

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Аминокапроновая кислота, 50 мг/мл, раствор для инфузий.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: аминокапроновая кислота.

Каждый мл раствора содержит 50 мг аминокапроновой кислоты.

Каждая упаковка объемом 100 мл содержит 5 г аминокапроновой кислоты.

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

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инфузий.

Бесцветная прозрачная жидкость.

Теоретическая осмолярность – 670 мОсм/л.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. 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 т.ч. 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.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

При необходимости достижения быстрого эффекта (острая фибриногенемия) вводят до 100 мл 50 мг/мл раствора со скоростью 50-60 капель в минуту в течение 15-30 минут. В течение 1-го часа вводят в дозе 4,0-5,0 г (80-100 мл), а затем при необходимости по 1,0 г (20 мл) каждый час

в течение около 8 ч или до полной остановки кровотечения. В случае продолжающегося или повторного кровотечения вливания повторяют каждые 4 часа.

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

Длительность лечения – 3-14 дней.

Особые группы пациентов

Дети

Детям, из расчета 100 мг/кг массы тела в первый час, затем 33 мг/кг/ч; максимальная суточная доза – 18 г/м² поверхности тела. 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 лет – 6,0-9,0 г, 5-8 лет – 9,0-12,0 г, 9-10 лет – 18,0 г.

Длительность лечения – 3-14 дней.

Способ применения

Внутривенно капельно.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к аминокaproновой кислоте или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- склонность к тромбозам и тромбоэмболическим заболеваниям;
- гиперкоагуляция (тромбообразование, тромбоэмболия);
- коагулопатии вследствие диффузного внутрисосудистого свертывания крови;
- нарушения мозгового кровообращения;
- беременность (см. раздел 4.6);
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Артериальная гипотензия, кровотечения из верхних мочевыводящих путей (из-за риска интрааренальной 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, детский возраст до 1 года, клапанные пороки сердца (ввиду отсутствия клинических данных по безопасности и эффективности).

Аминокaproновая 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 развитии анурии. У пациентов с кровотечением из верхних мочевыводящих путей введение аминокaproновой кислоты приводило к инфраренальной обструкции, обусловленной тромбозом клубочковых капилляров или формированием тромбов в почечной лоханке или мочеточниках. Аминокaproновую 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.

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, скорее всего, 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.

Лабораторные тесты

Применение аминокaproновой кислоты может влиять на результаты 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 тромбозов при внутривенном введении препарата, уделяя особое внимание правильному введению иглы и ее фиксации.

Вспомогательные вещества

Данный препарат содержит 15,2 ммоль натрия (350 мг) на 100 мл. Необходимо учитывать пациентам, находящимся на диете с ограничением поступления натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия.

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

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

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.

Лактация

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

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

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции распределены в зависимости от частоты их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$); часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: нечасто – агранулоцитоз, нарушение коагуляции; частота неизвестна – лейкопения, тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы: нечасто – аллергические и анафилактикоидные реакции; частота неизвестна – макулопапулезные высыпания.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головокружение, головная боль; очень редко – спутанность сознания, судороги, бред, галлюцинации, внутричерепная гипертензия, инсульт, обморок.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – снижение зрения, слезотечение.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: часто – шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: нечасто – брадикардия.

Нарушения со стороны сосудов: часто – артериальная гипотензия, ортостатическая гипотензия; редко – периферическая ишемия; частота неизвестна – субэндокардиальное кровоизлияние, тромбоз.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: часто – заложенность носа; нечасто – одышка; редко – тромбоэмболия легочной артерии; частота неизвестна – воспаление верхних дыхательных путей.

Желудочно-кишечные нарушения: часто – боль в животе, диарея, тошнота, рвота.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: нечасто – мышечная слабость, миалгия; редко – повышение активности креатинфосфокиназы (КФК), миозит; частота неизвестна – миопатия, миоглобинурия, рабдомиолиз.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна – увеличение содержания мочевины в сыворотке крови, острая почечная недостаточность, почечная колика, нарушение функции почек.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: частота неизвестна – сухая эякуляция.

Общие нарушения и реакции в месте введения: часто – общая слабость, боль и некроз в месте введения; нечасто – отек, кожная сыпь, кожный зуд.

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.

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения.

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

Телефон: +7 800 550 99 03.

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru.

Сайт: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Артериальная гипотензия, сердечная и острая почечная недостаточность, судороги, в отдельных редких 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 проходящей 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 аминокaproновой 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 аминокaproновой кислоты.

Лечение

Прекращение введения препарата, симптоматическая терапия.

Аминокaproновая кислота выводится при гемодиализе и перитонеальном диализе.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: гемостатические средства; антифибринолитические средства; аминокислоты.

Код АТХ: B02AA01.

Механизм действия

Аминокaproновая кислота относится к синтетическим аналогам лизина. Она ингибирует фибринолиз, конкурентно насыщая лизин-связывающие рецепторы, благодаря которым пламиноген (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.

Фармакодинамические эффекты

Аминокaproновая кислота обладает противоаллергической активностью, усиливает детоксицирующую функцию печени, угнетает антителообразование.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция и распределение

Аминокaproновая 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

Аминокaproновая кислота в небольшой степени метаболизируется до адипиновой кислоты.

Элиминация

Аминокaproновая 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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия хлорид

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Нельзя смешивать раствор аминокaproновой кислоты с растворами, содержащими левулезу, пенициллин, а также препараты крови.

В раствор аминокaproновой кислоты не следует добавлять никаких лекарственных средств.

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

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищенном от света месте, в вертикальном положении (пробкой вверх) при температуре от 0 до 25°C.

Замораживание препарата не допускается.

Несмачиваемость внутренней поверхности бутылки не является противопоказанием к применению препарата.

Хранить в недоступном для детей месте.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 100, 200, 400 мл в стеклянные бутылки для крови, трансфузионных и инфузионных препаратов, закупоренные пробками из резины или пробками из термопластичного эластомера и обжатые колпачками алюминиевыми. На бутылки наклеивают этикетки из бумаги этикеточной марок А или Б или писчей, или из другой бумаги по качеству не ниже указанной, или самоклеящиеся этикетки по спецификации фирмы.

По 1 бутылке вместе с инструкцией по медицинскому применению лекарственного препарата помещают в пачку (вторичную упаковку) из картона для потребительской тары марки А или Б или в мешок (вторичную упаковку) из прозрачной полиэтиленовой пленки.

Для стационаров. Бутылки вместе с инструкциями по медицинскому применению лекарственного препарата в количестве, равном количеству первичных упаковок, помещают в ящик из картона для потребительской тары или в ящик из гофрированного картона с решетками или без решеток в количестве:

Для объема 100 мл – по 36, 44, 48 или 60 стеклянных бутылок;

Для объема 200 мл – по 28, 32, 33, 35 или 40 стеклянных бутылок;

Для объема 400 мл – по 12, 15, 16, 20, 22, 26 или 30 стеклянных бутылок;

По 100, 200, 250, 400, 500, 1000 мл в полимерные контейнеры с самоспадающимся корпусом, сформированные в процессе производства из пленки полиолефиновой или цельной или раздельной рукавной пленки АРР114 из полиолефина и полипропилена, или полипропиленовой пленки ЕМ304 и закупоренные портами из поликарбоната с пробкой из резины и колпачком или портами из полипропилена, или в контейнеры полимерные из полипропилена. На поверхность контейнера наносят текст термопечатью или наклеивают

этикетку из бумаги этикеточной марок А или Б или писчей, или из другой бумаги по качеству не ниже указанной, или самоклеящиеся этикетки по спецификации фирмы.

По 1 полимерному контейнеру вместе с инструкцией по медицинскому применению лекарственного препарата упаковывают в мешок (вторичную упаковку) из прозрачной полиэтиленовой пленки или пачку (вторичную упаковку) из картона для потребительской тары марки А или Б.

Для стационаров. Полимерные контейнеры вместе с инструкциями по медицинскому применению лекарственного препарата в количестве, равном количеству первичных упаковок, помещают в ящик из картона для потребительской тары или в ящик из гофрированного картона в количестве:

Для объема 100 мл – 36, 44, 48 или 60 полимерных контейнера;

Для объема 200 или 250 мл – 28, 32, 33, 35 или 40 полимерных контейнера;

Для объема 400 или 500 мл – 12, 15, 16, 20, 22, 26 или 30 полимерных контейнера;

Для объема 1000 мл – 4, 5, 6, 8 или 10 полимерных контейнера.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «МОСФАРМ» (ООО «МОСФАРМ»)

141342, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н, рп. Богородское, д. 63, литер Б, помещение 32, этаж 2.

Тел./Факс. 8 (496) 5453000.

info@mosfarm.su

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «МОСФАРМ» (ООО «МОСФАРМ»)

141342, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н, рп. Богородское, д. 63, литер Б, помещение 32, этаж 2.

Тел./Факс. 8 (496) 5453000.

info@mosfarm.su

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Аминокапроновая кислота доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>.