

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Пасконат®

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Пасконат®

МНН или группировочное название: аминосалициловая кислота

Лекарственная форма: раствор для инфузий

Состав

100 мл раствора содержат:

действующее вещество: натрия аминосалицилата дигидрат 3,0 г;

вспомогательные вещества: динатрия эдетат 0,05 г, натрия сульфит 0,5 г,

воды для инъекций до 100 мл.

Описание

Прозрачная, бесцветная или желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

противотуберкулезное средство.

Код АТХ: J04AA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика: противотуберкулезное средство. Оказывает бактериостатическое действие. В основе туберкулостатического действия лежит конкуренция с парааминобензойной кислотой (ПАБК) за активный центр дигидроптероатсинтетазы – фермента, превращающего ПАБК в

дигидрофолиевую кислоту, и ингибирует синтез фолиевой кислоты в микробной клетке и/или синтез компонентов клеточной стенки микробактерий, снижая захват железа последними. По туберкулостатической активности уступает изониазиду и стрептомицину. Проявляет активность только в отношении *Mycobacterium tuberculosis* (минимальная подавляющая концентрация *in vitro* 1-5 мкг/мл). Действует на микобактерии, находящиеся в состоянии активного размножения и практически не действует на микобактерии в стадии покоя. Слабо влияет на возбудителя, располагающегося внутриклеточно. Не действует на другие микобактерии. Первичная устойчивость встречается редко, вторичная развивается медленно. Применяется только в комбинации с другими противотуберкулезными лекарственными средствами, что замедляет развитие резистентности к ним.

Фармакокинетика:

Максимальные концентрации препарата в крови определяются сразу после введения. Метаболизируется в печени. 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.

За сутки из организма выводится 90-100 % принятой дозы.

Показания к применению

Различные формы и локализации туберкулеза в комплексе с другими противотуберкулезными препаратами. Чаще всего аминосалициловую кислоту назначают пациентам, с множественной лекарственной устойчивостью к другим противотуберкулезным препаратам.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к аминосалициловой кислоте;
- гиперчувствительность к другим салицилатам;
- нарушение функции почек и печени;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки;
- эпилепсия;
- энтероколит в фазе обострения;
- микседема в фазе обострения.

С осторожностью

Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, компенсированный гипотиреоз.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Возможно применение аминосалициловой кислоты при беременности в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости применения аминосалициловой кислоты в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутривенно.

Процесс инфузии путем внутривенного введения должен занимать 2-4 часа. Если введение необходимо проводить в течение более продолжительного периода времени, то рекомендуется поддерживать электролитный баланс с помощью соли калия путем ее перорального введения или добавления определенного количества соответствующего препарата калия для инфузии, исходя из результатов предварительной оценки содержания калия в плазме крови.

Ежедневная доза для взрослых и детей старше 14 лет составляет 10-15 г.

Ежедневная доза для детей в возрасте от 6 до 14 лет составляет 200 мг/кг массы тела. Максимальная суточная доза – 12 г (400 мл раствора).

Для недоношенных детей, новорожденных, младенцев и детей возрастом до шести лет ежедневная доза обычно составляет 200 мг/кг массы тела.

Длительность курса терапии в среднем составляет 1-2 месяца. При необходимости курс может быть продлен.

Интервал введения препарата: рекомендуется вводить суточную дозу препарата 1 раз в сутки. При необходимости суточная доза препарата может быть разделена на 2 введения. Препарат может применяться в интермитирующем режиме, чередуя внутривенное введение и пероральный прием.

Совместимые растворы: смешивать с другими растворами не рекомендуется.

Побочное действие

Аллергические реакции: лихорадка, крапивница, пурпура, энантемы, бронхоспазм, боли в суставах, медикаментозный гепатит. Аллергические реакции могут появиться через несколько дней, хотя в основном они возникают в период между 2-ой и 7-ой неделями лечения (наиболее часто на 4-5 неделе). Также может развиваться отек Квинке, опухание суставов, лихорадка, вызванная введением лекарств, волчаночноподобные реакции, реакции сопровождающиеся поражением селезенки, печени, почек, пищеварительного тракта, костного мозга и нервной системы (например, боли корешкового характера, менингизм, полиморфная экссудативная эритема в виде синдрома Стивенса-Джонсона или синдрома Лайелла). В легких может образовываться временный (в том числе аллергический) инфильтрат (синдром Леффлера).

Со стороны желудочно-кишечного тракта: избыточное слюноотделение, тошнота, рвота, ухудшение или потеря аппетита, боли в животе, диарея, метеоризм, запор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: перикардит, васкулит.

Со стороны нервной системы: неврит зрительного нерва, энцефалопатия.

Со стороны органов кроветворения: эозинофилия, агранулоцитоз, лейкопения, тромбоцитопения, В12-дефицитная анемия, гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса. При длительном курсе лечения с помощью аminosалициловой кислоты в редких случаях может наблюдаться увеличение протромбинового времени, сопровождающееся геморрагической сыпью или кровотечением.

Со стороны мочевыделительной системы: умеренная преходящая микрогематурия, альбуминурия и цилиндрурия, нормогликемическая или гипергликемическая глюкозурия. Кристаллурия может быть предотвращена поддержанием нейтрального или щелочного значения рН мочи. Возможно повышение уровня содержания мочевины в крови, свидетельствующем о наличии уремической реакции, особенно у пациентов, имеющих нарушение функции почек и ацидоз.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: умеренное преходящее повышение активности «печеночных» трансаминаз, иногда сопровождающееся желтухой. Примерно у 25 % пациентов, имеющих аллергическую реакцию на аminosалициловую кислоту, наблюдается поражение печени, причем в 10 % случаев это может привести к возникновению печеночной недостаточности и смертельному исходу.

Со стороны эндокринной системы: при использовании высоких доз, наблюдается ухудшение функции щитовидной железы, сопровождающееся возникновением зоба.

Лабораторные показатели: гипербилирубинемия,

Прочие: синдром, напоминающий инфекционный мононуклеоз или лимфому, гипокалиемия при введении высоких доз препарата, особенно у пожилых пациентов, страдающих отеками и гипертензией, а также у пациентов с менингитом. При введении больших доз препарата потеря катионов может вызвать ацидоз, особенно у детей. Могут наблюдаться

симптомы паралича, тонико-клонических судорог, а также психоза. При длительном применении в высоких дозах – гипотиреоз, суперинфекция.

Передозировка

Симптомы: Возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: Введение препарата следует прекратить, при необходимости – гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Аминосалициловая кислота нарушает всасывание рифампицина, эритромицина и линкомицина.

Аминосалициловая кислота нарушает усвоение витамина В₁₂, вследствие чего возможно развитие анемии.

Применение аминосалициловой кислоты вместе с изониазидом или фенитоином приводит к увеличению продолжительности нахождения изониазида или фенитоина в плазме крови.

Применение аминосалициловой кислоты 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 аминосалициловой кислоты вместе с дифенгидрамином 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.

Аминосалициловую кислоту не следует вводить одновременно с растворами рифампицина и протионамида в общей смеси; эти вещества следует вводить отдельно.

Аминосалициловая кислота 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 парааминобензойной кислоты (ПАБК) изменяется концентрация тироксина (Т4) и тиреотропного гормона (ТТГ) 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

Во время лечения необходимо регулярно проводить анализ крови и мочи, осуществлять контроль функции печени (активность “печеночных” трансаминаз).

Для предотвращения образования кристаллов, необходимо «защелачивать» мочу, особенно имеющую кислую реакцию.

Иногда неферментное определение глюкозы и уробилиногена в моче может давать ошибочные положительные результаты.

Применяют в комбинации с более активными противотуберкулезными лекарственными средствами. Снижение функции почек на фоне туберкулезной интоксикации или специфического туберкулезного поражения не являются противопоказанием к применению. Развитие протеинурии и гематурии требует временной отмены препарата.

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

Эффект на способность управлять механизмами и автомобилем:

Нет данных по изучению неблагоприятного воздействия аминосалициловой кислоты на способность управлять транспортным средством или работать на каких-либо машинах.

Форма выпуска

Раствор для инфузий 30 мг/мл.

По 100мл, 200 мл или 400 мл в бутылки стеклянные для крови, трансфузионных и инфузионных препаратов, закупоренные пробками из резиновой смеси и обжаты колпачками алюминиевыми, или колпачками алюминиево-пластиковыми. Каждую бутылку вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре от +8 °С до +15 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

1,5 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска:

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения и производитель

ООО "Юрия-Фарм"

Адрес производства: Украина, 03680, г. Киев, ул. Н. Амосова, 10

тел./факс +380 (44) 275-92-42; 275-01-08.

Адрес представительства в РФ:

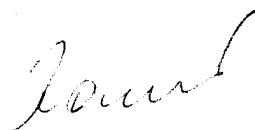
ОАО "Фармасинтез"

123592, Россия, г. Москва, ул. Кулакова, д.20, стр. 1-а

Тел: +7 (495) 750-54-37

Генеральный директор

ООО «Юрия-Фарм»



Н.И. Гуменюк