

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

2010 -12- 1 0

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ASPIRIN 300, 300 mg, tabletki powlekane

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 tabletka powlekana zawiera jako substancję czynną: 300 mg kwasu acetylosalicylowego (*Acidum acetylsalicylicum*).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki powlekane.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE**4.1 Wskazania do stosowania**

Kwas acetylosalicylowy jest wskazany do stosowania w następujących chorobach układu sercowo-naczyniowego:

- w niestabilnej chorobie wieńcowej,
- w świeżym zawałe serca lub podejrzeniu świeżego zawału serca,
- w zapobieganiu powtórnemu zawałowi serca,
- w zapobieganiu powikłaniom zatorowo-zakrzepowym po zabiegach chirurgicznych lub interwencyjnych na naczyniach (np. przezskórna śródnaczyniowa angioplastyka wieńcowa (PTCA), pomostowanie aortalno-wieńcowe (CABG), endarterektomia tętnicy szyjnej, zespolenie („shunt” tętniczo-żylne),
- w zapobieganiu napadom przejściowego niedokrwienia (TIA) i niedokrwiennego udaru mózgu u pacjentów z TIA,
- w zapobieganiu pierwszemu zawałowi serca u pacjentów z wieloma czynnikami ryzyka, w zapobieganiu zakrzepicy naczyń wieńcowych u pacjentów z wieloma czynnikami ryzyka
- w zapobieganiu zakrzepicy żył głębokich i zatorowi płuc u pacjentów długotrwale unieruchomionych, np. po dużych zabiegach chirurgicznych.

Produkt Aspirin 300 należy zastosować, gdy w opinii lekarza mniejsza dawka dobową kwasu salicylowego jest niewystarczająca.

Produktu Aspirin 300 nie należy stosować jako dawki nasycającej w sytuacji ostrej niewydolności wieńcowej / zawału serca (chyba, że postać o szybkim wchłanianiu jest niedostępna).

4.2 Dawkowanie i sposób podawania**Dawkowanie**

1 tabletka Aspirin 300 raz na dobę.

Tabletki należy przyjmować doustnie, najlepiej przed posiłkami, z dużą ilością płynu.

4.3 Przeciwwskazania

Produktu nie należy stosować:

- w przypadku nadwrażliwości na substancję czynną - kwas acetylosalicylowy, inne salicylany lub na którąkolwiek substancję pomocniczą,
- u pacjentów ze skazą krwotoczną,
- u pacjentów z ostrą chorobą wrzodową żołądka i (lub) dwunastnicy,
- u pacjentów z ciężką niewydolnością wątroby,
- u pacjentów z ciężką niewydolnością nerek,
- u pacjentów z ciężką niewydolnością serca,

- u pacjentów z napadami astmy oskrzelowej w wywiadzie, wywołanymi podaniem salicylanów lub substancji o podobnym działaniu, szczególnie niesteroidowych leków przeciwzapalnych,
- jednocześnie z metotreksatem w dawkach 15 mg na tydzień lub większych (patrz punkt 4.5),
- w ostatnim trymestrze ciąży,
- u dzieci w wieku do 12 lat w przebiegu infekcji wirusowych ze względu na ryzyko wystąpienia zespołu Reye'a – rzadkiej, ale ciężkiej choroby powodującej uszkodzenie wątroby i mózgu.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Kwas acetylosalicylowy należy stosować ostrożnie:

- w pierwszym i drugim trymestrze ciąży,
- w okresie karmienia piersią,
- w przypadku nadwrażliwości na niesteroidowe leki przeciwzapalne i przeciwreumatyczne lub inne substancje alergizujące,
- podczas jednoczesnego stosowania leków przeciwzakrzepowych,
- podczas jednoczesnego stosowania ibuprofenu, który może wpływać na działanie antyagregacyjne kwasu acetylosalicylowego,
- u pacjentów z zaburzoną czynnością wątroby lub nerek,
- u pacjentów z chorobą wrzodową żołądka i (lub) dwunastnicy lub krwawieniami z przewodu pokarmowego w wywiadzie,
- u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej.

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

Kwas acetylosalicylowy, ze względu na działanie antyagregacyjne, może prowadzić do wydłużenia czasu krwawienia w czasie lub po zabiegach chirurgicznych (włącznie z niewielkimi zabiegami, np. ekstrakcją zęba).

Kwas acetylosalicylowy, nawet w małych dawkach, zmniejsza wydalanie kwasu moczowego. U pacjentów ze zmniejszonym wydalaniem kwasu moczowego produkt może wywołać napad dny moczowej.

Dzieci i młodzież z objawami infekcji wirusowej, występującej z gorączką lub bez nie powinni przyjmować kwasu acetylosalicylowego bez uprzedniej konsultacji z lekarzem. W przypadku infekcji wirusowych, szczególnie takich jak: grypa typu A i B oraz ospa wietrzna, istnieje ryzyko wystąpienia zespołu Reye'a – rzadkiej, ale zagrażającej życiu choroby wymagającej natychmiastowej interwencji lekarskiej. Ryzyko może zwiększyć się, jeżeli w trakcie tych chorób, zostanie podany kwas acetylosalicylowy. Nie udowodniono, jednak związku pomiędzy chorobami wirusowymi a przyjmowaniem kwasu acetylosalicylowego. Uporczywe wymioty występujące w czasie trwania chorób wirusowych mogą być objawem zespołu Reye'a.

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.
Zwiększenie toksycznego działania metotreksatu na szpik (zmniejszony klirens nerkowy metotreksatu podczas jednoczesnego stosowania z lekami przeciwzapalnymi - w tym z kwasem acetylosalicylowym - 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.
Zwiększenie toksycznego działania metotreksatu na szpik (zmniejszony klirens nerkowy metotreksatu podczas jednoczesnego stosowania z lekami przeciwzapalnymi - w tym z kwasem

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Leków i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

acetylosalicylowym - oraz wypieranie przez salicylany metotreksatu z połączeń z białkami osocza - patrz wyżej)

- **ibuprofen**

Jednoczesne stosowanie ibuprofenu antagonizuje nieodwracalne hamowanie agregacji płytek krwi przez kwas acetylosalicylowy. U pacjentów ze zwiększonym ryzykiem incydentów sercowo-naczyniowych leczenie ibuprofenem może zmniejszać działanie kardioprotekcyjne kwasu acetylosalicylowego (patrz punkt 4.4).

- **leki przeciwzakrzepowe, np. pochodne kumaryny, heparyna**

Jednoczesne stosowanie kwasu acetylosalicylowego z lekami przeciwzakrzepowymi może powodować nasilenie działania przeciwzakrzepowego: zwiększone ryzyko wydłużenia czasu krwawienia i krwotoków, wynikające z wypierania leków przeciwzakrzepowych z ich połączeń z białkami osocza oraz właściwości antyagregacyjnych kwasu acetylosalicylowego.

- **selektywne inhibitory wychwytu zwrotnego serotoniny (SSRI)** Zwiększone ryzyko krwawienia z górnego odcinka przewodu pokarmowego z powodu działania synergicznego.

- **inne niesteroidowe leki przeciwzapalne, w tym salicylany w dużych dawkach (≥ 3 g/dobę).** Jednoczesne stosowanie niesteroidowych leków przeciwzapalnych z kwasem acetylosalicylowym zwiększa ryzyko wystąpienia choroby wrzodowej żołądka i (lub) dwunastnicy i krwawień z przewodu pokarmowego oraz uszkodzenia nerek, na skutek synergicznego działania tych leków.

- **leki zwiększające wydalanie kwasu moczowego z moczem, np. benzbromaron, probenecyd** Kwas acetylosalicylowy stosowany jednocześnie z lekami zwiększającymi wydalanie kwasu moczowego, powoduje zmniejszenie działania leków przeciwdnawych (konkurencja w procesie wydalania kwasu moczowego przez kanaliki nerkowe).

- **digoksyna**

Jednoczesne stosowanie kwasu acetylosalicylowego z digoksyną powoduje zwiększenie stężenia 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 trombolityczne lub inne leki hamujące agregację płytek krwi, np. tyklopidyna, stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym** mogą powodować zwiększone ryzyko wydłużenia czasu krwawienia i krwotoków.

- **leki moczopędne stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym w dawkach 3 g na dobę i większych** – zmniejszenie działania moczopędnego poprzez zatrzymanie sodu i wody w organizmie na skutek zmniejszenia filtracji kłębuszkowej, spowodowanej zmniejszoną syntezą prostaglandyn w nerkach. Kwas acetylosalicylowy może nasilać działanie ototoksyczne furosemidu.

- **glikokortykosteroidy systemowe, z wyjątkiem hydrokortyzonu stosowanego jako terapia zastępcza w chorobie Addisona, stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym** -zwiększone ryzyko wystąpienia choroby wrzodowej i krwawienia z przewodu pokarmowego oraz zmniejszenie stężenia salicylanów w osoczu w trakcie kortykoterapii i zwiększenie ryzyka przedawkowania salicylanów po zakończeniu przyjmowania glikokortykosteroidów.

- **inhibitory konwertazy angiotensyny (ACE) stosowane jednocześnie z kwasem acetylosalicylowym w dawkach 3 g na dobę i większych** - zmniejszenie działania przeciwnadciśnieniowego poprzez zmniejszenie filtracji kłębuszkowej, wynikające z hamowania produkcji prostaglandyn, działających rozszerzająco na naczynia krwionośne.

- **kwas walproinowy**

Kwas acetylosalicylowy zwiększa toksyczność kwasu walproinowego, poprzez wypieranie go z połączeń z białkami osocza. Kwas walproinowy zwiększa działanie antyagregacyjne kwasu acetylosalicylowego ze względu na synergiczne działanie antyagregacyjne obu leków.

- **alkohol**

Alkohol może zwiększyć ryzyko wystąpienia działań niepożądanych dotyczących przewodu pokarmowego, tj. owrzodzenie błony śluzowej lub krwawienia.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Hamowanie syntezy prostaglandyn może mieć niekorzystny wpływ 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. 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 liczbie przypadków różnych wad rozwojowych, w tym wad sercowo-naczyniowych.

Kwas acetylosalicylowy nie powinien być stosowany u kobiet w pierwszym i drugim trymestrze ciąży, chyba że jest to bezwzględnie konieczne. W razie stosowania kwasu acetylosalicylowego przez kobiety usiłujące zajść w ciążę lub w pierwszym i drugim trymestrze ciąży, należy stosować jak najmniejszą dawkę leku przez jak najkrótszy czas. W trzecim trymestrze ciąży wszystkie inhibitory syntezy prostaglandyn mogą powodować narażenie płodu na:

- działania toksyczne na układ krążenia i oddechowy (włącznie z przedwczesnym zamknięciem przewodu tętniczego i nadciśnieniem płucnym),
- zaburzenia czynności nerek mogące prowadzić do niewydolności nerek i małowodzia;

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

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

W konsekwencji kwas acetylosalicylowy w dawkach 100 mg/dobę lub wyższych jest przeciwwskazany w trzecim trymestrze ciąży.

Karmienie piersią

Kwas acetylosalicylowy i jego metabolity przenikają w niewielkich ilościach do mleka kobiet karmiących piersią. 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.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie maszyn

Produkt leczniczy nie ma wpływu na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie maszyn

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane uszeregowano według częstości występowania: bardzo często ($>1/10$), często ($\geq 1/100$, $<1/10$), niezbyt często ($\geq 1/1000$, $<1/100$), rzadko ($\geq 1/10\ 000$, $<1/1000$) i bardzo rzadko ($<1/10\ 000$).

Zaburzenia żołądka i jelit

Często: objawy niestrawności, (zgaga, nudności, wymioty), i bóle brzucha.

Rzadko: stany zapalne żołądka i jelit, choroba wrzodowa żołądka i (lub) dwunastnicy bardzo rzadko prowadzące do krwotoków i perforacji charakteryzujące się odpowiednimi objawami klinicznymi i wynikami badań laboratoryjnych.

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Rzadko opisano przemijające zaburzenia czynności wątroby ze zwiększeniem aktywności aminotransferaz.

Zaburzenia układu nerwowego

Zawroty głowy i szumy uszne, będące zazwyczaj objawami przedawkowania.

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Zwiększone ryzyko krwawień, wydłużenie czasu krwawienia.

Obserwowano krwawienia takie jak: krwotok okołoperacyjny, krwiaki, krwawienie z nosa, krwawienia z dróg moczowo-płciowych, krwawienia dziąseł.

Rzadko lub bardzo rzadko raportowano poważne krwawienia takie jak: krwotok z przewodu pokarmowego, krwotok mózgowy (szczególnie u pacjentów z niekontrolowanym nadciśnieniem tętniczym i (lub) współistnieniu przypadku równoczesnego podawania leków hemostatycznych), które, w pojedynczych przypadkach mogą potencjalnie zagrażać życiu.

Krwotok może prowadzić do ostrej lub przewlekłej niedokrwistości w wyniku krwotoku i (lub) niedokrwistości z niedoboru żelaza (na przykład w wyniku utajonych mikrokrwawień) z odpowiednimi objawami laboratoryjnymi i klinicznymi, takimi jak osłabienie, bladość, hypoperfuzja.

Zaburzenie układu immunologicznego

Reakcje nadwrażliwości z odpowiednimi objawami laboratoryjnymi i klinicznymi w tym: astma, odczyny skórne, wysypka, pokrzywka, obrzęk, świąd, zaburzenia serca i układu oddechowego, zapalenie błony śluzowej nosa, przekrwienie błony śluzowej nosa.

Bardzo rzadko: ciężkie reakcje alergiczne włączając wstrząs anafilaktyczny.

Zaburzenia nerek

Bardzo rzadko: zaburzenia czynności nerek

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Bardzo rzadko: hipoglikemia

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 produktu leczniczego przez dzieci.

Objawy zatrucia w wyniku długotrwałego przyjmowania produktu leczniczego 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, dezorientację i mogą przeminąć po zmniejszeniu dawki przyjmowanego produktu leczniczego. Szumy uszne mogą pojawić się po wystąpieniu stężenia produktu leczniczego we krwi od 150 do 300 mikrogramów/ml. Poważniejsze działania niepożądane występują gdy stężenie kwasu acetylosalicylowego we krwi jest powyżej 300 mikrogramów/ml.

Ciężkie zatrucie charakteryzuje się poważnymi zaburzeniami równowagi kwasowej, 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 produktu leczniczego w postaci tabletek powlekanych. Leczenie ciężkiego 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, alkaloz 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
Alkaloz oddechowa z wyrównawczą kwasicą metaboliczną	Kwasica, aciduria	Podawanie płynów i kontrola stężenia elektrolitów
Bardzo 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 krwi 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, dezorientacją aż do śpiączki i napadu drgawkowego		

Postępowanie po przedawkowaniu:

Pacjenta należy natychmiast przewieźć do szpitala.

Postępowanie zależy od wielkości przyjętej dawki, stadium i objawów klinicznych. Należy zastosować środki, mające na celu zmniejszenie wchłaniania substancji czynnej: płukanie żołądka, podanie węgla aktywowanego oraz kontrolować równowagę kwasowo-zasadową (niezbędna jest kontrola następujących parametrów krwi: pH, pCO₂, stężenia wodorowęglanów, stężenia potasu). Jeśli zachowana jest prawidłowa czynność nerek, można zastosować diurezę alkaliczną aż do uzyskania pH moczu w zakresie 7,5–8; w przypadku stężenia salicylanów w osoczu powyżej 500 mg/l (3,6 mmol/l) u dorosłych lub 300 mg/l (2,2 mmol/l) u dzieci należy rozważyć możliwość zastosowania forsowanej diurezy alkalicznej. Należy stosować wlewy dożylnie zawierające NaHCO₃, KCl oraz leki moczopędne.

W przypadkach ciężkiego zatrucia można zastosować hemodializę lub dializę otrzewnową.

Należy uzupełniać płyny oraz prowadzić ogólne postępowanie objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inhibitory agregacji płytek krwi, kod ATC: B01AC06.

Kwas acetylosalicylowy hamuje agregację płytek krwi przez blokowanie syntezy tromboksanu A_2 w płytkach. Ten mechanizm jest wynikiem nieodwracalnego hamowania enzymu - cyklooksygenazy (COX-1), a co za tym idzie - syntezy prostanoidów oraz tromboksanu A_2 . Działanie hamujące utrzymuje się do czasu pojawienia się nowej generacji płytkowej, ponieważ płytki krwi nie są w stanie zresyntezować tego enzymu. Przypuszcza się, że kwas acetylosalicylowy wywiera także inne działania hamujące na płytki krwi. Dlatego jest stosowany w różnych wskazaniach naczyniowych.

Kwas acetylosalicylowy należy do grupy kwasowych niesteroidowych leków przeciwzapalnych o właściwościach przeciwbólowych, przeciwgorączkowych, przeciwzapalnych i antyagregacyjnych.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym, kwas acetylosalicylowy wchłania się szybko i całkowicie z przewodu pokarmowego. Jest przekształcany do głównego metabolitu – kwasu salicylowego – w czasie i po wchłonięciu. Maksymalne stężenie kwasu acetylosalicylowego w osoczu osiągane jest po 10-20 minutach, a kwasu salicylowego po 0,3 - 2 godzinach. Ze względu na kwasoodporną otoczkę tabletki substancja czynna nie uwalnia się w żołądku tylko w środowisku zasadowym jelit. Zatem wchłanianie kwasu acetylosalicylowego jest opóźnione o 3 – 6 godzin od podania tabletek powlekanych w porównaniu do tabletek bez powleczenia.

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.

Kwas salicylowy metabolizowany jest głównie 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.

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 wydalone głównie przez nerki.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

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

Badania na zwierzętach wykazały, że salicylany powodowały uszkodzenie nerek, lecz nie wywoływały innych zmian chorobowych.

Dane niekliniczne uzyskane na podstawie badań farmakologicznych dotyczących działania mutagennego i rakotwórczego nie ujawniają występowania działania mutagennego i rakotwórczego kwasu acetylosalicylowego.

Badania przeprowadzone na zwierzętach i innych gatunkach wykazały objawy teratogenne salicylanów. Opisywane były objawy embriotoksyczne, fetotoksyczne i zaburzenia związane z możliwościami przyswajania wiedzy u potomstwa.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

celuloza sproszkowana, skrobia kukurydziana, kopolimer kwasu metakrylowego (1:1), polisorbat 80, sodu laurylosiarczan, talk, cytrynian trójetylowy

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

5 lat

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Lek należy przechowywać w miejscu niedostępnym i niewidocznym dla dzieci!
Przechowywać w temperaturze poniżej 25 °C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii PP/Al. w tekturowym pudełku.

Opakowanie zawiera 30, 60 lub 90 tabletek powlekanych w blistrach po 10 tabletek.

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

Bez szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

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

8. NUMER POZWOLENIA (N) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie MZ nr R/6840

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

04.10.1996 r., 08.11.2001 r., 21.09.2006

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

2011-01-27

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
30-952 Warszawa
ul. Stawki 15