ПРИЛОЖЕНИЕ I

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта Приложение 1
Към Рег. № 20020212
Разрешение № BG/MA/MP - F3706 / 13-11-2026
Одобрение № /

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Ацетилин 500 mg таблетки
Acetylin 500 mg tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа активно вещество ацетилсалицилова киселина (acetylsalicylic acid) 500 mg.
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка
Кръгли, плоски, бели таблетки с фасета и делителна черта, с диаметър 13 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- За облекчаване на симптомите при главоболие, зъбобол, болки в гърлото, болки в мускулите и ставите, болки в гърба, леки артритни болки, менструални болки;
- Симптоматично лечение при остри възпалителни заболявания на горните дихателни пътища и грипни инфекции;
- Профилактика на инфаркт на миокарда и мозъчен инсулт при рискови пациенти;
- Профилактика на следоперативни тромбози.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни и деца над 16-годишна възраст
- За симптоматично повлияване на болка и температура по 1-2 таблетки (500 – 1000 mg) като еднократна доза, която може да се повтори на интервали от 4–8 часа. Максималната дневна доза от 4 g (8 таблетки) не трябва да се превишава.
Ацетилин не трябва да се приема повече от 3 дни без консултация с лекар.
- Като антиагрегант - по ½ таблетка дневно.

Начин на приложение
Ацетилин таблетки се приема по време или след хранене с достатъчно количество течности.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество, салицилати или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Активна пептична язва;
- Хеморагична диатеза;
- Анамнестични данни за астма, предизвикана от прилагане на салицилати или субстанции с подобно действие, преди всичко нестероидни противовъзпалителни лекарствени продукти;

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

- Едновременно лечение с метотрексат в дози от 15 mg/седмично или по-високи (вж. точка 4.5);
- Последния триместър от бременността;
- Тежка бъбречна недостатъчност;
- Тежка чернодробна недостатъчност;
- Тежка неконтролируема сърдечна недостатъчност;
- Деца под 16-годишна възраст, освен по изрично лекарско предписание.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Ацетилин може да се използва при следните обстоятелства само след строга преценка на съотношението полза/риск:
- при едновременно лечение с антикоагулантни лекарствени продукти (кумаринови деривати или хепарин – с изключение на лечение с хепарин с ниски дози);
- анамнестични данни за стомашно-чревни язви, включително хронична или рецидивираща язвена болест или анамнестични данни за кървене от стомашно-чревния тракт;
- нарушена чернодробна функция;
- нарушена бъбречна функция;
- свръхчувствителност към противовъзпалителни или противоревматични лекарствени продукти или други видове алергии.

Лекарствени продукти, съдържащи ацетилсалицилова киселина, не трябва да се използват при деца и подрастващи при наличие на вирусни инфекции със 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 *Reye*. Той се характеризира с продължително повръщане, дехидратация, нарушения на съзнанието, гърчове, което изисква незабавно интензивно лечение. Рискът може да се увеличи, ако ацетилсалициловата киселина се приема при тези заболявания.
Ацетилсалициловата киселина може да провокира появата на бронхоспазъм и да предизвика астматични пристъпи или други реакции на свръхчувствителност. Рискови фактори са бронхиална астма, назална полипоза или хронична обструктивна белодробна болест. Това се отнася също и за пациенти с алергични реакции (кожни реакции, сърбеж, уртикария) към други субстанции.
При пациенти, лекувани с ацетилсалицилова киселина са съобщавани редки случаи на остра миокардна исхемия със или без инфаркт на миокарда като част от реакция на свръхчувствителност (синдром на Кунис). При потвърден синдром на Кунис, дължащ се на ацетилсалицилова киселина, приемът на Ацетилин трябва да се прекрати незабавно.
Ацетилсалициловата киселина може да доведе до тенденция за повишено кървене по време и след хирургична операция (вкл. малки операции, напр. екстракции на зъби) поради нейното антиагрегантно действие.
При ниски дози ацетилсалициловата киселина намалява отделянето на пикочна киселина. Това може да отключи подагра у пациенти, които вече имат склонност към намалено екскретиране на пикочна киселина.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременното приложение на ацетилсалицилова киселина с други лекарства може да доведе до засилване или отслабване на ефекта им.
Противопоказани комбинации
Метотрексат, прилаган в дози от 15 mg седмично или повече: повишена хематологична токсичност на метотрексат (намален бъбречен клирънс на метотрексат от

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

противовъзпалителни агенти най-общо и изместване на метотрексат при свързването му с плазмени протеини от салицилатите) (вж. точка 4.3).

Комбинации, изискващи специално внимание при прилагане

Метотрексат, прилаган в дози под 15 mg седмично: повишена хематолитична токсичност на метотрексат (намален бъбречен клирънс на метотрексат от противовъзпалителни агенти най-общо и изместване на метотрексат при свързването му с плазмени протеини от салицилатите).

Антикоагуланти, в т.ч. кумарини, хепарин

Повишен риск от кървене в резултат на антиагрегантното действие, нарушение на гастродуоденалната лигавица и изместване на оралните антикоагуланти от местата им на свързване с плазмения протеин.

Метамизол

При едновременен прием метамизол може да намали ефекта на ацетилсалициловата киселина върху тромбоцитната агрегация. Следователно, тази комбинация трябва да се използва с повишено внимание при пациенти, приемащи ниска доза аспирин за кардиопротекция.

Други нестероидни противовъзпалителни средства със салицилати при високи дози (≥ 3 g/ден)

Повишен риск от язви и кървене от стомашно-чревния тракт вследствие на синергичен ефект.

Литий

Нестероидните противовъзпалителни средства (НСПВС) намаляват екскрецията на литий и повишават нивата му. Едновременната употреба на литий и НСПВС не се препоръчва. Концентрацията на литий в кръвта трябва да се следи, ако комбинацията е наложителна.

Урикозурични средства като бензбромарон, пробенецид

Понижен урикозуричен ефект (конкурентност на елиминиране на пикочна киселина чрез бъбречните тубули).

Селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина

Повишен риск от кървене от горните отдели на стомашно-чревния тракт поради възможен синергичен ефект.

Барбитурати

Ацетилсалициловата киселина повишава плазмените концентрации на барбитуратите.

Дигоксин

Плазмените концентрации на дигоксин се повишават вследствие намаляване отделянето му чрез бъбреците.

Антидиабетни продукти, в т.ч. инсулин, сулфанилурейни продукти

Засилен хипогликемичен ефект при високи дози ацетилсалицилова киселина посредством хипогликемичното действие на ацетилсалициловата киселина и изместване на сулфанилурейните средства от свързването им с плазмените протеини.

Тромболитични средства/други антикоагулантни средства като тиклопидин

Повишен риск от кървене.

Диуретици в комбинация с ацетилсалицилова киселина при дози 3 g/дневно и по-високи

Понижена гломерулна филтрация чрез понижена бъбречна синтеза на простагландини.

Системни глюкокортикоидни средства, с изключение на хидрокортизон, използван като заместваща терапия при болестта на Адисон

Понижените нива на салицилатите в кръвта по време на лечението с глюкокортикоиди и отсъствие на риск от свръхдозирането на салицилати, е резултат на повишеното им елиминиране от кортикостероидите.

Инхибитори на ангиотензин-конвертиращия ензим в комбинация с високи дози ацетилсалицилова киселина (>3 g/ден)

При дози от 3 g/ден и по-високи се понижава гломерулната филтрация чрез инхибиране на вазодилататорните простагландини и съответно се намалява антихипертензивния ефект.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

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 на допълнителните ефекти на ацетилсалициловата киселина и алкохола.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност
Употребата на салицилати през първите 3 месеца на бременността е свързана, според няколко епидемиологични проучвания, с повишен риск от спонтанен аборт и малформации (вродена цепка на небцето, сърдечни малформации). Този риск, вероятно, е нисък след приложение на обичайни терапевтични дози. Проспективно проучване на около 14 800 двойки майка-дете (с експозиция през първия триместър) не е установило никаква връзка между употребата на лекарството и повишена честота на малформации.
Салицилати могат да се приемат по време на бременност само след внимателна оценка на съотношението риск/полза от такова лечение. Ако се наложи употреба при жени, които се опитват да забременеят или са в 1-ия или 2-ия триместър на бременността, Ацетилин трябва да се приема във възможно най-ниска доза и продължителността на лечение да е възможно най-кратка.
Приложението на салицилати през последните 3 месеца на бременността може да доведе до удължаване на времето на кървене при майката и детето (антиагрегантен ефект, който може да се появи дори след прием на ниски дози) и потискане на маточните контракции, което води до забавяне или удължаване на раждането.
Приложен във високи дози в последния триместър от бременността Ацетилин може да предизвика преждевременно затваряне на ductus arteriosus с последваща устойчива белодробна хипертензия.
Приемът на ацетилсалицилова киселина във високи дози малко преди раждането може да доведе до мозъчни кръвоизливи, по-специално при преждевременно родени бебета.
Употребата на ацетилсалицилова киселина през 3-ия триместър на бременността е противопоказана.
Кърмене
Салицилатите преминават в майчиното мляко в малки количества. Тъй като досега не са наблюдавани неблагоприятни ефекти при бебета и малки деца, обикновено не е наложително прекъсване на кърменето. При продължителен прием на високи дози кърменето трябва да се преустанови своевременно, тъй като не може да се изключи риска от интоксикация на новороденото.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

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

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции, описани по-долу, са класифицирани по органи и системи и по честота. Нежеланите реакции се класифицират по честота по следния начин: много чести (≥ 1/10), чести (≥ 1/100 и <1/10), нечести (≥ 1/1 000 и <1/100), редки (≥ 1/10 000 и <1/1 000), много редки (<1/10 000), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нарушения на кръвта и лимфната система

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

Чести – кървене (перioперативна хеморагия, хематоми, епистаксис, кървене от пикочо-половите пътища, кървене на венците).
Много редки – стомашно-чревна хеморагия, мозъчна хеморагия. Хеморагията може да доведе до остра и хронична постхеморагична/желязодефицитна анемия.
Нарушения на имунната система
Много редки – анафилактични реакции, едем на Квинке, анафилактичен шок.
Нарушения на нервната система
При продължителна употреба е възможна поява на световъртеж, шум в ушите, които обикновено се дължат на предозиране.
Сърдечни нарушения
Много редки – сърдечен дистрес.
С неизвестна честота – Синдром на Кунис (остра миокардна исхемия със или без инфаркт на миокарда като част от реакция на свръхчувствителност), виж точка 4.4.
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения
Чести – задух.
Редки – ринит, назална конгестия.
Стомашно-чревни нарушения
Чести – коремна болка, киселини, диспепсия, гадене, повръщане, метеоризъм, коремен дискомфорт.
Редки – стомашно-чревно възпаление, стомашно-чревна язва.
Много редки – стомашно-чревна хеморагия и перфорация.
Хепато-билиарни нарушения
Много редки – нарушение на чернодробната функция (повишаване на трансаминазите).
Нарушения на кожата и подкожната тъкан
Редки – обрив, уртикария, сърбеж.

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 28903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

При пациенти в напреднала възраст и преди всичко при малки деца има опасност от интоксикация (терапевтично предозиране или инцидентно отравяне). При децата това може да бъде фатално.
Основни симптоми
Умерена форма на интоксикация: шум в ушите, нарушения на слуха, главоболие, световъртеж и обърканост. Тези симптоми могат да бъдат контролирани чрез намаляване на дозата.
Тежка интоксикация: хиперпирексия, хипервентилация, понижен метаболизъм на глюкозата, респираторна алкалоза, метаболитна ацидоза, кома, сърдечно-съдов шок, дихателна недостатъчност, тежка хипогликемия.
Хронично предозиране на салицилати се наблюдава само след многократна употреба на високи дози и протича със следните симптоми – замаяност, световъртеж, шум в ушите, изпотяване, вазодилатация и хипервентилация, главоболие, гадене, повръщане.
Симптомите могат да се контролират чрез намаляване на дозата.
Лечение на предозирането
Незабавно транспортиране до специализирано болнично заведение. Лечението зависи от изразеността на симптомите и техната тежест. Те съответстват на обичайните мерки за намаляване на резорбцията на активната съставка, ускоряване на отделянето на

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

приетото вещество и наблюдение на водния и електролитния баланс, регулиране на нарушената телесна температура и на дихателната функция.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Други аналгетици и антипиретици. Салицилова киселина и производни, АТС код N02BA01.
Инхибитори на тромбоцитната агрегация с изключение на хепарин, АТС код B01AC06.

Ацетилсалициловата киселина проявява аналгетичен ефект по отношение на екстеро- и проприоцептивни видове болки (произхождащи от кожата, опорно-двигателния апарат, зъбите). Има изразен противовъзпалителен (противоревматичен) и умерен антипиретичен ефект. В ниски дози (50-380 mg) потиска тромбоцитната агрегация. Има известен холекинетичен и хипогликемичен (при диабетици) ефект. Във високи дози стимулира дишането, понижава нивото на протромбина в кръвта (конкурентен антагонизъм с витамин К) и засилва екскрецията на пикочна киселина (урикозуричен ефект).
Основен момент в механизма на действие на ацетилсалициловата киселина е инхибиране на циклооксигеназата, което води до блокиране синтеза на ендопероксиди, простагландини и тромбоксани. Аналгетичният ефект има предимно периферен механизъм - липсата на простагландини и ендопероксиди намалява чувствителността на сетивните нервни окончания към алгогенните медиатори и екзогенните нокси.
Противовъзпалителният ефект на ацетилсалициловата киселина е обусловен преди всичко от потискане синтеза на ендопероксиди и простагландини в самото огнище на възпалението. Определена роля играе също стабилизирането на лизозомните мембрани, инхибиране на хиалуронидазата, декупелуване на окислителното фосфорилиране и други.
Антипиретичното и действие е свързано с понижаване нивото на простагландините Е и Д в централната нервна система, които опосредстват влиянието на екзогенни и ендогенни пирогени върху терморегулаторния център в хипоталамуса. Освен това, ацетилсалициловата киселина потиска образуването, освобождаването и преминаването в ЦНС на пирогените, които се образуват от бактериалните ендотоксини и неутрофилните левкоцити. Нарушеният синтез на простагландини и повишаване нивото на левкотриени лежи в основата и на нежеланите ефекти на продукта.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция
Ацетилсалициловата киселина се резорбира бързо и пълно в стомашно-чревния тракт. В организма се превръща в салицилат, но през първите 20 минути след резорбция ацетилсалицилова киселина е основната форма на лекарството в плазмата.
Разпределение
С плазмените протеини се свързва в 80 до 90%. Разпределя се в повечето тъкани на организма. Има голям обем на разпределение (около 170 ml/kg). При увеличаване на плазмените концентрации се наблюдава насищане на свързващите участъци на плазмените протеини и обема на разпределение нараства. Преминава лесно хематоенцефалната и плацентарната бариери, екскретира се в майчината кърма.
Биотрансформация
Метаболизира се основно в черния дроб чрез хидролиза с образуване на салицилова киселина, салицилфенолов глюкуронид, салицилацилов глюкуронид, гентизинова киселина и гентизин-пикочна киселина.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

Елиминиране
Времето на полуживот на ацетилсалицилова киселина варира от 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 върху животни салацилатите предизвикват увреждания на бъбреците във високи дози, но без други органни увреждания.
Ацетилсалициловата киселина е изследвана за мутагенност и канцерогенност, но не са намерени данни за мутагенен или канцерогенен потенциал.
Салицилатите оказват тератогенен ефект върху различни животински видове. Описани са нарушения в имплантацията, ембриотоксични и фетотоксични ефекти и нарушения в запаметяващия капацитет на потомството след пренатална експозиция на ацетилсалициловата киселина.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Целулоза, микрокристална; нишесте, прежелатинизирано; силициев диоксид, колоиден безводен; целулоза на прах; стеаринова киселина.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

- за опаковка блистер PVC/алуминиево фолио - 4 години.
- за опаковка банка от полипропилен х 100 таблетки - 2 години.

6.4 Специални условия на съхранение

В оригиналната опаковка, на сухо и защитено от светлина място, при температура под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

- 10 таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио, по 2 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.
- 100 таблетки в банка от полипропилен.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД
ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20020212

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

23.12.1993

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Септември 2026

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •