МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП - 002829 - 200115
СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Натрия пара-аминосалицилат

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Натрия пара-аминосалицилат

МНН или группировочное название: аминосалициловая кислота

Лекарственная форма: таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой

Состав

1 таблетка содержит:

Действующее вещество: натрия аминосалицилата дигидрат 1000 мг.

Ядро, вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 30 мг, повидон-К30 10 мг, кремния диоксид коллоидный 8 мг, тальк 7 мг, магния стеарат 5 мг.

Оболочка, вспомогательные вещества: целлацефат 64 мг, дибутилфталат 18 мг, титана диоксид 7,5 мг, краситель пунцовый [Понсо 4R] 0,5 мг.

Описание: капсуловидные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от светло-розового до темно-розового цвета. На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противотуберкулезное средство

Код АТХ: J04AA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Оказывает бактериостатическое действие. В основе туберкулостатического действия лежит конкуренция с пара-аминобензойной кислотой (ПАБК) за активный центр дигидроптероатсинтетазы – фермента, превращающего ПАБК в дигидрофолиевую кислоту, и ингибирует синтез фолиевой кислоты в микробной клетке и/или синтез компонентов клеточной стенки микобактерий, снижая захват железа последними. По туберкулостатической активности уступает изониазиду и стрептомицину. Проявляет активность только в отношении *Mycobacterium tuberculosis* (минимальная подавляющая концентрация *in vitro* 1-5 мкг/мл). Действует на микобактерии, находящиеся в состоянии активного размножения и практически не действует на микобактерии в стадии покоя. Слабо влияет на возбудителя, располагающегося внутриклеточно. Не действует на другие микобактерии. Первичная устойчивость встречается редко, вторичная развивается медленно. Применяется в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными средствами, что замедляет развитие резистентности к ним.

Фармакокинетика: Абсорбция из желудочно-кишечного тракта – быстрая и высокая; оказывает раздражающее действие на слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта. Легко проникает через гистогематические барьеры и распределяется в тканях. Достигает высоких концентраций в казеозных массах. Умеренно проникает в спинномозговую жидкость (только при воспалении мозговых оболочек). Максимальная концентрация (C_{max}) после приема в дозе 4 г в среднем составляет 20 мкг/мл (от 9 до 35 мкг/мл). Связь с белками плазмы – 50-60%. Основной путь метаболизма – ацетилирование. Метаболизируется в печени (более 50% ацетилируется до неактивных метаболитов) и частично в желудке. 80% выводится почками путем клубочковой фильтрации (50% - в виде ацетилированного производного). Общий клиренс зависит как от скорости метаболизма, так и от выведения почками. Период полувыведения ($T_{1/2}$) при нормальной функции почек – 30-60 минут, при хронической почечной недостаточности – до 23 часов. Проникает в грудное молоко.

Показания к применению

Туберкулез различных форм и локализаций (в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными средствами), в т.ч. при множественной лекарственной устойчивости к другим противотуберкулезным лекарственным средствам.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к аминосалициловой кислоте (в том числе к другим салицилатам), другим компонентам препарата; тяжелые заболевания почек и печени (почечная недостаточность и/или печеночная недостаточность, нефрит нетуберкулезной этиологии, гепатит, цирроз печени); амилоидоз внутренних органов; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; воспалительные заболевания кишечника в стадии обострения; декомпенсированный гипотиреоз; декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность (в т.ч. на фоне порока сердца); артериальная гипертензия; отеки, обусловленные гипернатриемией; тромбофлебит, гипокоагуляция, эпилепсия, детский возраст до 3-х лет.

С осторожностью

Умеренно выраженная печеночная недостаточность, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, компенсированный гипотиреоз, хроническая сердечная недостаточность, заболевания желудочно-кишечного тракта в анамнезе, сахарный диабет.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата во время беременности допустимо только в том случае, если возможная польза от лечения для матери превышает потенциальный риск для плода.

В период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания на время лечения препаратом.

Способ применения и дозы

Внутрь, через 0,5-1 ч после еды, запивая водой.

Взрослым – по 9-12 г/сут в 3-4 приема; истощенным взрослым больным (с массой тела менее 50 кг) – 6 г/сут в 3-4 приема.

Детям старше 3-х лет - из расчета 0,2 г/кг/сут в 3-4 приема (суточная доза не более 10 г).

В условиях амбулаторного лечения можно назначать всю суточную дозу в один прием, при плохой переносимости - в 2 приема.

При сопутствующих заболеваниях желудочно-кишечного тракта и начальных формах амилоидоза максимальная суточная доза – 4-6 г/сут.

Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

Побочные эффекты

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

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения (вплоть до агранулоцитоза), В12-дефицитная анемия, гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса.

Со стороны мочеполовой системы: протеинурия, гематурия, кристаллурия.

Аллергические реакции: сыпь (крапивница, пурпура, энантема, эксфолиативный дерматит, эритема; синдром, напоминающий инфекционный мононуклеоз или лимфому), лихорадка, бронхоспазм, артралгия, эозинофилия; анафилактический шок, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), ангионевротический отек, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Прочие: антитиреоидное действие, зоб, зобогенный эффект, лекарственный гипотиреоз, микседема; перикардит; гипогликемия; глюкозурия; гипокалиемия; неврит зрительного нерва; энцефалопатия; повышение концентрации мочевины в плазме крови; синдром Леффлера (эозинофильная пневмония, мигрирующий легочный инфильтрат); васкулит; снижение содержание протромбина; психоз, судороги, симптомы паралича.

Передозировка

Симптомы: возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: отмена препарата, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместим с другими противотуберкулезными лекарственными средствами.

Замедляет возникновение резистентности к изониазиду и стрептомицину.

При совместном применении с изониазидом повышает его концентрацию в крови вследствие конкуренции за общие пути метаболизма. Одновременное применение с изониазидом увеличивает риск развития гемолитической анемии.

Нарушает всасывание и снижает эффективность рифампицина, эритромицина и линкомицина. При необходимости совместного применения с рифампицином следует разделить во времени прием препаратов.

Нарушает усвоение цианокобаламина (возможно развитие В12-дефицитной анемии).

Снижает концентрацию дигоксина в крови на 40 %.

Антацидные средства не нарушают абсорбцию препарата.

Усиливает эффект непрямых антикоагулятнов – производных кумарина и индандиона (требуется коррекция дозы антикоагулянтов).

При применении йодсодержащих гормонов щитовидной железы, их аналогов и антагонистов (включая антитиреоидные средства) следует учитывать, что на фоне пара-аминобензойной кислоты (ПАБК) изменяется концентрация тироксина (Т4) и тиреотропного гормона (ТТГ) в крови.

Аммония хлорид повышает риск развития кристаллурии.

Одновременный прием с этионамидом повышает риск гепатотоксичности.

Дифенгидрамин снижает эффективность аминосалициловой кислоты.

Пробенецид снижает экскрецию аминосалициловой кислоты, повышая ее концентрацию в плазме.

Особые указания

Применяют в комбинации с более активными противотуберкулезными лекарственными средствами.

В процессе лечения рекомендуется систематически исследовать мочу и кровь, контролировать активность «печеночных» трансаминаз.

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

У пациентов с сахарным диабетом необходимо контролировать концентрацию глюкозы в плазме крови.

Снижение функции почек на фоне туберкулезной интоксикации или специфического туберкулезного поражения не являются противопоказанием к применению. Развитие протеинурии и гематурии требует временной отмены препарата.

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В связи с возможностью появления психоза, судорог и других побочных эффектов, связанных с приемом препарата, рекомендуется воздерживаться от управления автомобилем, другими механизмами и выполнять работы, требующие повышенной концентрации внимания.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, 1 г.

По 10 таблеток в Алюминий/ПВХ блистер. По 1, 3, 5 или 10 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку картонную.

По 100, 500 или 1000 таблеток в пакет полиэтиленовый. Пакет в пластмассовый контейнер с навинчивающейся крышкой и контролем первого вскрытия; на контейнер наклеивают этикетку. По 10, 20, 30 или 40 контейнеров вместе с соответствующим количеством инструкций по медицинскому применению в картонную коробку (для стационаров); на коробку наклеивают этикетку.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 ^{0}C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель

С.П. Инкомед Пвт. Лтд. (S.P. Incomed Pvt. Ltd.)

Юридический адрес: 110045, Нью-Дели, Палам Экстн-1, Н-680, Индия (H-680, Palam Extn-1, New Delhi-110045, India).

Место производства: 323/1, Централ Хоп Таун, Камп роуд, Дехрадун-248197, Индия (323/1, Central Hope Town, Camp Road, Dehradun-248197, India).

Адрес и телефон уполномоченной организации (для направления претензий потребителей и рекламаций):

ООО «С.П.ИНКОМЕД», Россия, 117556, г. Москва, Симферопольский б-р, д.7, корп. А, пом. I, часть комн. 30.

тел. +7 (495) 775-07-68

Генеральный директор
ООО «С.П.ИНКОМЕД»



Рай Панкадж Кумар