

УТВЕРЖДЕНА

Приказом председателя Комитета
контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от « 20 » _____ 01 _____ 2014 года
№ 32 .

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

АМИНОСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА

Торговое название

Аминосалициловая кислота

Международное непатентованное название

Нет

Лекарственная форма

Раствор для инфузий 30 мг/мл

Состав

100 мл препарата содержит

активное вещество - натрия аминосалицилат в пересчете на сухое вещество 3000.0 мг;
вспомогательные вещества - натрия сульфит, динатрия эдетата дигидрат (трилон Б),
вода для инъекций.

Описание

Бесцветная или светло-желтая прозрачная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Противотуберкулезные препараты. Аминосалициловая кислота и ее производные.
Аминосалициловая кислота.

Код АТХ J04AA01

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Особенности клинической фармакологии аминосалициловой кислоты - это быстрое образование в кислой среде токсичного неактивного метаболита и короткий период полувыведения в сыворотке крови, составляющий для несвязанного лекарственного средства один час.

Метаболизируется в печени и частично в желудке. 80 % аминосалициловой кислоты экскретируется с мочой, причём более 50 % выводится в ацетилированной форме. Процесс ацетилирования не обусловлен генетически, как в случае с изониазидом. Натрия пара-аминосалицилат выводится посредством клубочковой фильтрации.

В спинномозговую жидкость препарат проникает только при воспалении мозговых оболочек.

Около 50-60 % аминосалициловой кислоты связывается с белками.

Фармакодинамика

Аминосалициловая кислота обладает бактериостатическим действием в отношении *Mycobacterium tuberculosis*. Она уменьшает вероятность развития бактериальной устойчивости к стрептомицину и изониазиду, механизм действия связан с угнетением синтеза фолиевой кислоты и с подавлением образования 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.

Аминосалициловая кислота активна только в отношении *M. tuberculosis*. Не действует на другие нетуберкулезные микобактерии.

Показания к применению

- различные формы и локализации туберкулеза в комплексе с другими противотуберкулезными препаратами у пациентов с множественной лекарственной устойчивостью к другим противотуберкулезным препаратам

Способ применения и дозы

Внутривенно (в/в), капельно.

Рекомендуемые суточные дозы для взрослых и детей старше 14 лет с массой тела 33-49 кг - 8000 мг, 50-70 кг - 8000-10000 мг, > 70 кг - 10000-12000 мг.

Рекомендуемые суточные дозы для детей - 200-300 мг/кг/сут.

Начинают с 30 капель в минуту и через 15 мин, при отсутствии местных и общих реакций увеличивают до 40-60 капель в минуту.

При первом вливании вводят не более 200 мл препарата, при отсутствии побочных явлений - по 400 мл препарата, 5-6 раз в неделю или через день (чередую с приемом внутрь таблетированной формы). Курс лечения 1-2 месяца или более. Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально в зависимости от тяжести заболевания.

Побочные действия

- снижение или потеря аппетита, повышенное слюноотделение, тошнота, рвота, метеоризм, боль в животе, диарея или запор; повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, боли в правом подреберье, увеличение размеров печени, желтуха, лекарственный гепатит (в т.ч. с летальным исходом)

- тромбоцитопения, лейкопения (вплоть до агранулоцитоза), B12-дефицитная анемия, гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса

- умеренная проходящая микрогематурия, альбуминурия и цилиндрурия, глюкозурия, кристаллурия; возможно повышение уровня мочевины в крови, свидетельствующее о наличии уремической реакции, особенно у пациентов имеющих нарушение функции почек и ацидоз; протеинурия, гематурия

- сыпь (крапивница, пурпура, энантема, эксфолиативный дерматит, синдром, напоминающий инфекционный мононуклеоз или лимфому), лихорадка, отек Квинке, бронхоспазм, артралгия, эозинофилия, редко анафилактический шок

- антигипертензивное действие, зобогенный эффект, лекарственный гипотиреоз, микседема, перикардит, гипогликемия, неврит зрительного нерва, энцефалопатия, синдром Леффлера (эозинофильная пневмония, мигрирующий легочный инфильтрат), васкулит, снижение содержания протромбина, гипокалиемия, суперинфекция

- гематома, флебит

- нарушение баланса кальция и фосфора за счет нарушения обмена витамина D

- колебания артериального давления, боли в области сердца, головная боль

- могут наблюдаться симптомы паралича, тонико-клонических судорог, а также психоза

Противопоказания

- повышенная чувствительность к аминосалициловой кислоте (в т.ч. к другим салицилатам), другим компонентам препарата
- тяжелые заболевания почек и печени (почечная и/или печеночная недостаточность, нефрит нетуберкулезной этиологии, гепатит, цирроз печени)
- декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность
- язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки
- воспалительные заболевания кишечника в стадии обострения
- декомпенсированный гипотериоз
- эпилепсия
- микседема

Лекарственные взаимодействия

Аминосалициловая кислота нарушает всасывание рифампицина, эритромицина и линкомицина. Аминосалициловая кислота нарушает усвоение витамина B12, вследствие чего возможно развитие анемии. Применение препарата вместе с изониазидом или фенитоином приводит к увеличению продолжительности нахождения изониазида или фенитоина в плазме крови. Применение препарата вместе с салицилатами, фенилбутазоном или другими противовоспалительными препаратами, обладающими повышенной способностью связывать белки, приводит к повышению концентрации и увеличению продолжительности нахождения аминосалициловой кислоты в плазме крови. Применение препарата вместе с дифенгидраминам приводит к понижению концентрации аминосалициловой кислоты в плазме крови. Аминосалициловая кислота ингибирует всасывание фолиевой кислоты и может усилить токсичность антагонистов фолиевой кислоты, таких как, например, метотрексат. 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 пара-аминобензойной 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

Несовместимость с другими лекарственными средствами: Аминосалициловую кислоту не следует вводить одновременно с растворами рифампицина и протинамида в общей смеси; эти лекарственные препараты следует вводить отдельно.

Особые указания

Во время лечения необходимо регулярно проводить анализ крови и мочи, осуществлять контроль функции печени (активность «печеночных» трансаминаз). Для предотвращения кристаллурии, необходимо поддерживать нейтральное и щелочное значения pH мочи, особенно имеющей кислую реакцию. Иногда неферментное определение глюкозы и уробилиногена в моче может давать ошибочные положительные результаты.

С осторожностью

Печеночная недостаточность средней степени, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, компенсированный гипотиреоз.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение при беременности возможно, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. На время применения препарата следует прекратить грудное вскармливание.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Нет данных по изучению неблагоприятного воздействия аминосалициловой кислоты на способность управлять транспортным средством и занятия потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Но учитывая побочные действия препарата, следует соблюдать осторожность.

Предупреждение: не использовать при помутнении.

Передозировка

Симптомы: возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: отмена препарата, симптоматическая терапия.

Форма выпуска и упаковка

По 200 мл, 400 мл препарата в бутылки стеклянные вместимостью 250 мл, 450 мл, укупоренные пробками резиновыми, обжатые колпачками алюминиевыми или комбинированными.

От 1 до 24 бутылок по 200 мл, от 1 до 12 бутылок по 400 мл с 1-5 инструкциями по медицинскому применению на государственном и русском языках в ящике из гофрокартона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 15 °С.

Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель, владелец регистрационного удостоверения

ОАО «Красфарма», Россия

660042, г. Красноярск, ул. 60 лет Октября, д. 2.

Тел./факс: (391) 261-25-90 / 261-17-44.

Адрес организации, принимающей претензии от потребителей по качеству препарата на территории Республики Казахстан:

ТОО «Медлайн Фармацевтика»

Республика Казахстан, 050054, г. Алматы, ул. Суюнбая, 162 А.

Тел. (727) 225-00-36, 225-00-37.