

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Аминокапроновая кислота-Эдвансд

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Аминокапроновая кислота-Эдвансд

Международное непатентованное наименование или группировочное наименование:

Аминокапроновая кислота

Лекарственная форма: раствор для инфузий

Состав на 100 мл препарата:

Действующее вещество: аминокапроновая кислота – 5,0 г.

Вспомогательные вещества: натрия хлорид – 0,9 г; вода для инъекций – до 100 мл.

Теоретическая осмолярность: 689 мОсм/л

Описание

Прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: гемостатические средства; антифибринолитические средства; аминокислоты

Код АТХ

B02AA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Кислота аминокапроновая относится к синтетическим аналогам лизина. Она ингибирует фибринолиз, конкурентно насыщая лизин-связывающие рецепторы, благодаря которым плазминоген (плазмин) связывается с фибриногеном (фибрином). Препарат также ингибирует биогенные полипептиды-кинины (тормозит активирующее действие стрептокиназы, урокиназы, тканевых киназ на фибринолиз), нейтрализует эффекты калликреина, трипсина и гиалуронидазы, уменьшает проницаемость капилляров. Кислота аминокапроновая обладает противоаллергической активностью, усиливает детоксицирующую функцию печени, угнетает антителообразование.

Фармакокинетика

Абсорбция и распределение

Аминокапроновая кислота широко распределяется в органы и ткани, проникает в эритроциты, обнаруживается в сперме, синовиальной жидкости и тканях плода. После внутривенного введения объем распределения составляет $30 \pm 8,2$ л.

Биотрансформация

Аминокапроновая кислота в небольшой степени метаболизируется до адипиновой кислоты.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 30.09.2024 № 20934
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Выделение

Аминокапроновая кислота выводится почками, преимущественно в неизмененном виде. Почечный клиренс (116 мл/мин) примерно соответствует клиренсу эндогенного креатинина. Общий клиренс составляет 169 мл/мин. Терминальный период полувыведения аминокaproновой кислоты составляет примерно 2 часа.

Особые группы пациентов

В фармакокинетических исследованиях было установлено, что общий клиренс аминокaproновой кислоты значительно снижается у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью.

Показания к применению

Препарат показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 0 до 18 лет.

- Кровотечения (гиперфибринолиз, гипо- и афибриногенемия).
- Кровотечения при хирургических вмешательствах и патологических состояниях, сопровождающихся повышением фибринолитической активности крови (при нейрохирургических, внутриполостных, торакальных, гинекологических и урологических операциях, в том числе на предстательной железе, легких, поджелудочной железе; тонзиллэктомии, после стоматологических вмешательств, при операциях с использованием аппарата искусственного кровообращения, при операциях на сосудах в области уха, горла, носа).
- Заболевания внутренних органов с геморрагическим синдромом.
- Преждевременная отслойка плаценты, длительная задержка в полости матки мертвого плода, осложненный аборт.
- Профилактика вторичной гипофибриногенемии при массивных переливаниях консервированной крови.

Противопоказания

Гиперчувствительность к аминокaproновой кислоте или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата, склонность к тромбозам и тромбоэмболическим заболеваниям, гиперкоагуляция (тромбообразование, тромбоэмболия), коагулопатии вследствие диффузного внутрисосудистого свертывания крови, беременность, период грудного вскармливания, нарушения мозгового кровообращения.

С осторожностью

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 30.09.2024 № 20934
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Артериальная гипотензия, кровотечения из верхних мочевыводящих путей (из-за риска интравенальной обструкции, обусловленной тромбозом клубочковых капилляров или образованием сгустков в просвете лоханки и мочеточников; применение в этом случае возможно, только если ожидаемая польза превышает потенциальный риск), субарахноидальное кровоизлияние, печеночная недостаточность, нарушение функции почек, клапанные пороки сердца, детский возраст до 1 года.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение препарата в период беременности противопоказано. Данные по применению аминокaproновой кислоты у беременных женщин ограничены. В исследованиях на животных были выявлены нарушения фертильности и тератогенный эффект при применении аминокaproновой кислоты.

Период грудного вскармливания

Отсутствуют данные об экскреции аминокaproновой кислоты с грудным молоком, в связи с чем на период лечения необходимо отказаться от грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутривенно капельно. При необходимости достижения быстрого эффекта (острая гиперфибриногенемия) вводят внутривенно капельно до 100 мл раствора со скоростью 50-60 капель в минуту. В течение 1-го часа вводят в дозе 4,0-5,0 г, в случае продолжающегося кровотечения – до полной остановки – по 1,0 г каждый час не более 8 часов. При необходимости введение повторить.

Суточная доза для взрослых составляет 5,0 - 30,0 г.

Суточная доза для детей до 1 года - 3,0 г; 2-6 лет - 3,0-6,0 г; 7-10 лет - 6,0-9,0 г; от 10 лет - как для взрослых. При острых кровопотерях: детям до 1 года - 6,0 г; 2-4 года - 6,0-9,0 г; 5-8 лет - 9,0-12,0 г; 9-10 лет - 18,0 г. Детям - из расчета 100,0 мг/кг массы тела в первый час, затем 33,0 мг/кг/ч, максимальная суточная доза - 18,0 г/м² поверхности тела.

Длительность терапии 3-14 дней.

Побочное действие

Частоту нежелательных реакций классифицировали следующим образом: очень часто (≥ 10 %), часто (от 1 % до 10 %), нечасто (от 0,1 % до 1 %), редко (от 0,01 % до 0,1 %), очень редко ($< 0,01$ %) и неуставленной частоты.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: нечасто - агранулоцитоз, нарушение коагуляции; неуставленной частоты лейкопения, тромбоцитопения;

Нарушения со стороны иммунной системы: нечасто — аллергические и анафилактические реакции; неуставленной частоты — макулопапулезные высыпания;

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 30.09.2024 № 20934
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Нарушения со стороны нервной системы: часто — головокружение, головная боль; очень редко — спутанность сознания, судороги, делирий, галлюцинации, повышение внутричерепного давления, нарушение мозгового кровообращения, обморок;

Нарушения со стороны органа зрения: редко — снижение остроты зрения, слезотечение;

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: часто — шум в ушах;

Нарушения со стороны сердца: нечасто — брадикардия; редко — ишемия периферических тканей;

Нарушения со стороны сосудов: часто — снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия; неуставленной частоты — субэндокардиальное кровоизлияние, тромбоз;

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: часто — заложенность носа; нечасто — одышка; редко — легочная эмболия; неуставленной частоты — воспаление верхних дыхательных путей;

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто — боль в животе, диарея, тошнота, рвота;

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто — кожная сыпь, кожный зуд;

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: нечасто — мышечная слабость, миалгия; редко — повышение активности креатинфосфокиназы, миозит; неуставленной частоты — острая миопатия, миоглобинурия, рабдомиолиз;

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: неуставленной частоты — острая почечная недостаточность, повышение азота мочевины крови, почечная колика, нарушение функции почек;

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: неуставленной частоты — сухая эякуляция.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто — общая слабость, боль и некроз в месте введения; нечасто — отек.

Передозировка

Симптомы: артериальная гипотензия, сердечная и острая почечная недостаточность, судороги, в отдельных случаях возможна гиперкоагуляция с риском тромбообразования и эмболии.

Сообщалось о нескольких случаях острой передозировки при внутривенном введении аминокaproновой кислоты. Симптомы варьировали от отсутствия клинических проявлений и преходящей артериальной гипотензии до тяжелой острой почечной недостаточности, приводящей к смерти. У одного пациента с новообразованием головного мозга в анамнезе и судорогами возникли судороги после болюсного введения 8 г аминокaproновой кислоты.

Однократная доза аминокапроновой кислоты, вызывающая симптомы передозировки или представляющая угрозу для жизни, неизвестна. Некоторые пациенты переносили введение препарата в дозах до 100 г.; в то же время сообщалось о развитии острой почечной недостаточности после введения 12 г аминокапроновой кислоты.

Лечение: прекращение введения препарата, симптоматическая терапия. Аминокапроновая кислота выводится при гемодиализе и перитонеальном диализе.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Можно сочетать с введением раствора декстрозы (глюкозы), гидролизатов и противошоковых растворов.

Нельзя смешивать раствор аминокапроновой кислоты с растворами, содержащими леулезу, пенициллин, а также препараты крови.

Снижение эффективности при одновременном приеме антикоагулянтов прямого и непрямого действия, антиагрегантов.

Одновременное применение аминокапроновой кислоты с препаратами факторов свертывания крови II, VII, IX и X в комбинации [протромбинового комплекса] может сопровождаться риском тромбозов.

В раствор аминокапроновой кислоты не следует добавлять никаких лекарственных средств.

Особые указания

Аминокапроновая кислота ингибирует действие активаторов плазминогена и, в меньшей степени, активность плазмина.

Препарат не следует назначать без определенного диагноза и/или лабораторного подтверждения гиперфибринолиза.

Необходимо установить источник кровотечения перед назначением препарата и контролировать фибринолитическую активность крови и концентрацию фибриногена в крови в процессе лечения.

Кровотечение из верхних мочевыводящих путей

В случаях кровотечения любой этиологии из верхних мочевыводящих путей антифибринолитическая терапия повышает риск образования сгустков крови в почечной лоханке и/или мочеточнике и, соответственно вторичной механической обструкции мочевыводящих путей и развитию анурии. У пациентов с кровотечением из верхних мочевыводящих путей введение аминокапроновой кислоты приводило к инфраренальной обструкции, обусловленной тромбозом клубочковых капилляров или формированием тромбов в почечной лоханке или мочеточниках. Аминокапроновую кислоту следует с осторожностью применять при гематурии, вызванной заболеваниями паренхимы почек,

поскольку в этих условиях часто наблюдается внутрисосудистое осаждение фибрина, что может усугубить поражение почек.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТВЕТУ
от 30.09.2024 № 20934
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Воздействие на скелетные мышцы

В редких случаях, после длительного применения аминокaproновой кислоты, были зарегистрированы поражения скелетной мускулатуры с некрозом мышечных волокон. Клинические проявления могут варьировать от легкой миалгии со слабостью и усталостью до тяжелой проксимальной миопатии с рабдомиолизом, миоглобинурией и острой почечной недостаточностью. При этом наблюдается повышение активности мышечных ферментов в сыворотке крови, прежде всего креатинфосфокиназы (КФК).

Поэтому необходимо контролировать активность КФК у пациентов, находящихся на длительной терапии. Применение аминокaproновой кислоты должно быть прекращено, если наблюдается увеличение активности КФК. Состояние улучшается после отмены аминокaproновой кислоты, однако в случае возобновления терапии возможно повторное развитие миопатии.

При возникновении миопатии с поражением скелетных мышц необходимо учитывать возможность поражения миокарда. Сообщалось об одном случае поражения сердца и печени у человека. Пациент получил аминокaproновой кислоты по 2 г каждые 6 часов в общей дозе 26 г. Смерть наступила в результате продолжающегося кровоизлияния в мозг. При вскрытии были отмечены некротические изменения в сердце и печени.

Тромботические осложнения

Ингибирование фибринолиза аминокaproновой кислотой теоретически может привести к свертыванию крови или тромбозу. Однако нет доказательств того, что введение аминокaproновой кислоты было причиной нескольких зарегистрированных случаев внутрисосудистого тромбоза, которые последовали за этим лечением. Скорее всего, такое внутрисосудистое свертывание было вызвано уже существующим патологическим состоянием пациента (например, наличием ДВС-синдрома). Однако следует с осторожностью применять препарат, если есть подозрения на наличие тромбоза или эмболии, а также при почечной недостаточности. Необходим контроль коагулограммы, особенно при ишемической болезни сердца, после инфаркта миокарда, при патологических процессах в печени.

Неврологические нарушения

В литературе появились сообщения об увеличении частоты некоторых неврологических нарушений, таких как гидроцефалия, церебральная ишемия или церебральный вазоспазм, при применении ингибиторов фибринолиза при лечении пациентов с субарахноидальным кровоизлиянием. Все эти нарушения также были описаны как часть естественного течения субарахноидального кровоизлияния, или как осложнения диагностических процедур (таких, как ангиография). Связь неврологических нарушений с применением антифибринолитических средств остается неясной.

Применение аминокaproновой кислоты может влиять на результат исследований функции тромбоцитов. Сообщалось об увеличении времени кровотечения при непрерывной внутривенной инфузии аминокaproновой кислоты в дозах, превышающих 24 г в сутки.

Прочее

Следует избегать быстрого внутривенного введения препарата в связи с риском развития артериальной гипотензии, брадикардии и нарушений сердечного ритма.

Не рекомендуется применение аминокaproновой кислоты у женщин для профилактики повышенной кровоточивости в родах в связи с повышенным риском тромбообразования в послеродовом периоде.

Не рекомендуется одновременное применение аминокaproновой кислоты с препаратами факторов свертывания крови II, VII, IX и X в комбинации [протромбинового комплекса] и антиингибиторным коагулянтным комплексом в связи с повышенным риском тромбозов.

Следует избегать развития тромбофлебита при внутривенном введении препарата, уделяя особое внимание правильному введению иглы и ее фиксации.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Данные отсутствуют из-за исключительного применения препарата в условиях стационара.

Форма выпуска

Раствор для инфузий, 50 мг/мл.

По 100 мл в бутылки стеклянные для крови, трансфузионных и инфузионных препаратов, закупоренные пробками резиновыми и обжатые алюминиевыми колпачками.

На бутылку наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или мелованной или писчей или самоклеящуюся.

Каждую бутылку вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона для потребительской тары типа хромовый или хром-эрзац.

35 бутылок по 100 мл помещают в ящики из картона гофрированного с приложением инструкций по медицинскому применению в количестве, соответствующем количеству бутылок (для стационаров).

Условия хранения

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

Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 30.09.2024 № 20934
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «Эдвансд Пермь», Россия

Пермский край, Куединский р-н, п. Куеда, ул. Комсомольская, д. 58.

Контактный телефон: +7 (34262) 3-50-90

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии от потребителей

ООО «Эдвансд Фарма», Россия

308010, Белгородская обл., муниципальный район Белгородский, г.п. поселок Северный, пгт.

Северный, ул. Березовая, зд. 5.

О развитии нежелательных реакций, связанных с приемом препарата, сообщать:

ООО «Эдвансд Фарма», Россия

308010, Белгородская обл., Белгородский район, пгт. Северный, ул. Березовая, зд. 5.

Тел.: +7 (4722) 20 23 19

e-mail: factory@atcl.ru