

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ
МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕТО
ОБЩЕСТВЕНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВА
Формен характеристика на продукта - Приложение 1
Код Рег. № 20212367/68
Разрешение № BG/ММ/МР-58127-8
07-03-2022

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Кардиосалин Протект 75 mg стомашно-устойчиви таблетки
Cardiosalin Protect 75 mg gastro-resistant tablets

Кардиосалин Протект 100 mg стомашно-устойчиви таблетки
Cardiosalin Protect 100 mg gastro-resistant tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 таблетка Кардиосалин Протект 75 mg съдържа: 75 mg ацетилсалицилова киселина (*acetylsalicylic acid*).

1 таблетка Кардиосалин Протект 100 mg съдържа: 100 mg ацетилсалицилова киселина (*acetylsalicylic acid*).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчива таблетка.

Описание:

Кардиосалин Протект 75 mg - жълти, кръгли, двойноизпъкнали, стомашно-устойчиви таблетки.

Кардиосалин Протект 100 mg - бели, кръгли, двойноизпъкнали, стомашно-устойчиви таблетки.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Кардиосалин Протект е показан за:

- Вторична профилактика на миокарден инфаркт;
- Профилактика на сърдечно-съдови заболявания при пациенти със стабилна ангина пекторис;
- Анамнеза за нестабилна ангина пекторис, освен по време на остра фаза;
- Превенция на оклузия на графта след аорто-коронарен байпас (CABG);
- Коронарна ангиопластика, освен по време на острата фаза;
- Вторична профилактика на преходни исхемични атаки (TIA) и исхемични мозъчно-съдови инциденти (CVA), при условие, че са изключени интрацеребрални хеморагии;

Кардиосалин Протект стомашно-устойчиви таблетки не се препоръчва при спешни състояния. Употребата му се ограничава до вторична профилактика при хронично лечение.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Възрастни

Вторична профилактика на миокарден инфаркт

Препоръчителната доза е 75-150 mg веднъж дневно.



Профилактика на сърдечно-съдови заболявания при пациенти със стабилна ангина пекторис
Препоръчителната доза е 75-150 mg веднъж дневно.

Анамнеза за нестабилна ангина пекторис, освен по време на остра фаза
Препоръчителната доза е 75-150 mg веднъж дневно.

Превенция на оклузия на графта след аорто-коронарен байпас (CABG)
Препоръчителната доза е 75-150 mg веднъж дневно.

Коронарна ангиопластика, освен по време на острата фаза
Препоръчителната доза е 75-150 mg веднъж дневно.

Вторична профилактика на преходни исхемични атаки (TIA) и исхемични мозъчно-съдови инциденти (CVA), при условие, че са изключени интрацеребрални хеморагии
Препоръчителната доза е 75-300 mg веднъж дневно.

Пациенти в старческа възраст

Като общо правило, ацетилсалициловата киселина трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти в старческа възраст, тъй като те са по-предразположени към нежелани лекарствени реакции. Препоръчва се да се прилага обичайната доза за възрастни, при условие че няма тежка бъбречна или чернодробна недостатъчност (вж. т. 4.3 и 4.4). Лечението при тези пациенти трябва да се преразглежда периодично.

Педиатрична популация

Ацетилсалицилова киселина не трябва да се прилага при деца и юноши под 16 годишна възраст, освен в случаи, когато лекарят прецени, че ползата надвишава риска (вж. т. 4.4).

Начин на приложение

Кардиосалин Протект е предназначен за перорално приложение.

Препоръчително е стомашно-устойчивите таблетки да се вземат поне 30 минути преди хранене с достатъчно количество течност (1/2 чаша вода). Стомашно-устойчивите таблетки се гълтат цели и не трябва да се мачкат, чупят или дъвчат.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към съединения на ацетилсалицилова киселина или към инхибитори на простагландиновия синтез (напр. някои пациенти с астма, които могат да получат пристъп или припадък и някои пациенти, които могат да страдат от бронхоспазм, ринит и уртикария) или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Активна или анамнеза за рецидив на пептична язва и/или стомашно-чревно кървене или други видове кървене, като мозъчно-съдови хеморагии;
- Хеморагична диатеза; нарушения в коагулацията като хемофилия и тромбоцитопения;
- Тежко чернодробно увреждане;
- Тежко бъбречно увреждане;
- Дози над 100 mg/ден по време на последния триместър на бременността (вж. т. 4.6);
- Комбинация с метотрексат, прилаган в дози 15 mg/седмично или повече (вж. т. 4.5).



4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Кардиосалин Протект стомашно-устойчиви таблетки не е подходящ за употреба като противовъзпалително, аналгетично или антипиретично средство.

Препоръки за употреба при възрастни и юноши на 16 и повече години. Този лекарствен продукт не се препоръчва при юноши и деца под 16 години, освен в случаите, когато очакваната полза превишава потенциалния риск. Ацетилсалициловата киселина може да допринесе за предизвикване на синдрома на Reye при някои деца.

Съществува повишен риск от кръвоизлив, особено по време на оперативна процедура или след това (дори при по-малки процедури, като зъбна екстракция). Необходимо е да се прилага с повишено внимание преди хирургична интервенция, в това число и зъбна екстракция. Може да се наложи временно преустановяване на лечението.

Прилагането на ацетилсалицилова киселина по време на менорагия може да засили менструалното кървене.

Кардиосалин Протект стомашно-устойчиви таблетки трябва да се прилага с повишено внимание при хипертония и при пациенти с анамнеза за предишни заболявания, като язва на стомаха или дванадесетопръстника или хеморагични епизоди или са подложени на терапия с антикоагуланти.

Пациентите трябва да съобщават на лекаря за симптоми на необичайно кървене. Ако се появят симптоми на стомашно-чревно кървене или улцерация, лечението трябва да бъде преустановено.

Ацетилсалициловата киселина трябва да се прилага с внимание при пациенти с умерено увредена бъбречна или чернодробна функция (противопоказание, ако увреждането е тежко) или при пациенти, които са дехидратирани, тъй като употребата на НСПВС може да доведе до влошаване на бъбречната функция. Необходимо е да се провеждат редовно чернодробни функционални тестове при пациенти с лека до умерена чернодробна недостатъчност.

Ацетилсалициловата киселина може да провокира бронхоспазъм и астматични пристъпи или други реакции на свръхчувствителност. Рискови фактори са съществуваща астма, сенна хрема, носни полипи или хронични респираторни заболявания. Същото се отнася и за пациенти, които проявяват алергични реакции към други субстанции (напр. кожни реакции, сърбеж или уртикария).

Рядко се съобщава за сериозни кожни реакции, включително синдрома на Стивънс-Джонсън, свързано с употребата на ацетилсалицилова киселина (вж. т. 4.8). Лечението трябва да бъде прекратено при първата поява на кожен обрив, лигавични лезии или друг признак на свръхчувствителност.

Пациентите в старческа възраст са особено податливи на нежелани ефекти от НСПВС, включително и ацетилсалицилова киселина, особено гастроинтестинално кървене и перфорация, които могат да имат фатален изход (вж. т. 4.2). Ако се налага продължително лечение, пациентите трябва да бъдат под редовен контрол.

Едновременното лечение с Кардиосалин Протект стомашно-устойчиви таблетки и други лекарства, които променят хемостазата (напр. антикоагуланти като варфарин, тромболитици и антитромботични средства, противовъзпалителни средства и селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина) не се препоръчва, освен по стриктни показания, защото могат да засилят риска от кървене (вж. т. 4.5). Ако комбинирането не може да се избегне, препоръчва се внимателно следене за признаци на кървене.



Препоръчва се повишено внимание при пациенти, приемащи едновременно лекарства, които могат да засилят риска от улцерация, например перорални кортикостероиди, селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина и дефериалокс (вж. точка 4.5).

Ацетилсалициловата киселина в ниски дози намалява екскрецията на пикочна киселина. Поради този факт, пациенти с намалена екскреция на пикочна киселина могат да получат пристъпи на подагра (вж. т. 4.5).

Рискът от хипогликемичен ефект при приема на сулфанилуриейни средства и инсулин може да се потенцира при предозиране с ацетилсалицилова киселина (вж. т. 4.5).

Кардиосалин Протект стомашно-устойчиви таблетки трябва да се използва с повишено внимание при пациенти с глюкозо-6-фосфат дехидрогеназна (G6PD) недостатъчност.

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

Противопоказани комбинации

Метотрексат (прилаган в дози > 15 mg/седмица)

Комбинираният прием на метотрексат и ацетилсалицилова киселина повишава хематологичната токсичност на метотрексат, поради намаления бъбречен клирънс на метотрексат от ацетилсалициловата киселина. Ето защо, едновременната употреба на метотрексат (в дози > 15 mg/седмично) и ацетилсалицилова киселина е противопоказана (вж. т. 4.3).

Комбинации, които не се препоръчват

Урикозурични средства, например пробенецид

Салицилатите могат да преобърнат ефекта на пробенецид. Комбинацията трябва да се избягва.

Комбинации, които трябва да се използват с повишено внимание

Антикоагуланти, напр. кумарин, хепарин, варфарин

Повишен риск от кървене, поради инхибиране на тромбоцитната функция, увреждане на лигавицата на дванадесетопръстника и изместване на оралните антикоагуланти от техните места на свързване с плазмените протеини. Необходимо е да се следи времето на кървене (вж. т. 4.4).

Антитромботични средства (напр. клопидогрел, и дипиридамол) и селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (SSRI - напр. сертралин или пароксетин)

Повишен риск от гастроинтестинално кървене (вж. т. 4.4).

Антидиабетни средства (напр. сулфанилуриейни продукти)

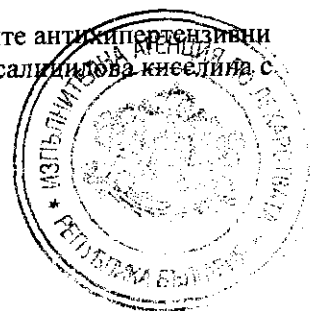
Салицилатите могат да засилят хипогликемичния ефект на сулфанилуриейните продукти.

Дигоксин и литий

Ацетилсалициловата киселина нарушава бъбречната екскреция на дигоксин и литий, което води до повишаване на плазмените им концентрации. Препоръчва се мониториране на плазмените концентрации на дигоксин и литий в началото и в края на лечението с ацетилсалицилова киселина. Може да се наложи коригиране на дозата.

Диуретици и антихипертензивни средства

НСПВС могат да намалят антихипертензивния ефект на диуретиците и другите антихипертензивни средства. Подобно на други НСПВС, едновременното приложение на ацетилсалицилова киселина с АСЕ-инхибитори повишава риска от остра бъбречна недостатъчност.



Диуретици: риск от развитие на остра бъбречна недостатъчност, поради намалена гломерулна филтрация чрез намален синтез на бъбречните простагландини. Препоръчва се хидратиране на пациента и проследяване на бъбречната функция в началото на лечението.

Инхибитори на карбоанхидразата (ацетазоламид)

Може да доведе до тежка ацидоза и повишена токсичност на централната нервна система.

Системни кортикостероиди

Възможно е да се повиши риска от гастроинтестинални улцерации и кървене когато ацетилсалициловата киселина се прилага едновременно с кортикостероиди (вж. т. 4.4).

Метотрексат (прилаган в дози <15 mg/седмично)

Комбинираният прием на метотрексат и ацетилсалицилова киселина повишава хематологичната токсичност на метотрексат, поради намаления бъбречен клирънс на метотрексат от ацетилсалициловата киселина. Необходимо е ежеседмично да се проверява кръвната картина през първите седмици на комбинираното лечение. Засилено наблюдение трябва да се проведе при наличие на дори леко нарушена бъбречна функция, както и при пациенти в старческа възраст.

Други НСПВС

Повишен риск от улцерации и гастроинтестинално кървене поради синергични ефекти.

Ибупрофен

Данните от проведени проучвания сочат, че ибупрофен може да инхибира ефекта на ацетилсалициловата киселина, прилагана в ниски дози, върху тромбоцитната агрегация, когато се приемат едновременно. Все пак, ограничеността на тези данни и несигурността относно екстраполацията на данните *ex vivo* върху клинични ситуации означава, че не могат да се правят категорични заключения за редовната употреба на ибупрофен и че вероятно няма клинично значим ефект при нередовната употреба на ибупрофен (вж. т. 5.1).

Метамизол

Метамизол може да намали ефекта на ацетилсалициловата киселина върху агрегацията на тромбоцитите при едновременната им употреба. Поради това, тази комбинация трябва да се използва с повишено внимание при пациенти, приемащи ниска доза ацетилсалицилова киселина за кардиопротекция.

Циклоспорин, такролимус

Едновременната употреба на НСПВС и циклоспорин или такролимус може да засили нефротоксичния ефект на циклоспорин и такролимус. Бъбречната функция трябва да се следи в случай на едновременно приложение на тези средства и ацетилсалицилова киселина.

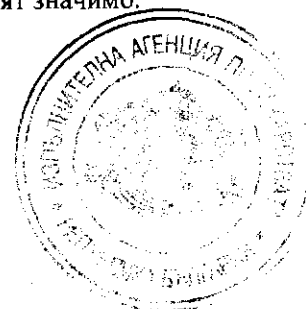
Валпроат

Има съобщения, че ацетилсалициловата киселина намалява свързването на валпроат със серумния албумин, като по този начин повишава неговите свободни плазмени концентрации в стационарно състояние.

Фенитоин

Салицилатът намалява свързването на фенитоин с плазмения албумин. Това може да доведе до намалени общи нива на фенитоин в плазмата, но до повишена фракция на свободния фенитоин. Несвързаната концентрация, а оттам и терапевтичният ефект, не се променят значимо.

Алкохол



Едновременната употреба на алкохол и ацетилсалицилова киселина повишава риска от гастроинтестинално кървене.

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Ниски дози (до 100 mg/ден):

Клинични проучвания сочат, че дози до 100 mg/ден за ограничена акушерска употреба, която изисква специализирано мониториране, изглежда са безопасни.

Дози от 100-500 mg/ден:

Няма достатъчно клиничен опит с приложението на дози над 100 mg/ден до 500 mg/ден. Поради това посочените по-долу препоръки за дози от 500 mg/ден и повече важат и за този дозов диапазон.

Дози от и над 500 mg/ден:

Инхибирането на простагландиновия синтез може да има нежелан ефект върху бременността и/или ембрио/феталното развитие. Данни от епидемиологични изследвания сочат повишен риск от спонтанен аборт, сърдечни малформации и гастросхиза след употребата на инхибитор на простагландиновия синтез в ранна бременност. Абсолютният риск от сърдечно-съдови малформации се повишава от по-малко от 1% до приблизително 1,5%. Смята се, че рискът се повишава с дозата и продължителността на терапията. При животни, прилагането на инхибитор на простагландиновия синтез води до повишаване на пред- и постимплантационните загуби и до ембрио-фетална смъртност. Освен това, има съобщения за повишаване броя на различни малформации, в това число и сърдечно-съдови, при животни, на които е прилаган инхибитор на простагландиновия синтез по време на органогенезата. През първия и втория триместър на бременността не трябва да се използва ацетилсалицилова киселина, освен при категорична необходимост. Ако ацетилсалициловата киселина се приема от жена, която прави опити да забременее или по време на първия или втория триместър на бременността, дозата трябва да бъде възможно най-ниска и продължителността на лечението да е възможно най-кратка.

През третия триместър на бременността всички инхибитори на простагландиновия синтез могат да изложат:

плода на:

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

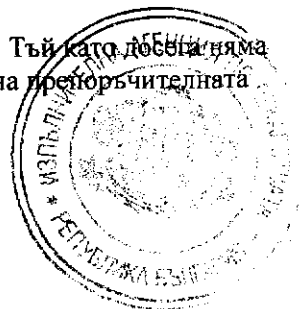
майката и плода, в края на бременността на:

- възможно удължаване на времето на кървене - антиагрегантен ефект, който може да настъпи дори и при много ниски дози;
- инхибиране на маточните контракции, което може да доведе до забавяне или удължаване на процеса на раждане.

Следователно, употребата на ацетилсалицилова киселина в дози от 100 mg/ден или повече, е противопоказана през третия триместър на бременността.

Кърмене

Малки количества салицилати и техни метаболити се екскретират в кърмата. Тъй като досега няма съобщения за нежелани ефекти при кърмачето, кратковременната употреба на препоръчителната



доза не налага спиране на кърменето. В случай на продължителна употреба и/или прием на по-високи дози, кърменето трябва да бъде прекратено.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са провеждани проучвания за ефектите върху способността за шофиране и работа с машини. На базата на фармакодинамичните свойства и нежеланите реакции на ацетилсалициловата киселина, не се очакват ефекти върху способността за реагиране, шофиране или работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са групирани по системно-органични класове. Следната конвенция е използвана при класифицирането на нежеланите ефекти по отношение на тяхната честота: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1000$), много редки ($< 1/10\,000$), с неизвестна честота (честотата не може да бъде определена от наличните данни).

Системо-органичен клас	Нежелани реакции
Нарушения на кръвта и лимфната система	<i>Чести:</i> Засилена склонност към кървене <i>Редки:</i> Тромбоцитопения, гранулоцитоза, апластична анемия <i>С неизвестна честота:</i> Случаи на кървене с удължено време на кървене, като епистаксис, гингивално кървене. Симптомите могат да персистират за период от 4-8 дни след прекратяване приема на ацетилсалицилова киселина. В резултат може да се наблюдава повишен риск от кървене при хирургични процедури. Съществуващо (хематемеза, мелена) или окултно гастроинтестинално кървене, което може да доведе до желязодефицитна анемия (по-често при по-високи дози).
Нарушения на имунната система	<i>Редки:</i> Реакции на свръхчувствителност, ангиоедем, алергичен оток, анафилактични реакции, вкл. шок.
Нарушения на метаболизма и храненето	<i>С неизвестна честота:</i> Хиперурикемия
Нарушения на нервната система	<i>Редки:</i> Интракраниална хеморагия <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, гръдни и медиастинални нарушения	<i>Нечести:</i> Ринит, диспнея



	<i>Редки:</i> Бронхоспазъм, пристъпи на астма
Нарушения на възпроизводителната система и гърдата	<i>Редки:</i> Менорагия
Стомашно-чревни нарушения	<i>Чести:</i> Диспепсия <i>Редки:</i> Тежък гастроинтестинален кръвоизлив, гадене, повръщане <i>С неизвестна честота:</i> Язва на стомаха или дванадесетопръстника и перфорация
Хепато-билиарни нарушения	<i>С неизвестна честота:</i> Чернодробна недостатъчност
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	<i>Нечести:</i> Уртикария <i>Редки:</i> Синдром на Стивънс-Джонсън, синдром на Лайл, пурпура, еритема нодозум, еритема мултиформе
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	<i>С неизвестна честота:</i> Нарушена бъбречна функция, солева и водна задръжка

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.: +35928903417
уебсайт: www.bda.bg

4.9. Предозиране

Въпреки значителните интериндивидуални различия, може да се приеме, че токсичната доза е 200 mg/kg при възрастни и 100 mg/kg при деца. Леталната доза ацетилсалицилова киселина е 25-30 g. Плазмени концентрации на салицилати над 300 mg/l сочат интоксикация. Плазмени концентрации над 500 mg/l при възрастни и 300 mg/l при деца, обикновено предизвикват тежка токсичност. Предозирането може да бъде вредно за пациенти в старческа възраст и особено за малки деца (терапевтично предозиране или чести инцидентни интоксикации могат да имат фатален изход).

Симптоми на умерена интоксикация

Тинитус, слухови смущения, главоболие, световъртеж, обърканост и гастроинтестинални симптоми (гадене, повръщане и болки в корема).



Симптоми на тежка интоксикация

Симптомите са свързани с тежко нарушение на алкално-киселинния баланс. Първоначално настъпва хипервентилация, което води до респираторна алкалоза. Респираторна ацидоза настъпва поради потискане на центъра на дишането. В допълнение, настъпва и метаболитна ацидоза в резултат на наличието на салицилат.

Тъй като при по-малките деца симптоми се наблюдават едва в късния етап на интоксикация, те обикновено са в стадий на ацидоза.

Освен това, могат да проявят следните симптоми: хипертермия и изпотяване, което води до дехидратация: чувство за безпокойство, конвулсии, халюцинации и хипогликемия. Потискането на нервната система може да доведе до кома, сърдечно-съдов колапс или респираторен арест.

Лечение при предозиране

Ако е погълната токсична доза, налага се прием в болнично заведение. В случай на умерена интоксикация е необходимо да се предизвика повръщане.

Ако от това няма резултат, трябва да се направи стомашна промивка през първия час след поглъщането на значително количество от лекарството. След това трябва да се даде активен въглен (адсорбент) и натриев сулфат (лаксатив).

Активният въглен може да се даде като еднократна доза (50 g за възрастен и 1 g/kg телесно тегло за дете под 12 години).

Алкализиране на урината (250 mmol натриев хидроген карбонат в продължение на 3 часа), като се проверява нивото на pH на урината.

В случай на тежка интоксикация за предпочитане е провеждане на хемодиализа.

Другите симптоми се лекуват симптоматично.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антитромботични средства: инхибитори на тромбоцитната агрегация с изключение на хепарин.

АТС код: B01AC06

Ацетилсалициловата киселина инхибира активирането на тромбоцитите: като блокира тромбоцитната циклооксигеназа посредством ацетилиране, тя инхибира синтеза на тромбоксан A₂ – физиологично активно вещество, което се освобождава от тромбоцитите и което би играло роля при усложненията на атероматозните лезии.

Инхибирането на синтеза на тромбоксан A₂ (TXA-2) е необратимо, тъй като тромбоцитите, които нямат ядро, нямат способността (поради липса на възможност за протеинов синтез) да синтезират нова циклооксигеназа, която е ацетилирана от ацетилсалициловата киселина.

Прилагането на многократни дози от 20 до 325 mg води до инхибиране на ензимната активност от 30% до 95%. Поради необратимото естество на свързването, ефектът персистира в продължение на жизнения цикъл на тромбоцита (7-10 дни). Инхибиращият ефект не се изчерпва при продължително лечение и ензимната активност постепенно започва отново след обновяване на тромбоцитите 24 до 48 часа след прекъсване на лечението. Ацетилсалициловата киселина удължава времето на кървене средно с около 50 до 100%, но могат да се наблюдават различия между отделните индивиди.

Експериментални данни сочат, че ибупрофен може да инхибира ефекта на ниска доза ацетилсалицилова киселина върху тромбоцитната агрегация, когато се приемат едновременно. В



едно проучване, когато еднократна доза ибупрофен 400 mg е била приета 8 часа преди или до 30 минути след приема на ацетилсалицилова киселина с незабавно освобождаване (81 mg), е наблюдавано понижаване на ефекта на ацетилсалициловата киселина върху образуването на тромбоксан или върху тромбоцитната агрегация. Поради ограничеността на тези данни и несигурността относно екстраполацията на данните към клиничните такива, не могат да се направят категорични заключения за редовната употреба на ибупрофен, нито за клинично значим ефект при нередовна употреба на ибупрофен.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След перорално приложение, ацетилсалициловата киселина се абсорбира бързо и напълно в гастроинтестиналния тракт. Значителна част от дозата, обаче, вече е хидролизирана до салицилова киселина в чревната стена по време на процеса на абсорбиране. Степента на хидролиза зависи от степента на абсорбция.

Разпределение

Ацетилсалициловата киселина, както и нейният главен метаболит салицилова киселина, се свързват в голяма степен с плазмените протеини, главно албумин и бързо се разпределят във всички части на тялото. Степента на протеиново свързване на салициловата киселина зависи много от концентрациите на салицилова киселина и албумин. Максималната серумна концентрация за ацетилсалицилова киселина се достига в рамките на половин час, а за салициловата киселина - в рамките на 1-2 часа. Обемът на разпределение на ацетилсалициловата киселина е около 0,16 l/kg телесно тегло. Салициловата киселина бавно дифузира в синовиалната течност, преминава плацентарната бариера и в малки количества се екскретира в кърмата.

Биотрансформация

Ацетилсалициловата киселина бързо се метаболизира до салицилова киселина с полуживот 15-30 минути. Салициловата киселина след това се превръща предимно в глицин и конюгати на глюкуроновата киселина.

Елиминационната кинетика на салициловата киселина е дозозависима, тъй като метаболизмът е ограничен от капацитета на чернодробните ензими. Поради това, елиминационният полуживот варира и е 2-3 часа след ниски дози (75 mg – 160 mg), 12 часа след обичайните аналгетични дози и 15-30 часа след високи терапевтични дози или интоксикация.

Екскреция

Салициловата киселина и нейните метаболити се екскретират главно чрез бъбреците.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Предклиничният профил на безопасност на ацетилсалициловата киселина е добре документиран. Проучвания при животни показват, че салицилатите не увреждат друг орган освен бъбреците. При проучвания върху плъхове са наблюдавани ефекти на фетотоксичност и тератогенност при прилагане на ацетилсалицилова киселина в токсични за майката дози. Не е известна клиничната значимост, тъй като дозите, използвани в предклинични проучвания са много по-високи (най-малко 7 пъти) от максималните препоръчителни дози при таргетни сърдечно-съдови индикации. Ацетилсалициловата киселина е широко изследвана по отношение на мутагенни и канцерогенни ефекти. Резултатите като цяло не показват съответни признаци за мутагенни или канцерогенни ефекти при проучвания с мишки и плъхове.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Кардиосалин Протект 75 mg стомашно-устойчиви таблетки

Ядро на таблетката

Царевично нишесте

Натриев нишестен гликолат (тип А)

Филмово покритие

Опадрай бял

Съполимер на метакрилова киселина – етилакрилат (1:1)

Талк

Триетилцитрат

Жълт железен оксид (Е 172)

Кардиосалин Протект 100 mg стомашно-устойчиви таблетки

Ядро на таблетката

Царевично нишесте

Натриев нишестен гликолат (тип А)

Филмово покритие

Опадрай бял

Съполимер на метакрилова киселина – етилакрилат (1:1)

Талк

Триетилцитрат

6.2. Несъвместимости

Неприложимо.

6.3. Срок на годност

2 (две) години

Срок на годност след първо отваряне на банката: 4 (четири) месеца

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 25°C.

Блистер: Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага.

Банка: Опаковката да се съхранява плътно затворена, за да се предпази от влага.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

6.5. Вид и съдържание на опаковката

Първична опаковка

- Блистер от PVC/PVdC/Al фолио – по десет (10) таблетки в блистер
- Банка от HDPE с PP капачка и сушител, по сто (100) таблетки в банка

Вторична опаковка

- По 3 или 4 блистера заедно с листовка за пациента в картонена кутия



- Една банка заедно с листовка за пациента в картонена кутия

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Антибиотик-Разград АД
бул. "Априлско въстание" 68, офис 201
7200 Разград, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Кардиосалин Протект 75 mg стомашно-устойчиви таблетки: рег. № 20210367
Кардиосалин Протект 100 mg стомашно-устойчиви таблетки: рег. № 20210368

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 17.12.2021

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Януари 2022

