

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 аминосалициловой кислоты (в виде натрия аминосалицилата дигидрата).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сорбитол (см. раздел 4.4.).

Аминосалициловая кислота, 1000 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка кишечнорастворимая, покрытая пленочной оболочкой, содержит 1000 мг аминосалициловой кислоты (в виде натрия аминосалицилата дигидрата).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сорбитол (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой.

Продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета.

На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Аминосалициловая кислота показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 3 лет.

Туберкулез различных форм и локализаций (в комбинации с другими противотуберкулезными средствами), в том числе при множественной лекарственной устойчивости к другим противотуберкулезным препаратам.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Препарат должен назначаться врачом, имеющим опыт применения противотуберкулезных средств.

Режим дозирования

Взрослым – по 9–12 г/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 сутки.

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

Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

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

Дети

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

Способ применения

Внутрь, через 0,5–1 час после еды, запивая кислыми жидкостями (соки: апельсиновый, яблочный, томатный). Таблетки не разжевывать! При повышенной кислотности желудочного сока препарат следует запивать водой.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к аминосалициловой кислоте, к другим салицилатам или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- 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;
- декомпенсированный гипотиреоз;
- эпилепсия;
- тромбофлебит;
- гипокоагуляция;
- период грудного вскармливания;
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- артериальная гипертензия;
- отеки, обусловленные гипернатриемией;

- амилоидоз внутренних органов;
- детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

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

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.

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат Аминосалициловая кислота содержит сорбитол. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Аминосалициловая кислота совместима с другими противотуберкулезными

лекарственными средствами.

Замедляет возникновение резистентности к изониазиду и стрептомицину.

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

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 связываться с белками плазмы крови, 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 аминосалициловой кислоты.

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 приема парааминобензойной кислоты изменяется концентрация тироксина и тиреотропного гормона в крови.

Аммония хлорид повышает риск развития кристаллурии.

Одновременный прием с этионамидом повышает риск развития гепатотоксичности.

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

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 аminosалициловой кислоты в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

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

Нет данных по изучению влияния аminosалициловой 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, и при появлении описанных нежелательных реакций следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции, возможные на фоне терапии аminosалициловой кислотой, распределены по системно-органным классам (СОК) с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\ 000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$, но $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10\ 000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

СОК	Частота	Нежелательная реакция
<i>Инфекции и инвазии</i>	Частота неизвестна	Суперинфекция
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы</i>	Частота неизвестна	Тромбоцитопения; лейкопения (вплоть до агранулоцитоза); нейтропения; лимфоцитоз; эозинофилия; снижение протромбина; увеличение протромбинового времени, сопровождающееся кровотечением и геморрагической пурпурой; гипербилирубинемия; В ₁₂ -дефицитная мегалобластная

		(анемия; ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003) гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса; необычная кровоточивость и кровоподтеки.
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>	Частота неизвестна	Волчаночноподобный синдром, сопровождающийся поражением селезенки, печени, почек, пищеварительного тракта, костного мозга и нервной системы (например, боли корешкового характера, менингизм); перикардит.
<i>Эндокринные нарушения</i>	Частота неизвестна	Гипотиреоз*; зоб (с микседемой или без нее)*.
<i>Нарушения метаболизма и питания</i>	Частота неизвестна	Гипогликемия
<i>Психические нарушения</i>	Частота неизвестна	Психоз
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	Частота неизвестна	Энцефалопатия; неврит зрительного нерва; симптомы паралича.
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>	Частота неизвестна	Снижение или 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 (последствие введения) мальабсорбции; кровотечение из пептической язвы.
Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани	Частота неизвестна	Артралгия; судороги; отек суставов.
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей	Частота неизвестна	Протеинурия; гематурия; глюкозурия; кристаллурия.
Общие нарушения и реакции в месте введения	Частота неизвестна	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; лихорадка; боль в горле.
Лабораторные и инструментальные данные	Частота неизвестна	Повышение концентрации мочевины в плазме крови

*при длительном применении в высоких дозах

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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, стр. 1

Телефон: 8 (800) 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

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: J04AA02

Аминосалициловая кислота обладает бактериостатическим действием в отношении *Mycobacterium tuberculosis* (*M. tuberculosis*) (минимальная подавляющая концентрация *in vitro* 1–5 мкг/мл).

Механизм действия

Аминосалициловая кислота конкурирует с парааминобензойной кислотой 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 микобактерии, находящиеся в состоянии активного размножения, и практически не действует на микобактерии в стадии покоя. Слабо влияет на возбудителя, располагающегося внутриклеточно, активна только в отношении *M. tuberculosis*, не действует на другие нетуберкулезные микобактерии. Уменьшает вероятность развития бактериальной устойчивости к изониазиду и

стрептомицину. Применяется только в комбинации с другими противотуберкулезными средствами, что замедляет развитие резистентности к ним.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Хорошо всасывается при приеме внутрь. Связывание с белками плазмы крови – 50–60 %. Максимальная концентрация в плазме крови после приема внутрь 4 г аминосалициловой кислоты составляет 20 мкг/мл (может варьировать от 9 до 35 мкг/мл). Среднее время достижения максимальной концентрации в плазме крови составляет 6 ч (варьирует от 1,5 до 24 ч).

Концентрация аминосалициловой кислоты в плазме крови 2 мкг/мл сохраняется в течение 7,9 ч (варьирует от 5 до 9 ч), а 1 мкг/мл в среднем в течение 8,8 ч (варьирует от 6 до 11,5 ч).

Распределение

Легко проходит через гистогематические барьеры и распределяется по тканям. Высокие концентрации аминосалициловой кислоты обнаруживаются в легких, почках и печени. В спинномозговую жидкость 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

Аминосалициловая кислота, 500 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Сорбитол

Повидон К-30

Лимонной кислоты моногидрат

Кросповидон

Тальк

Кремния диоксид коллоидный

Кальция стеарат

Пленочная оболочка № 1

Гипромеллоза

Тальк

Титана диоксид

Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

или

Сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

Пленочная оболочка № 2

Сухая смесь, содержащая метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1], тальк, титана диоксид, полоксамер 407, кальция силикат, натрия гидрокарбонат, краситель железа оксид желтый, краситель железа оксид красный, натрия лаурилсульфат.

Аминосалициловая кислота, 1000 мг, таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Сорбитол

Повидон К-30

Лимонной кислоты моногидрат

Кросповидон

Тальк

Кремния диоксид коллоидный

Кальция стеарат

Пленочная оболочка № 1

Гипромеллоза

Тальк

Титана диоксид

Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

или

Сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

Пленочная оболочка № 2

Сухая смесь, содержащая метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1], тальк, титана диоксид, полоксамер 407, кальция силикат, натрия гидрокарбонат, краситель железа оксид желтый, краситель железа оксид красный, натрия лаурилсульфат.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 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

По 100 или 500 таблеток в банке с крышкой с контрольным кольцом (или без него) из полиэтилена высокой плотности.

1 банка вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

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

Нет особых требований.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А

Телефон: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: vertex@vertex.spb.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А

Телефон: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: pharmacovigilance@vertex.spb.ru

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-телекоммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>.