

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 500 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 1000 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: аминосалициловая кислота.

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 500 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка кишечнорастворимая, покрытая пленочной оболочкой, содержит 500 мг натрия аминосалицилата дигидрата.

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 1000 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка кишечнорастворимая, покрытая пленочной оболочкой, содержит 1000 мг натрия аминосалицилата дигидрата.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 500 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Круглые двояковыпуклой формы таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На поперечном разрезе таблетки ядро белого или белого с сероватым оттенком цвета.

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА, 1000 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Продолговатые, двояковыпуклой формы таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с риской на одной стороне. На поперечном разрезе ядро белого или белого с сероватым оттенком цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА показана к применению у взрослых и детей в возрасте от 3 лет для лечения туберкулеза различных форм и локализаций (в комплексе с другими противотуберкулезными препаратами) при множественной лекарственной устойчивости к другим противотуберкулезным средствам.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

9-12 г в сутки (3-4 г 3 раза в день), для истощенных взрослых пациентов (с массой тела менее 50 кг), а также при плохой переносимости препарат назначают в дозе 6 г в сутки.

Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

В условиях амбулаторного лечения можно назначать всю суточную дозу в один приём однократно (в случае хорошей переносимости).

Особые группы пациентов

Пациенты с сопутствующими заболеваниями желудочно-кишечного тракта и начальными формами амилоидоза

Максимальная суточная доза составляет 4-6 г в сутки.

Дети

У детей в возрасте от 3 до 18 лет применяют из расчета 0,15-0,2 г/кг в сутки в 3-4 приема (суточная доза не более 10 г).

Препарат не следует назначать детям в возрасте от 0 до 3 лет для данной лекарственной формы в связи с невозможностью обеспечить режим дозирования.

Способ применения

Внутрь, через 0,5-1 ч после еды, запивая кислыми жидкостями (соки: апельсиновый, яблочный, томатный). Не разжевывать! При повышенной кислотности желудочного сока запивать водой.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к аминосалициловой кислоте (в том числе к другим салицилатам) или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- индивидуальная непереносимость салицилатов (в анамнезе);
- тяжелая почечная или печеночная недостаточность;
- хроническая 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.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Препарат применяют с осторожностью при почечной и/или печеночной недостаточности средней или легкой степени тяжести, компенсированном гипотиреозе, хронической сердечной недостаточности, заболеваниях желудочно-кишечного тракта в анамнезе, сахарном диабете, остром гепатите.

Препарат применяют в комбинациях с противотуберкулезными лекарственными средствами.

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

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.

Неферментное определение глюкозы в крови и уробилиногена в моче при применении аминосалициловой кислоты может давать ложноположительные результаты.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Препарат совместим с другими противотуберкулезными 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 коагулянтов – 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 аминосалициловой 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.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение аминосалициловой кислоты при беременности возможно в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

При необходимости применения аминосалициловой кислоты в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Нет данных по изучению влияния аминосалициловой кислоты на способность управлять транспортными средствами и выполнять другие действия, требующие концентрации внимания и скорости психомоторных реакций. Пациенты должны быть предупреждены о возможности развития паралича, судорог, неврита зрительного нерва.

Учитывая побочные действия лекарственного средства, следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Со стороны крови и лимфатической системы: 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 Леффлера (эозинофильная пневмония, мигрирующий легочный инфильтрат), васкулиты, ангионевротический отек, анафилактический шок, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), синдром Лайелла.

Желудочно-кишечные нарушения: снижение или потеря аппетита, повышенное слюноотделение, тошнота, изжога, рвота, метеоризм, боль в животе, диарея или запор, гепатомегалия, повышение активности «печеночных» трансаминаз, желтуха, лекарственный гепатит, в том числе с летальным исходом, частично выраженным синдромом мальабсорбции, кровотечение из пептической язвы.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: протеинурия, гематурия, глюкозурия, кристаллурия.

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 неё); 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.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1.

Телефон: +7-800-550-99-03, +7-499-578-02-20

Факс: +7-(495)-698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru.

Интернет-сайт: <https://roszdravnadzor.gov.ru>.

4.9. Передозировка

Симптомы

Возможно усиление дозозависимых побочных эффектов препарата.

Лечение

Отмена препарата, симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства, активные в отношении микобактерий; противотуберкулезные средства; аминосалициловая кислота и ее производные.

Код АТХ: [J04AA01].

Механизм действия

Механизм действия связан с угнетением синтеза фолиевой кислоты и подавлением образования микобактина (компонента микобактериальной стенки), что приводит к уменьшению захвата железа *M. tuberculosis*. Аминосалициловая кислота конкурирует с парааминобензойной кислотой (ПАБК) и ингибирует синтез фолиевой кислоты в

микобактериях туберкулеза, подавляет образование микобактина, компонента микобактериальной стенки, что приводит к уменьшению захвата железа *M. tuberculosis*. Аминосалициловая кислота действует на *M. tuberculosis*, находящихся в состоянии активного размножения, и практически не действует на микобактерии в стадии покоя. Слабо влияет на возбудителя, располагающиеся внутриклеточно, активна только в отношении *M. tuberculosis*, не действует на другие нетуберкулезные микобактерии.

Фармакодинамические эффекты

Аминосалициловая кислота обладает бактериостатическим действием в отношении *Mycobacterium tuberculosis* (минимальная подавляющая концентрация *in vitro* 1-5 мкг/мл). Аминосалициловая кислота уменьшает вероятность развития бактериальной устойчивости к стрептомицину и изониазиду. Применяется только в комбинации с другими противотуберкулезными средствами, что замедляет развитие резистентности к ним.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Хорошо всасывается при приеме внутрь. Максимальная концентрация в сыворотке крови после приема внутрь дозы 4 г составляет 20 мкг/мл (может варьировать от 9 до 35 мкг/мл). Среднее время достижения максимальной концентрации в плазме составляет 6 ч (варьирует от 1,5 до 24 ч). Концентрация аминосалициловой кислоты в плазме 2 мг/мл сохраняется в течение 7,9 ч (варьирует от 5 до 9 ч), а 1 мг/мл в среднем в течение 8,8 ч (вариабельность от 6 до 11,5 ч).

Распределение

Связывание с белками плазмы крови – 50-60 %.

Легко проходит через гистогематические барьеры и распределяется по тканям. Высокие концентрации препарата обнаруживаются в почках, легких, печени. В спинномозговую жидкость препарат проникает только при воспалении мозговых оболочек.

Биотрансформация

Метаболизируется в печени.

Элиминация

Аминосалициловая кислота выводится посредством клубочковой фильтрации: 80 % препарата экскретируется почками, более 50 % выводится в ацетилированной форме. Период полувыведения составляет 0,5-1 ч.

Почечная недостаточность, лица пожилого возраста

При почечной недостаточности и у людей пожилого возраста почечная элиминация препарата замедляется.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вспомогательные вещества (ядро):

Гипромеллоза Е5

Повидон К-30

Макрогол 6000

Кремния диоксид коллоидный

Натрия стеарилфумарат

Вспомогательные вещества (оболочка):

Готовая кишечнорастворимая оболочка (*Аквариус Контрол*
ENA MAY318017 белый) с составом:

Метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1)

Макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000)

Тальк

Триэтилцитрат

Титана диоксид

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой 500 мг, 1000 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из плёнки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 5, 10, 20, 50, 100, 375, 500 таблеток в банку из полиэтилена низкого давления, укупоренную крышкой с уплотняющим элементом и компенсатором полимерным.

По 3, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок, или 1 банку с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности ~~при уничтожении использованного~~
лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного
препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.

Тел.: +7 (495) 258-45-28

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации.

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА
доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в
информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org>.