

по медицинскому применению лекарственного препарата

Натрия пара-аминосалицилат

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Натрия пара-аминосалицилат

Международное непатентованное или группировочное наименование:
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% ацетируется 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) и другим компонентам препарата, индивидуальная непереносимость салицилатов (в анамнезе);

- тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки;
- воспалительные заболевания кишечника в стадии обострения;
- некомпенсированный гипотиреоз;
- эпилепсия;
- тромбофлебит;
- гипокоагуляция;
- период грудного вскармливания;
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- артериальная гипертензия;
- отеки, обусловленные гипернатриемией;

- амилоидоз внутренних органов;
- детский возраст до 3 лет.

С осторожностью

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

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 кислыми жидкостями (соки: апельсиновый, яблочный, томатный). Не разжевывать! При повышенной кислотности желудочного сока запивать водой.

Взрослым – по 9-12 г (в пересчете на необходимое количество таблеток) в сутки (3-4 г 3 раза в день), для истощенных взрослых пациентов (с массой тела менее 50 кг), а также при плохой переносимости – в дозе 6 г (в пересчете на необходимое количество таблеток) в сутки.

У детей от 3 до 18 лет применяют из расчета 0,15-0,2 г/кг массы тела в сутки в 3-4 приема, не более 10 г (в пересчете на необходимое количество таблеток) в сутки.

При сопутствующих заболеваниях желудочно-кишечного тракта и начальных формах амилоидоза максимальная суточная доза - 4-6 г (в пересчете на необходимое количество таблеток) в сутки. Количество курсов и общая продолжительность лечения определяется индивидуально. В условиях амбулаторного лечения можно применять всю суточную дозу на один прием (в случае хорошей переносимости).

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: снижение и потеря аппетита; повышенное слюноотделение; тошнота; изжога; рвота; метеоризм; боль в животе; диарея или запоры; гепатомегалия; повышение активности «печеночных» трансаминаз; желтуха; лекарственный гепатит, в том числе с летальным исходом; частично выраженный синдром мальабсорбции; кровотечение из пептической язвы.

Со стороны мочеполовой системы: протеинурия, гематурия, кристаллурия, глюкозурия.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения; лейкопения (вплоть до агранулоцитоза); нейтропения; лимфоцитоз; эозинофилия; снижение протромбина,

увеличение протромбинового времени, сопровождающееся кровотечением и геморрагической пурпурой; гипербилирубинемия; В12-дефицитная мегалобластная анемия; гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса.

Аллергические реакции: зуд, сыпь (крапивница; пурпура; энантема; эксфолиативный дерматит; эритема; синдром, напоминающий инфекционный мононуклеоз или лимфому), бронхоспазм, синдром Лёффлера (эозинофильная пневмония, мигрирующий легочный инфильтрат), васкулиты, анафилактический шок, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), ангионевротический отек, синдром Лайелла.

Прочие: артралгия; лихорадка; боль в горле; необычная кровоточивость и кровоподтеки; гипогликемия; повышение концентрации мочевины в плазме крови; психоз; судороги; симптомы паралича; при длительном применении в высоких дозах – гипотиреоз, зоб (с микседемой или без нее); перикардит; отек суставов; волчаночноподобный синдром, сопровождающийся поражением селезенки, печени, почек, пищеварительного тракта, костного мозга и нервной системы (например, боли корешкового характера, менингизм); энцефалопатия; неврит зрительного нерва; суперинфекция.

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.

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

Аминосалициловая кислота нарушает усвоение витамина В12 почти на 55%, вследствие чего возможно развитие анемии.

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.

Применение препарата вместе с фенитоином приводит к увеличению продолжительности нахождения фенитоина в плазме крови.

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

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

Антацидные средства не нарушают абсорбцию препарата.

Снижает концентрацию дигоксина в крови на 40%.

Усиливает эффект непрямых антикоагулянтов – 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 парааминобензойной кислоты изменяется концентрация тироксина и тиреотропного гормонов в крови.

Аммония хлорид повышает риск развития кристаллурии.

Одновременное применение с этионамидом повышает риск гепатотоксичности.

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

Особые указания

Применяют в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными средствами.

При первых признаках, указывающих на аллергическую реакцию, прием препарата должен быть немедленно прекращен и проведена десенсибилизирующая терапия.

В процессе лечения необходимо систематически исследовать мочу и кровь и проверять функциональное состояние печени (контролировать активность «печеночных» трансаминаз).

Необходимо поддерживать значение pH мочи нейтральным или щелочным для предотвращения кристаллурии.

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

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

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

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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 блистер из пленки ПВХ и комбинированного материала на основе алюминиевой фольги и пленки из полиэтилена, полипропилена, полиэтилентерефталата.

По 1, 3, 5 или 10 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку картонную.

Упаковка для стационаров

По 100, 500 или 1000 таблеток в банку полимерную в комплекте с крышкой (с контролем первого вскрытия). На банку наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или писчей, или самоклеящуюся этикетку.

По 12 банок по 500 таблеток вместе с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в коробку из картона гофрированного. На коробку наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или писчей, или самоклеящуюся этикетку.

По 1 банке вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «ФармКонцепт», Россия

171261, Тверская обл., Конаковский район, пгт Редкино, ул. Заводская, д. 16

Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии потребителя:

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