

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ASPIRIN EFFECT, 500 mg, granulat

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna saszetka granulatu zawiera substancję czynną: 500 mg kwasu acetylosalicylowego (*Acidum acetylsalicylicum*).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

Jedna saszetka granulatu zawiera 19 mg sodu i 5 mg aspartamu (E951).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Granulat

Biały granulat.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Dolegliwości bólowe np. ból głowy, bóle zębów, bóle mięśni, stawów, pleców.

Dolegliwości towarzyszące przeziębieniu i grypie.

Gorączka.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli

Jednorazowo od 500 mg do 1000 mg kwasu acetylosalicylowego (tj. od 1 do 2 saszetek).

W razie konieczności dawka jednorazowa może być powtarzana nie częściej niż co 4 - 8 godzin.

W ciągu doby nie należy przyjmować więcej niż 4000 mg kwasu acetylosalicylowego (tj. 8 saszetek).

Młodzież w wieku powyżej 12 lat

Produkt leczniczy Aspirin Effect może być stosowany u młodzieży w wieku powyżej 12 lat wyłącznie na zlecenie lekarza.

Jednorazowo 500 mg kwasu acetylosalicylowego (tj. 1 saszetka).

W razie konieczności dawka jednorazowa może być powtarzana nie częściej niż co 4 do 8 godzin.

Nie stosować więcej niż 1500 mg kwasu acetylosalicylowego (tj. 3 saszetki) na dobę.

W razie nieumyślnego zażycia lub przypadkowego przyjęcia leku przez dzieci, patrz punkt 4.4.

Produktu leczniczego Aspirin Effect nie należy stosować dłużej niż 3 do 5 dni bez konsultacji z lekarzem.

Pacjenci z zaburzeniami czynności wątroby

Kwas acetylosalicylowy należy stosować ostrożnie u pacjentów z nieprawidłową czynnością wątroby (patrz punkt 4.4).

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek

Kwas acetylosalicylowy należy stosować ostrożnie u pacjentów z nieprawidłową czynnością nerek (patrz punkt 4.4).

Sposób podawania

Podanie doustne

Granulat należy umieścić bezpośrednio na języku i poczekać aż się rozpuści. Rozpuszczone granulki należy połknąć, a jeśli to konieczne, można popić wodą. Produktu leczniczego Aspirin Effect nie należy zażywać na czczo.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancję czynną - kwas acetylosalicylowy, inne salicylany lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Skaza krwotoczna.
- Napady astmy oskrzelowej w wywiadzie, wywołane podaniem salicylanów lub substancji o podobnym działaniu, szczególnie niesteroidowych leków przeciwzapalnych.
- Ostra choroba wrzodowa żołądka lub dwunastnicy.
- Ciężka niewydolność serca, ciężka niewydolność wątroby lub ciężka niewydolność nerek.
- Jednocześnie z metotreksatem w dawkach 15 mg na tydzień lub większych (patrz punkt 4.5).
- Ostatni trymetr ciąży.
- U dzieci w wieku poniżej 12 lat.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Kwas acetylosalicylowy należy stosować ostrożnie w następujących sytuacjach:

- nadwrażliwość na leki przeciwzapalne i przeciwreumatyczne lub inne substancje alergizujące,
- u pacjentów z przebyłą (przewlekłą lub nawracającą) chorobą wrzodową lub krwawieniami z przewodu pokarmowego w wywiadzie,
- podczas jednoczesnego leczenia lekami przeciwzakrzepowymi (patrz punkt 4.5),
- u pacjentów z zaburzoną czynnością wątroby,
- u pacjentów z zaburzoną czynnością nerek lub zaburzeniami krążenia (np. choroba naczyń nerkowych, zastoinowa niewydolność serca, zmniejszenie objętości krwi krążącej, rozległa operacja, posocznica, ciężkie krwawienia), gdyż kwas acetylosalicylowy może dodatkowo zwiększyć ryzyko występowania zaburzeń czynności nerek i ciężkiej niewydolności nerek,
- u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej, gdyż podanie kwasu acetylosalicylowego może wywołać wystąpienie hemolizy lub niedokrwistości hemolitycznej. Czynniki, które mogą zwiększać ryzyko wystąpienia hemolizy to m.in. wysokie dawki kwasu acetylosalicylowego, gorączka, ciężkie infekcje;
- w okresie karmienia piersią (patrz punkt 4.6).

Nie należy stosować produktów zawierających kwas acetylosalicylowy u kobiet w pierwszym i drugim trymestrze ciąży, chyba że jest to bezwzględnie konieczne (patrz punkt 4.6).

Kwas acetylosalicylowy może powodować skurcz oskrzeli i wywoływać napady astmy lub inne reakcje nadwrażliwości. Czynniki ryzyka obejmują: astmę oskrzelową, katar sienny, polipy błony śluzowej nosa lub przewlekłe choroby układu oddechowego. Ostrzeżenie to odnosi się również do pacjentów, u których występują reakcje alergiczne (np. odczyny skórne, świąd, pokrzywka) na inne substancje.

Kwas acetylosalicylowy, ze względu na działanie antyagregacyjne, które utrzymują się przez kilka dni po zastosowaniu, może prowadzić do wydłużenia czasu krwawienia w czasie lub po zabiegach chirurgicznych (włącznie z niewielkimi zabiegami np. ekstrakcja zęba). Istnieje więc konieczność odstawienia leku na 5-7 dni przed planowanym zabiegiem chirurgicznym.

Kwas acetylosalicylowy nawet w małych dawkach zmniejsza wydalanie kwasu moczowego, co u predysponowanych pacjentów może wywołać napad dny moczanowej.

W przebiegu niektórych chorób wirusowych, szczególnie w przypadku zakażenia wirusem grypy typu A, wirusem grypy typu B lub ospy wietrznej, głównie u dzieci i młodzieży, istnieje ryzyko wystąpienia zespołu Reye'a – rzadkiej, ale zagrażającej życiu choroby. Występowanie uporczywych wymiotów w przebiegu infekcji może wskazywać na wystąpienie zespołu Reye'a, co wymaga natychmiastowej pomocy medycznej.

Ryzyko wystąpienia zespołu Reye'a w przebiegu infekcji wirusowych może wzrosnąć, jeśli jednocześnie podaje się kwas acetylosalicylowy, chociaż związek przyczynowy nie został udowodniony.

Z ww. względów u dzieci w wieku poniżej 12 lat produktów zawierających kwas acetylosalicylowy nie należy stosować, a u młodzieży w wieku powyżej 12 lat produkty zawierające kwas acetylosalicylowy można stosować wyłącznie na zlecenie lekarza.

Długotrwałe przyjmowanie produktów zawierających kwas acetylosalicylowy może być przyczyną bólu głowy, który nasila się podczas przyjmowania kolejnych dawek.

Długotrwałe przyjmowanie leków przeciwbólowych, szczególnie zawierających kilka substancji czynnych może prowadzić do ciężkiego zaburzenia czynności nerek i niewydolności nerek.

Istnieją dowody na to, że leki hamujące cyklooksygenazę (syntezę prostaglandyn) mogą powodować zaburzenia płodności u kobiet przez wpływ na owulację. Działanie to jest przemijające i ustępuje po zakończeniu terapii.

Substancje pomocnicze o znanym działaniu

Produkt leczniczy zawiera 5 mg aspartamu, źródła fenyloalaniny w każdej saszetce, co odpowiada 5 mg aspartamu w 1 saszetce produktu Aspirin Effect. Może być szkodliwy dla pacjentów z fenyloketonurią. Brak klinicznych i nieklinicznych danych dotyczących stosowania aspartamu u niemowląt poniżej 12. tygodnia życia.

Produkt zawiera sód (19 mg w jednej saszetce), co jest równoważne 1% zalecanej przez Światową Organizację Zdrowia (WHO) maksymalnej 2 g dawce dobowej spożycia sodu u osób dorosłych. Należy to wziąć pod uwagę u pacjentów ze zmniejszoną czynnością nerek i u pacjentów kontrolujących zawartość sodu w diecie.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Leki przeciwwskazane do jednoczesnego stosowania z kwasem acetylosalicylowym

Metotreksat w dawkach 15 mg na tydzień lub większych:

Nasilenie toksycznego wpływu metotreksatu na szpik (zmniejszony klirens nerkowy metotreksatu podczas jednoczesnego stosowania z produktami przeciwzapalnymi oraz wypieranie przez salicylany metotreksatu z połączeń z białkami osocza (patrz punkt 4.3).

Interakcje wymagające zachowania szczególnej ostrożności

Metotreksat w dawkach mniejszych niż 15 mg na tydzień:

Nasilenie toksycznego wpływu metotreksatu na szpik (zmniejszony klirens nerkowy metotreksatu podczas jednoczesnego stosowania z produktami przeciwzapalnymi oraz wypieranie przez salicylany metotreksatu z połączeń z białkami osocza - patrz wyżej).

Leki przeciwzakrzepowe, leki trombolityczne lub inne leki hamujące agregację płytek krwi:
Zwiększone ryzyko wydłużenia czasu krwawienia i krwotoków.

Inne niesteroidowe leki przeciwzapalne, w tym salicylany:
Zwiększone ryzyko wystąpienia choroby wrzodowej i krwawień z przewodu pokarmowego oraz uszkodzenia nerek na skutek synergistycznego działania tych leków.

Selektywne inhibitory zwrotnego wychwytu serotoniny (SSRI):
Zwiększone ryzyko krwawień z górnego odcinka przewodu pokarmowego na skutek synergistycznego działania tych leków.

Digoksyna:
Zwiększone stężenie digoksyny w osoczu wynikające ze zmniejszonego wydalania digoksyny przez nerki.

Leki przeciwcukrzycowe np. insulina, pochodne sulfonilomocznika:
Ze względu na właściwości hipoglikemizujące oraz wypieranie pochodnych sulfonilomocznika z połączeń z białkami osocza, kwas acetylosalicylowy nasila działanie leków przeciwcukrzycowych.

Leki moczopędne stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym:
Zmniejszenie filtracji kłębuszkowej spowodowanej zmniejszoną syntezą prostaglandyn w nerkach.

Glikokortykosteroidy podawane ogólnie, z wyjątkiem hydrokortyzonu stosowanego jako terapia zastępcza w chorobie Addisona:
Zmniejszenie stężenia salicylanów w osoczu w trakcie korykoterapii i zwiększenie ryzyka przedawkowania salicylanów po zakończeniu przyjmowania korykosteroidów.

Inhibitory konwertazy angiotensyny (ACE) stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym:
Zmniejszenie działania przeciwnadciśnieniowego poprzez zmniejszenie filtracji kłębuszkowej, wynikające z hamowania produkcji prostaglandyn, działających rozszerzająco na naczynia krwionośne.

Kwas walproinowy:
Zwiększenie toksyczności kwasu walproinowego poprzez wypieranie go z połączeń z białkami osocza.

Alkohol:
Zwiększenie ryzyka uszkodzeń błony śluzowej przewodu pokarmowego i wydłużenie czasu krwawienia spowodowane sumowaniem się efektów działania kwasu acetylosalicylowego i alkoholu.

Leki zwiększające wydalanie kwasu moczowego takie jak benzbromaron, probenecyd:
Osłabienie działania leków zwiększających wydalanie kwasu moczowego (konkurencja w procesie wydalania kwasu moczowego przez kanaliki nerkowe).

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Hamowanie syntezy prostaglandyn może niekorzystnie wpływać na ciążę i (lub) rozwój zarodka lub płodu. Wyniki badań epidemiologicznych wskazują na to, że stosowanie inhibitorów syntezy prostaglandyn we wczesnym okresie ciąży zwiększa ryzyko poronienia, występowania wad wrodzonych serca i wytrzewień wrodzonych. Całkowite ryzyko wystąpienia wrodzonych wad sercowo-naczyniowych zwiększa się z mniej niż 1% do około 1,5%. Uważa się, że ryzyko zwiększa się wraz z dawką i długością okresu terapii.

U zwierząt, po podaniu inhibitorów syntezy prostaglandyn zaobserwowano zwiększone ryzyko obumarcia zapłodnionego jaja w okresie przed i po zagnieżdżeniu się w macicy oraz zwiększone ryzyko obumarcia zarodka lub płodu. Dodatkowo, u zwierząt, po podaniu inhibitorów syntezy

prostaglandyn w okresie organogenezy, donoszono o zwiększonej ilości przypadków różnych wad rozwojowych, w tym wad sercowo-naczyniowych.

Stosowanie produktu leczniczego Aspirin Effect u kobiet od 20. tygodnia ciąży może powodować małowodzie wynikające z zaburzeń czynności nerek płodu. Może ono wystąpić wkrótce po rozpoczęciu leczenia i zwykle ustępuje po przerwaniu leczenia. Ponadto zgłaszano przypadki zwężenia przewodu tętniczego po stosowaniu produktu leczniczego w drugim trymestrze ciąży, z których większość ustępowała po przerwaniu leczenia.

Z tego powodu, nie należy stosować produktów zawierających kwas acetylosalicylowy u kobiet w pierwszym i drugim trymestrze ciąży, chyba że jest to bezwzględnie konieczne.

W razie stosowania kwasu acetylosalicylowego przez kobiety usiłujące zająć w ciążę lub w pierwszym i drugim trymestrze ciąży, należy stosować jak najmniejszą dawkę produktu leczniczego przez możliwie najkrótszy czas. Należy rozważyć obserwację przedporodową pod kątem małowodzia i zwężenia przewodu tętniczego po kilkudniowej ekspozycji na produkt Aspirin Effect od 20. tygodnia ciąży. W przypadku stwierdzenia małowodzia lub zwężenia przewodu tętniczego stosowanie Aspirin Effect należy przerwać.

W trzecim trymestrze ciąży wszystkie inhibitory syntezy prostaglandyn mogą powodować narażenie płodu na:

- działanie toksyczne na układ krążenia i układ oddechowy (przedwczesne zwężenie/zamknięcie przewodu tętniczego i nadciśnienie płucne),
- zaburzenia czynności nerek (patrz powyżej).

W końcowym okresie ciąży wszystkie inhibitory prostaglandyn mogą spowodować narażenie matki i noworodka na:

- możliwość wydłużenia czasu krwawienia, działanie antyagregacyjne, które może ujawnić się nawet po zastosowaniu bardzo małych dawek,
- zahamowanie czynności skurczowej macicy prowadzącej do opóźnienia porodu lub przedłużenia akcji porodowej.

W konsekwencji kwas acetylosalicylowy jest przeciwwskazany w trzecim trymestrze ciąży (patrz punkty 4.3 i 5.3).

Karmienie piersią

Kwas acetylosalicylowy i jego metabolity przenikają w niewielkich ilościach do mleka kobiecego. Ponieważ jak dotąd, podczas krótkotrwałego stosowania salicylanów przez matki, nie stwierdzono występowania działań niepożądanych u niemowląt karmionych piersią, przerywanie karmienia piersią z reguły nie jest konieczne. Jednakże w przypadku regularnego przyjmowania dużych dawek kwasu acetylosalicylowego, karmienie piersią powinno być wcześniej przerwane.

Płodność

Istnieją dowody na to, że leki hamujące cyklooksygenazę (syntezę prostaglandyn) mogą powodować zaburzenia płodności u kobiet przez wpływ na owulację. Działanie to jest przemijające i ustępuje po zakończeniu terapii.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Aspirin Effect nie ma wpływu na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8 Działania niepożądane

Zaburzenia żołądka i jelit

Bóle żołądka i brzucha, zgaga, nudności, wymioty, niestrawność, zapalenie przewodu pokarmowego, potencjalnie zagrażające życiu krwawienia z przewodu pokarmowego: jawne (fusowate wymioty, smoliste stolce) lub utajone (do krwawień dochodzi tym częściej im większa jest dawka); choroba wrzodowa żołądka lub dwunastnicy, perforacja, enteropatia zwężeniowa jelit (szczególnie podczas długotrwałego stosowania).

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

W rzadkich przypadkach opisywano przemijające zaburzenia czynności wątroby (zwiększenie aktywności aminotransferaz).

Zaburzenia układu nerwowego

Zawroty głowy i szumy uszne, będące zazwyczaj objawami przedawkowania.

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Zwiększone ryzyko krwawień, krwotoki (pooperacyjne, z nosa, z dziąseł, z układu moczowo-płciowego), krwiaki, wydłużenie czasu krwawienia, czasu protrombinowego, trombocytopenia. Skutkiem krwawień może być wystąpienie niedokrwistości z niedoboru żelaza albo niedokrwistości pokrwotocznej objawiające się astenią, błądnością, hypoperfuzją a także nieprawidłowymi wynikami badań laboratoryjnych.

Hemoliza i niedokrwistość hemolityczna u pacjentów cierpiących na poważną postać niedoboru dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej (G6PD).

Zaburzenia naczyniowe

Wylew krwi do mózgu (szczególnie u pacjentów z niekontrolowanym nadciśnieniem i (lub) jednocześnie stosujących inne leki przeciwnadciśnieniowe) potencjalnie zagrażający życiu.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Zaburzenia czynności nerek i ciężkie uszkodzenie nerek.

Zaburzenia układu immunologicznego

Reakcje nadwrażliwości z objawami klinicznymi i nieprawidłowymi wynikami odpowiednich badań laboratoryjnych takie jak: choroba układu oddechowego, która nasila się po zażyciu kwasu acetylosalicylowego, łagodne do umiarkowanych reakcje obejmujące skórę, układ oddechowy, układ sercowo-naczyniowy z objawami takimi jak: wysypka, pokrzywka, obrzęk (w tym naczynioruchowy), zaburzenia oddychania i pracy serca, zapalenie błony śluzowej nosa, przekrwienie błony śluzowej nosa, bardzo rzadko ciężkie reakcje, w tym wstrząs anafilaktyczny.

Zaburzenia układu oddechowego

Astma oskrzelowa.

Długotrwałe przyjmowanie produktów zawierających kwas acetylosalicylowy może być przyczyną bólu głowy, który nasila się podczas przyjmowania kolejnych dawek.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych:

Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49 21 301, faks: + 48 22 49 21 309, strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Zatrucie salicylanami (może wystąpić w przypadku przyjmowania dawki >100 mg/kg m.c./dobę przez więcej niż 2 dni) może być spowodowane długotrwałym przyjmowaniem dawek terapeutycznych lub zatruciem ostrym (w wyniku przedawkowania) potencjalnie zagrażającym życiu, np. po przypadkowym przyjęciu leku przez dzieci lub przypadkowym zatruciu.

Przewlekłe zatrucie salicylanami

Objawy zatrucia w wyniku długotrwałego przyjmowania leku są niespecyficzne, przez co łatwe do zbagatelizowania. Lekkie zatrucie lub salicylizm, występuje zwykle po wielokrotnym przyjęciu zbyt dużych dawek. Objawy zatrucia obejmują: zawroty głowy (w tym pochodzenia błędnikowego), szumy uszne, głuchotę, nadmierne pocenie się, nudności i wymioty, ból głowy, splątanie i mogą ustąpić po zmniejszeniu dawki przyjmowanego leku. Szumy uszne mogą wystąpić przy stężeniu leku we krwi od 150 do 300 mikrogramów/ml. Poważniejsze działania niepożądane występują przy stężeniu kwasu acetylosalicylowego we krwi powyżej 300 mikrogramów/ml.

Ostre zatrucie salicylanami

Ciężkie zatrucie charakteryzuje się zaburzeniami równowagi kwasowo-zasadowej a objawy różnią się w zależności od wieku i ciężkości zatrucia. U dzieci objawia się najczęściej kwasica metaboliczną. Stężenie kwasu acetylosalicylowego we krwi nie pozwala oszacować stopnia zatrucia. Wchłanianie kwasu acetylosalicylowego może być zmniejszone w wyniku opóźnionego opróżniania żołądka, tworzenia się złożeń w żołądku lub w wyniku przyjęcia leku w postaci tabletek powlekanych. Leczenie zatrucia jest uzależnione od przyjętej dawki, stadium i objawów klinicznych. Należy zastosować standardowe techniki postępowania w przypadku zatrucia. Podstawowe działania, które należy podjąć, to zwiększenie wydalania substancji czynnej oraz przywrócenie równowagi elektrolitowej i równowagi kwasowo-zasadowej.

Ze względu na złożoną patofizjologię skutków zatrucia salicylanami, objawy oraz wyniki badań mogą obejmować:

Objawy	Wyniki badań	Postępowanie
Zatrucie lekkie do umiarkowanego		Płukanie żołądka, wielokrotne podanie węgla aktywowanego, forsowana diureza alkaliczna
Przyspieszony oddech, hiperwentylacja, alkaloza oddechowa	Alkalemia, alkaluria	Podawanie płynów i kontrola stężenia elektrolitów
Obfite pocenie się		
Nudności, wymioty		
Zatrucie umiarkowane do ciężkiego		Płukanie żołądka, wielokrotne podanie węgla aktywowanego, forsowana diureza alkaliczna, hemodializa w ciężkich przypadkach
Alkaloza oddechowa z wyrównawczą kwasica metaboliczną	Kwasica, acyduria	Podawanie płynów i kontrola stężenia elektrolitów
Wysoka gorączka		Podawanie płynów i kontrola stężenia elektrolitów
Zaburzenia układu oddechowego: od hiperwentylacji, obrzęku płuc niesercowego pochodzenia do zatrzymania oddechu i asfiksji		
Zaburzenia serca i naczyń krwionośnych od arytmii, niskiego ciśnienia do zatrzymania pracy serca	Ciśnienie krwi, zmiany w zapisie EKG	
Utrata płynów i elektrolitów: od odwodnienia, oligurii aż do niewydolności nerek	Hipokaliemia, hipernatremia, hiponatremia, zaburzona praca nerek	Podawanie płynów i kontrola stężenia elektrolitów

Zaburzenia metabolizmu glukozy, ketoza	Hiperglikemia, hipoglikemia (szczególnie u dzieci). Zwiększone stężenie ketonów	
Szumy uszne, głuchota		
Zaburzenia układu pokarmowego: krwawienia z układu pokarmowego		
Zaburzenia krwi: od zahamowania agregacji płytek krwi do koagulopatii	np. wydłużenie czasu protrombinowego, hipoprotrombinemia	
Zaburzenia neurologiczne: toksyczna encefalopatia i hamowanie czynności OUN objawiające się letargiem, splątaniem aż do śpiączki i napadu drgawkowego		

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inne leki przeciwbólowe i przeciwgorączkowe, kwas salicylowy i jego pochodne; kod ATC: N02B A01.

Kwas acetylosalicylowy należy do grupy niesteroidowych leków przeciwzapalnych o właściwościach przeciwbólowych, przeciwgorączkowych i przeciwzapalnych. Mechanizm jego działania polega na nieodwracalnym hamowaniu cyklooksygenazy kwasu arachidonowego, a tym samym hamowaniu syntezy prostanoidów: prostaglandyny E₂ (PGE₂), prostaglandyny I₂ (PGI₂) oraz tromboksanu A₂.

Hamując syntezę tromboksanu A₂ w płytkach krwi, kwas acetylosalicylowy hamuje także agregację płytek krwi.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Po podaniu doustnym, kwas acetylosalicylowy wchłania się szybko i całkowicie z przewodu pokarmowego. W trakcie wchłaniania oraz po wchłonięciu jest przekształcany do głównego metabolitu – kwasu salicylowego. Ogólnie, maksymalne stężenie kwasu acetylosalicylowego w osoczu osiągane jest po 18-30 minutach, a kwasu salicylowego po 0,72 - 2 godzinach.

W przypadku granulatu 500 mg średnie maksymalne stężenie kwasu acetylosalicylowego w osoczu (C_{max}) wynosi 5,4 µg/ml, a mediana czasu do uzyskania maksymalnego stężenia w osoczu (T_{max}) wynosi 28 minut. Średnia całkowita ekspozycja na kwas acetylosalicylowy (pole pod krzywą [AUC]) wynosi 6,2 µg x h/ml. Wartość C_{max} kwasu salicylowego wynosi 25,5 µg/ml, mediana T_{max} wynosi 2 godziny, a średnia AUC wynosi 158 µg x h/ml.

Dystrybucja

Zarówno kwas acetylosalicylowy jak i kwas salicylowy wiążą się silnie z białkami osocza i ulegają szybkiej dystrybucji w całym organizmie. Kwas salicylowy przenika przez łożysko i do mleka kobiet karmiących piersią.

Metabolizm

Kwas acetylosalicylowy jest przekształcany do swojego głównego metabolitu, kwasu salicylowego. Hydroliza grupy acetylowej kwasu acetylosalicylowego rozpoczyna się jeszcze podczas przejścia przez śluzówkę jelita, lecz proces ten zachodzi przede wszystkim w wątrobie. Główne metabolity to kwas salicylowy sprzężony z glicyną (kwas salicylurowy), eter i ester glukuronidowy kwasu

salicylowego (fenylosalicylan glukuronidu i acetylosalicylan glukuronidu) oraz kwas gentyzynowy w postaci wolnej i sprzężonej z glicyną.

Eliminacja

Kinetyka eliminacji kwasu salicylowego zależy w dużym stopniu od dawki, ponieważ metabolizm kwasu salicylowego jest ograniczony przez aktywność enzymów wątrobowych. Okres półtrwania wynosi od 2 do 3 godzin po zastosowaniu małych dawek (do 325 mg/dobę) do około 15 godzin po dużych dawkach terapeutycznych (powyżej 3 g/dobę) lub w przypadku zatrucia. Kwas salicylowy i jego metabolity są wydalane głównie przez nerki.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Profil bezpieczeństwa kwasu acetylosalicylowego jest dobrze udokumentowany w licznych badaniach nieklinicznych.

W badaniach na zwierzętach salicylany powodowały uszkodzenie nerek, lecz nie wywoływały innych zmian chorobowych.

Kwas acetylosalicylowy został przebadany pod kątem działania mutagennego i rakotwórczego.

Nie znaleziono dowodów, świadczących o właściwościach mutagennych i rakotwórczych kwasu acetylosalicylowego.

Na podstawie badań przeprowadzonych na zwierzętach, stwierdzono, że salicylany wykazują działanie teratogenne u kilku gatunków zwierząt. Istnieją doniesienia dotyczące zaburzeń implantacji jaja płodowego, działania toksycznego na zarodek i płód oraz zaburzeń sprawności uczenia się u potomstwa narażonego na salicylany przed urodzeniem.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Mannitol

Sodu wodorowęglan

Sodu diwodorocytrynian

Kwas askorbowy

Aromat Cola H& R 290053

Aromat pomarańczowy 290038 HR SPT

Kwas cytrynowy

Aspartam (E951)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

2 lub 10 saszetek PETP/Aluminium/LDPE w tekturowym pudełku.

Jedna saszetka zawiera 840 mg granulatu.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Bayer Sp. z o.o.
Al. Jerozolimskie 158
02-326 Warszawa

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Nr pozwolenia: 17668

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 28 grudnia 2010 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 19 listopada 2015 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

08/2023