболие, световъртеж
Нарушения на ухото и лабиринта	<i>С неизвестна честота:</i> Намален слух; тинитус
Съдови нарушения	<i>Редки:</i> Хеморагичен васкулит
Респираторни, торакални и медиастинални нарушения	<i>Нечести:</i> Ринит, диспнея <i>Редки:</i> Бронхоспазъм, пристъпи на астма
Нарушения на репродуктивната система и млечната жлеза	<i>Редки:</i> Менорагия
Нарушения на стомашночревния тракт	<i>Чести:</i> Диспепсия <i>Редки:</i> Тежък гастроинтестинален кръвоизлив, гадене, повръщане <i>С неизвестна честота:</i> Язва на стомаха или дванадесетопръстника и перфорация
Хепатобилиарни нарушения	<i>С неизвестна честота:</i> Чернодробна недостатъчност
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	<i>Нечести:</i> Уртикария <i>Редки:</i> Синдром на Steven-Johnsons, синдром на Lyell, пурпура, еритема нодозум, еритема мултиформе
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	<i>С неизвестна честота:</i> Нарушена бъбречна функция

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 2 890 3417
уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Предозирането (терапевтично или инцидентно) с ацетилсалицилова киселина може да доведе до интоксикация, която при лица в старческа възраст и малки деца може да бъде сериозна, а в някои случаи може да бъде с 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 отзвучаване.

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

Лечение

Незабавна хоспитализация, стомашна промивка и прием на активен въглен, мониториране на показателите на алкално-киселинното равновесие, алкализиране на урината (поддържане на рН на урината в диапазона 7,5-8), форсирана алкализирана 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: Инхибитори на тромбоцитната агрегация, с изключение на хепарин, АТС Код: B01AC06

Механизъм на действие

Ацетилсалициловата киселина намалява образуването в мястото на възпаление на прекурсорите на простагландини и тромбоксани посредством директна инхибиция на ензима циклооксигеназа. Едновременно с това стимулира отделянето на β -ендорфини, потиска синтеза на ендогенни алгогени и понижава прага на възбудимост в таламуса. Намалява провеждането на болкови екстеро- и интероцептивни импулси в ЦНС. Оказва ефект върху хипоталамуса и потиска формирането на ендогенни пирогени.

Фармакодинамични ефекти

Приложена в дневни дози между 0,3 и 1,0 g оказва температуропонижаващо действие и има изразен аналгетичен ефект при болка, произхождаща от екстероцептивните рецептори. Притежава и изразено противовъзпалително действие, приложена в дневни дози 4-8 g.

Ацетилсалициловата киселина инхибира тромбоцитната агрегация, блокирайки синтеза на тромбоксан А₂ в тях. Ефектът е значим, тъй като тромбоцитите не могат да ресинтезират този ензим. Антиагрегантният ефект е най-силно изразен при прием на дневни дози 75-300 mg.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция



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, ацетилсалициловата киселина достига 10-20 минути след приема, а салициловата киселина – 0,3-2 часа след приема. Храната не повлиява бионаличността на ацетилсалициловата и салицилова киселина, но забавя резорбцията.

Разпределение

Ацетилсалициловата и салициловата киселина се свързват здраво и в значителна степен с плазмените протеини (50-80%), разпределят се бързо в телесните тъкани и течности.

Биотрансформация

Ацетилсалициловата киселина се елиминира посредством 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.

Елиминиране

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 гломерулна филтрация, активна тубулна секреция и пасивна тубулна реабсорбция. Алкализизирането на урината води до увеличаване на уринната екскреция. Салициловата киселина се открива в кърмата и преминава през плацентата.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Стойностите на LD₅₀ за ацетилсалициловата киселина след перорално приложение са съответно мишки - 250 mg/kg и гъхове - 200 mg/kg.

При продължително многократно дозиране се установяват промени в бъбречния паренхим и гастро-интестиналната лигавица.

Няма данни за мутагенна активност и канцерогенно действие.

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Ядро на таблетката:

Микрокристална целулоза
Нишесте, прежелатинизирано
Силициев диоксид, колоиден безводен
Стеаринова киселина

Филмово покритие:

Опадрай 03К19229 клиър (хипромелоза, триацетин, талк)



Акрил-EZE 93A18597 бял (съполимер на метакриловата киселина – етилакрилат (1:1), талк, титанов диоксид, силициев диоксид, колоиден безводен, натриев бикарбонат, натриев лаурилсулфат), триетил цитрат, пречистена вода

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Първична опаковка – по 10 таблетки в блистер от PVC/ алуминиево фолио.
Вторична опаковка – по 4 блистера в сгъваема картонена кутия.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

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

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Химакс Фарма ЕООД
ул. "Горица" № 8А
1618 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg. № 20150051

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

Дата на първо разрешаване: 23.02.2015

Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Ноември 2019 г.

