МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ВЕРПАС-СР

ЛП - 004246 - 170417
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Верпас-СР

Международное непатентованное или группировочное наименование:

аминосалициловая кислота

Лекарственная форма: гранулы замедленного высвобождения для приема внутрь.

Состав

В одном пакете содержится:

Действующее вещество:

Аминосалициловая кислота 4,0 г.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 1,2997 г, метакриловой кислоты сополимер 0,71 г, тальк 0,30 г, кремния диоксид коллоидный 0,01 г.

Состав оболочки гранулы: дибутилсебакат 0,08 г, тальк 0,02 г, гипромеллоза 0,08 г, краситель солнечный закат желтый 0,0003 г.

Описание: Гранулы сферической формы, покрытые оболочкой красно-оранжевого цвета, без запаха.

Фармакотерапевтическая группа: противотуберкулёзное средство.

Код АТХ: [J04AA01].

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Аминосалициловая кислота обладает бактериостатическим действием в отношении Mycobacterium tuberculosis, уменьшает вероятность развития бактериальной устойчивости к стрептомицину и изониазиду. Механизм действия связан с угнетением синтеза фолиевой кислоты и с подавлением образования микобактина, компонента микобактериальной стенки, что приводит к уменьшению захвата железа M. tuberculosis. Аминосалициловая кислота действует в отношении активно размножающихся Mycobacterium tuberculosis (МПК 1–5 мкг/мл). Практически не действует на Mycobacterium tuberculosis в стадии покоя и располагающиеся внутриклеточно. Не действует на другие микобактерии. Применяется только в комбинации с другими противотуберкулезными средствами.

Фармакокинетика

Всасывание. Хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте. После приема внутрь здоровыми добровольцами в дозе 4 г с пищей, время достижения максимальной

концентрации 6 часов (варьировалось от 1.5 до 24 часов); средняя максимальная концентрация в плазме крови составляет 20 мкг/мл, изменяясь в диапазоне от 9 до 35 мкг/мл; концентрация 2 мкг/мл сохраняется в среднем 7.9 часа (от 5 до 9 часов); концентрация 1 мкг/мл сохраняется в среднем 8.8 часа (от 6 до 11.5 часов).

Распределение. Связывание с белками плазмы – 50-60%. Хорошо распределяется в тканях и жидкостях организма, почках, легких, печени. Достигает высоких концентраций в плевральном выпоте и казеозной ткани. В спинномозговую жидкость проникает умеренно (только при воспалении мозговых оболочек). Проникает в грудное молоко.

Метаболизм. Метаболизируется в печени (более 50% ацетилируется до неактивных метаболитов). Процесс ацетилирования генетически не обусловлен, как в случае с изониазидом.

Выведение. Выводится путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. 80% дозы выводится почками, из которых 50% – в виде метаболитов.

Показания к применению

Туберкулёз различных форм и локализаций (в комбинации с другими противотуберкулёзными препаратами), в том числе туберкулез с множественной лекарственной устойчивости к другим противотуберкулёзным препаратам.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к аминосалициловой кислоте (в т. ч. к другим салицилатам), другим компонентам препарата; индивидуальная непереносимость салицилатов (в анамнезе); артериальная гипертензия; дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; отеки, обусловленные гипонатриемией; тяжёлые заболевания почек и печени (тяжелая почечная и/или печёночная недостаточность, нефрит нетуберкулёзной этиологии, цирроз печени); декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, воспалительные заболевания кишечника в стадии обострения; амилоидоз внутренних органов; декомпенсированный гипотиреоз; тромбофлебит, гипокоагуляция; эпилепсия; период грудного вскармливания; детский возраст до 3-х лет (для данной лекарственной формы).

С осторожностью

Почечная/печеночная недостаточность средней и легкой степени тяжести, компенсированный гипотиреоз, хроническая сердечная недостаточность, заболевания желудочно-кишечного тракта (в анамнезе), острый гепатит, сахарный диабет.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Возможно применение препарата при беременности, только если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутрь, после еды, запивая кислыми растворами (соки: апельсиновый, томатный, яблочный). Гранулы не жевать. При повышенной кислотности желудочного сока препарат следует запивать водой.

Взрослым 12 г в сутки (4 г 3 раза в день), детям старше 3-х лет – из расчета 0,15-0,2 г/кг в сутки в 3-4 приёма (суточная доза не более 10 г). У истощённых взрослых пациентов (с массой тела менее 50 кг), а также при плохой переносимости препарат применяют в дозе 6 г в сутки.

При сопутствующих заболеваниях желудочно-кишечного тракта максимальная суточная доза – 4-6 г.

В условиях амбулаторного лечения можно применять всю суточную дозу на один прием (в случае хорошей переносимости).

Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: снижение или потеря аппетита, повышенное слюноотделение, тошнота, рвота, метеоризм, боль в животе, диарея или запор, изжога; повышение активности «печёночных» трансаминаз, гипербилирубинемия, желтуха; лекарственный гепатит (в т.ч. с летальным исходом), гепатомегалия, частично выраженный синдром мальабсорбции, кровотечение из пептической язвы.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, нейтропения, удлинение протромбинового времени, сопровождающееся кровотечением и геморрагической пурпурой, лимфоцитоз, лейкопения (вплоть до агранулоцитоза), В12-дефицитная мегалобластная анемия, гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса.

Со стороны мочеполовой системы: протеинурия, гематурия, кристаллурия, глюкозурия, увеличение концентрации мочевины в плазме крови.

Аллергические реакции: сыпь (крапивница, пурпура, энантема, эксфолиативный дерматит, синдром, напоминающий инфекционный мононуклеоз или лимфому), отек Квинке, лихорадка, бронхоспазм, артралгия, эозинофилия, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, анафилактический шок, зуд, эритема.

Прочие: лихорадка, артралгия, боль в горле, необычная кровоточивость и кровоподтеки, отек суставов, волчаночноподобный синдром, сопровождающийся поражением селезенки, печени, почек, пищеварительного тракта, костного мозга и нервной системы (например, боли корешкового характера, менингизм); при длительном применении в высоких дозах –

гипотиреоз, зоб (с микседемой или без нее); перикардит, гипогликемия, гипергликемия, гипокалиемия, неврит зрительного нерва, энцефалопатия, психоз, судороги, симптомы паралича, синдром Леффлера (эозинофильная пневмония, мигрирующий легочный инфильтрат), васкулит, снижение содержания протромбина, суперинфекция.

Передозировка

Симптомы: возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: отмена препарата, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Аминосалициловая кислота нарушает всасывание рифампицина, эритромицина и линкомицина. При необходимости совместного применения с рифампицином следует разделить во времени прием препаратов.

При совместном применении с изониазидом повышает его концентрацию в плазме крови вследствие конкуренции за общие пути метаболизма.

Одновременное применение с фенитоином может привести к повышению концентрации фенитоина в плазме крови и к появлению его токсичности.

Нарушает усвоение цианокобаламина (витамин В12), вследствие чего возможно развитие В12-дефицитной анемии. Таким образом, при лечении пациентов аминосалициловой кислотой более 1 месяца необходима терапия витамином В12.

Антацидные средства не нарушают абсорбцию препарата. В случае необходимости, их следует принимать раздельно (между приемами препаратов должно пройти 2 ч).

Снижает концентрацию дигоксина в крови на 40%. Может потребоваться коррекция дозы дигоксина.

Усиливает эффект непрямых антикоагулянтов - производных кумарина и индандиона (требуется коррекция дозы непрямых антикоагулянтов). Может потребоваться коррекция доз непрямых антикоагулянтов.

При применении йодсодержащих гормонов щитовидной железы, их аналогов и антагонистов (включая антитиреоидные средства) следует учитывать, что на фоне аминосалициловой кислоты изменяется концентрация тироксина и тиреотропного гормона в крови.

Применение препарата вместе с дифенгидрамином приводит к понижению концентрации аминосалициловой кислоты в плазме крови.

Пробенецид уменьшает экскрецию аминосалициловой кислоты, увеличивая её концентрацию в плазме.

Одновременное применение с этионамидом повышает риск гепатотоксичности.

Аммония хлорид повышает риск развития кристаллурии.

Применение препарата вместе с салицилатами, фенилбутазоном или другими противовоспалительными препаратами, обладающими повышенной способностью связываться с белками плазмы, приводит к повышению концентрации и увеличению продолжительности нахождения аминосалициловой кислоты в плазме крови.

Особые указания

Применяют в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными препаратами.

При первых признаках, указывающих на аллергическую реакцию, прием препарата следует немедленно прекратить и провести симптоматическую терапию.

В процессе лечения необходимо систематически исследовать мочу и кровь и осуществлять контроль функции печени (активность «печёночных» трансаминаз).

Снижение функции почек на фоне туберкулёзной интоксикации или специфического поражения не является противопоказанием к назначению аминосалициловой кислоты. Развитие протеинурии и гематурии требует временной отмены препарата.

При наличии симптомов нарушения функции печени, таких как повышение активности «печёночных» трансаминаз, желтуха, лихорадка, терапию препаратом следует прекратить и провести исследование функционального состояния печени.

Возможно обнаружение в кале нерастворившихся мягких оболочек гранул.

Необходимо поддерживать значение pH мочи нейтральным или щелочным для предотвращения кристаллурии. У пациентов с сахарным диабетом необходимо контролировать концентрацию глюкозы в плазме крови.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

До сих пор свидетельств того, что аминосалициловая кислота оказывает какое-либо неблагоприятное действие на способность пациента заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций, не было. При появлении побочных действий со стороны центральной нервной системы необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности.

Форма выпуска

Гранулы замедленного высвобождения для приема внутрь 4 г.

По 6,5 г препарата в пакет из фольги алюминиевой; пакет герметично запаивают. По 30 пакетов с 30 инструкциями по применению помещают в картонную пачку (для стационаров).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают только для специализированных лечебно-диагностических учреждений.

Производитель

Вертекс Экспортс

323/1, Сентрал Хоуп Таун, Кэмп Роад, Селакви, Дехрадун-248197, Уттараханд, Индия.

Претензии потребителей направлять в адрес

ООО "Виренд Интернейшнл", Россия

Варшавское шоссе д.1 стр.1 тел. 8 (495) 269-50-97, факс 8 (495) 269-51-14

Представитель компании



Ашиш Кумар