

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ПАСК-Эдвансд

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ПАСК-Эдвансд

Международное непатентованное наименование или группировочное наименование:

аминосалициловая кислота

Лекарственная форма: таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

Каждая таблетка кишечнорастворимая, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: аминсалициловая кислота (натрия аминсалицилата дигидрат)
200,00 мг/ 500,00 мг/ 1000,00 мг/ 1500,00 мг/ 2000,00 мг;

вспомогательные вещества: сорбитол 7,00 мг/ 17,50 мг/ 35,00 мг/ 52,50 мг/ 70,00 мг, повидон К30 6,60 мг/ 16,50 мг/ 33,00 мг/ 49,50 мг/ 66,00 мг, кальция стеарат 2,20 мг/ 5,50 мг/ 11,00 мг/ 16,50 мг/ 22,00 мг, лимонной кислоты моногидрат 2,00 мг/ 5,00 мг/ 10,00 мг/ 15,00 мг/ 20,00 мг, кремния диоксид 2,20 мг/ 5,50 мг/ 11,00 мг/ 16,50 мг/ 22,00 мг;

вспомогательные вещества (оболочка): готовое кишечнорастворимое покрытие белого цвета Акрил-Из® (метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] 40,00 %, тальк 37,25 %, титана диоксид 15,00 %, триэтилцитрат 4,80 %, кремния диоксид коллоидный 1,25 %, натрия гидрокарбонат 1,20 %, натрия лаурилсульфат 0,50 %) 22,8 мг/ 57,00 мг/ 114,00 мг/ 171,00 мг/ 228,00 мг.

Описание:

Дозировки 200 мг, 500 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Дозировки 1000 мг, 1500 мг, 2000 мг: капсуловидные таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

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

Код АТХ: J04AA02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Противотуберкулезное средство. Оказывает бактериостатическое действие. Проявляет активность только в отношении *Mycobacterium tuberculosis* (минимальная подавляющая концентрация *in vitro* 1 – 5 мкг/мл). В основе туберкулостатического действия лежит конкуренция с пара-аминобензойной кислотой за активный центр дигидроптероатсинтетазы - фермента, превращающего пара-аминобензойную кислоту в дигидрофолиевую кислоту, и ингибирует синтез фолиевой кислоты в микробной клетке и/или синтез компонентов клеточной стенки микобактерий снижая захват железа последними. По туберкулостатической активности уступает изониазиду и стрептомицину.

Действует на микобактерии, находящиеся в состоянии активного размножения и практически не действует на микобактерии, находящиеся в стадии покоя. Слабо влияет на возбудителя, располагающегося внутриклеточно. Не действует на другие микобактерии. Первичная устойчивость встречается редко, вторичная развивается медленно. Применяется в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными средствами, что замедляет развитие резистентности к ним.

Фармакокинетика

Абсорбция из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) высокая. Максимальная концентрация в плазме крови после приема внутрь дозы 4 г достигается через 1,5 – 2 ч и составляет 20 мкг/мл (от 9 до 75 мкг/мл). Связывание с белками плазмы крови 50 – 70 %. Легко проникает через гистогематические барьеры и распределяется в тканях, проникает в грудное молоко. Высокие концентрации препарата обнаруживаются в легких, почках и печени. Умеренно проникает в спинномозговую жидкость только при воспалении мозговых оболочек, в этом случае концентрация аминсалициловой кислоты в спинномозговой жидкости составляет 10 – 50 % концентрации препарата в плазме крови.

Основной путь метаболизма – ацетилирование. Метаболизируется в печени (более 50 % ацетилируется до неактивных метаболитов) и частично в желудке.

80 % препарата выводится почками путем клубочковой фильтрации, причем 50 % выводится в виде ацетилированного производного. Общий клиренс зависит как от скорости метаболизма, так и от выведения почками. Период полувыведения $T_{1/2}$ при нормальной функции почек – 30 – 60 мин, при хронической почечной недостаточности – до 23 часов.

Проникает в грудное молоко. Экскреция препарата почками замедляется у пациентов пожилого возраста и при почечной недостаточности.

Показания к применению

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

Противопоказания

Повышенная чувствительность к аминосалициловой кислоте (в том числе к другим салицилатам) и другим компонентам препарата, 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).

С осторожностью

Почечная и/или печеночная недостаточность средней или легкой степени тяжести, компенсированный гипотиреоз, хроническая сердечная недостаточность, заболевания ЖКТ в анамнезе, сахарный диабет, острый гепатит.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата при беременности допустимо только в том случае, если возможная польза от лечения для матери превышает потенциальный риск для плода.

В период грудного вскармливания следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания на время лечения препаратом.

Способ применения и дозы

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

Взрослым — по 9 – 12 г/сут (3 – 4 г 3 раза в день), для истощенных взрослых пациентов с массой тела менее 50 кг – 6 г в сутки.

Детям от 3 до 18 лет препарат назначают из расчета 0,15 – 0,2 г/кг/сут на массу тела в 3 – 4 приема, суточная доза — не более 10 г.

В условиях амбулаторного лечения можно назначать всю суточную дозу в один прием, при плохой переносимости – в 2 приема. При сопутствующих заболеваниях ЖКТ и начальных формах амилоидоза максимальная суточная доза – 4 – 6 г/сут. Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: снижение и 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 мальабсорбции, кровотечение из пептической язвы.

Со стороны мочеполовой системы: протеинурия, гематурия, кристаллурия, глюкозурия.

Со стороны органов кроветворения: 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, анафилактический шок, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), ангионевротический отек, синдром Лайелла.

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 нее), 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.

Передозировка

Симптомы: возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: отмена препарата, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместим с другими противотуберкулезными лекарственными 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 антикоагулянтов – производных кумарина и индандиола (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.

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

Особые указания

Аминосалициловую кислоту применяют в комбинации с другими противотуберкулезными средствами. При первых признаках, указывающих на аллергическую реакцию, прием препарата следует 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.

В присутствии аминосалицилатов нарушается проведение тестов на глюкозурию, в которых используются реагенты, содержащие медь.

Развитие протеинурии и гематурии требуют временной отмены препарата.

У пациентов с сахарным диабетом необходимо контролировать концентрацию глюкозы в плазме крови.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Нет данных по изучению влияния аминосалициловой кислоты на способность управлять транспортными средствами и выполнять другие действия, требующие концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Пациенты должны быть предупреждены о возможности развития паралича, судорог, неврита зрительного нерва и при появлении описанных нежелательных явлений следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

Форма выпуска

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой, 200 мг, 500 мг, 1000 мг, 1500 мг, 2000 мг.

По 10 таблеток в блистер из пленки ПВХ (марки ЭП-73) и алюминиевой фольги. По 5, 10, 20, или 30 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона. На пачку наносят стикер.

По 50, 100, 200, 300 или 500 таблеток в пластиковую банку из полиэтилентерефталата, укупоренную пластиковой крышкой из полиэтилена высокой плотности и низкого давления, с контролем первого вскрытия. На банку наклеивают этикетку из бумаги писчей или этикеточной.

1 банку вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона. На пачку наносят стикер.

Для стационара: по 50, 100, 200, 300 или 500 таблеток в пакет из плёнки полиэтиленовой, изготовленной из полиэтилена высокого давления. Полиэтиленовый пакет вместе с инструкцией по медицинскому применению упаковывают в банку из полиэтилентерефталата, укупоренную пластиковой крышкой из полиэтилена высокой плотности и низкого давления,

с контролем первого вскрытия. Свободное пространство в банке заполняют ватой медицинской гигроскопической.

На банку наклеивают этикетку из бумаги писчей или этикеточной. На этикетку наносят стикер.

По 8 банок помещают в групповую упаковку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «Эдвансд Фарма», Россия

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

Контактный телефон: +7 (4722) 20 23 19

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