

Состав и форма выпуска

Белые непрозрачные твердые капсулы размером 2.

Каждая твердая капсула содержит 100 мг полисульфата натрия пентозана.

Вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза, стеарат магния, желатин, диоксид титана (E171).

Фармакологическое действие

Гипотетический механизм действия пентосана с полисульфатом натрия включает местный эффект в мочевом пузыре после системного введения и выведения в мочу путем связывания гликозаминогликанов с дефицитной слизистой мочевого пузыря. Это связывание гликозаминогликанов со слизистой мочевого пузыря снижает бактериальную адгезию к внутренней поверхности мочевого пузыря, и, как следствие, также снижается частота инфекций. Предполагается, что потенциальная барьерная функция полисульфата натрия пентосана вместо поврежденной слизистой уротелия может играть роль противовоспалительной активности полисульфата натрия пентосана.

Фармакокинетика

Абсорбция

Менее 10% перорально вводимого полисульфата натрия пентосана медленно всасывается из желудочно-кишечного тракта и поступает в системную циркуляцию в виде неизмененного полисульфата натрия пентозана или его метаболитов. Все исследования описывают очень низкую системную доступность неизмененного полисульфата натрия пентозана после перорального приема. В целом, сообщаемая системная биодоступность после перорального введения пентосана и полисульфата натрия составляет менее 1%.

Распределение

У здоровых добровольцев однократное парентеральное введение меченного радиоактивным изотопом полисульфата натрия пентосана приводит к постепенному увеличению общей радиоактивности печенью, селезенкой и почкой (через 50 минут после 1 мг / кг внутривенно: 60% дозы в печени 7,7% в селезенке; через 3 часа после введения дозы: 60% в печени плюс селезенка и 13% в мочевом пузыре).

Биотрансформация

Пентосан полисульфат натрия широко метаболизируется путем десульфатации в печени и

селезенке и деполимеризации в почках.

Устранение

Кажущийся период полужизни в плазме полисульфата натрия пентосана зависит от пути введения. В то время как пентосан полисульфат натрия быстро выводится из кровообращения внутривенно. Видимый период полураспада в плазме после перорального введения находится в диапазоне 24-34 часов, соответственно, пероральное введение полисульфата натрия пентосана 3 раза в день, как ожидается, приведет к накоплению полисульфата натрия пентозана в течение первых 7 дней приема (фактор накопления 5-6,7).

После перорального приема непоглощенный пентосан полисульфат натрия выводится преимущественно с калом в неизменном виде. Около 6% введенной дозы пентосан-полисульфата натрия выводится с мочой после десульфатирования и деполимеризации.

Показания к применению

Элмирон показан для лечения болевого синдрома мочевого пузыря, характеризующегося либо гломеруляцией, либо поражением Ханнера у взрослых с болью от умеренной до сильной, срочностью и частотой мочеиспускания.

Способ применения и дозы

Капсулы следует принимать с водой как минимум за 1 час до еды или через 2 часа после еды.

Взрослые

Рекомендуемая доза полисульфата натрия пентосана составляет 300 мг / день, принимаемая в виде одной капсулы по 100 мг перорально три раза в день.

Реакция на лечение пентосаном полисульфатом натрия должна пересматриваться каждые 6 месяцев. Если улучшение не достигается через 6 месяцев после начала лечения, лечение пентозаном полисульфатом натрия следует прекратить. У респондеров лечение пентосаном полисульфатом натрия следует продолжать в хроническом режиме до тех пор, пока сохраняется ответ.

Особые группы населения

Пентосан полисульфат натрия специально не изучался в особых группах пациентов, таких как пожилые люди или пациенты с почечной или печеночной недостаточностью. Для этих пациентов коррекция дозы не рекомендуется.

Детская популяция

Безопасность и эффективность пентосана полисульфата натрия у детей и подростков младше 18 лет не установлена.

Нет доступных данных.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ.

Из-за слабого антикоагулянтного эффекта полисульфата натрия пентозана, Элмирон не должен использоваться у пациентов, которые активно кровоточат. Менструация не является противопоказанием.

Особые предупреждения и меры предосторожности при использовании

Болевой синдром мочевого пузыря является диагнозом исключения, и врач должен устранить другие урологические нарушения, такие как инфекция мочевых путей или рак мочевого пузыря.

Пентосан полисульфат натрия является слабым антикоагулянтом. Пациенты, подвергающиеся инвазивным процедурам или имеющие признаки / симптомы, лежащие в основе коагулопатии или другого повышенного риска кровотечения (из-за лечения другими лекарственными средствами, влияющими на коагуляцию, такими как антикоагулянты, производные гепарина, тромболитические или антиагреганты, включая ацетилсалициловую кислоту, или нестероидные противовоспалительные лекарственные средства) следует оценивать на наличие геморрагических явлений. Пациенты, у которых в анамнезе гепарин или пентозан полисульфат натрия индуцировали тромбоцитопению, должны тщательно контролироваться при лечении пентозаном полисульфатом натрия.

Печеночная или почечная недостаточность

Элмирон не был изучен у пациентов с печеночной или почечной недостаточностью. Поскольку имеются доказательства печеночного и почечного вклада в элиминацию полисульфата натрия пентозана, печеночная или почечная недостаточность может оказывать влияние на фармакокинетику полисульфата натрия пентосана. Пациенты с соответствующей печеночной или почечной недостаточностью должны тщательно контролироваться при лечении пентосаном полисульфатом натрия.

Редкие случаи пигментной макулопатии были зарегистрированы с использованием пентосана полисульфата натрия (PPS), особенно после длительного использования. К визуальным симптомам могут относиться жалобы на затруднения при чтении, искажения зрения, изменение цветового зрения и / или медленная адаптация к низкой или пониженной освещенности.

Все пациенты должны проходить офтальмологическое обследование после 6 месяцев использования PPS для раннего выявления пигментной макулопатии и, при отсутствии патологических результатов, регулярно после 5 лет использования (или раньше, в случае визуальных жалоб). Однако в случае соответствующих офтальмологических результатов следует проводить ежегодное обследование. В таких ситуациях следует рассмотреть

прекращение лечения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

Исследование на здоровых субъектах не выявило фармакокинетических или фармакодинамических взаимодействий между терапевтическими дозами варфарина и пентозана полисульфата натрия. Никаких дальнейших исследований взаимодействия не проводилось.

Из-за слабого антикоагулянтного эффекта полисульфата натрия пентосана, пациенты, которых одновременно лечат антикоагулянтами, производными гепарина, тромболитическими или антиагрегантными средствами, включая ацетилсалициловую кислоту или нестероидные противовоспалительные лекарственные средства, должны быть оценены на предмет любого геморрагического события, чтобы адаптировать лечение.

Беременность и кормление грудью

Нет данных о применении пентосана с полисульфатом натрия у беременных. Исследования на животных в отношении репродуктивной токсичности не проводились.

Элмирон не рекомендуется во время беременности.

Грудное вскармливание

Неизвестно, выводится ли из организма пентосан полисульфат натрия или его метаболиты в материнском молоке.

Риск для новорожденных / младенцев не может быть исключен.

Поэтому пентосан полисульфат натрия не следует использовать во время кормления грудью.

Влияние на способность управлять автомобилем и использовать машины

Пентосан полисульфат натрия не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять автомобилем и пользоваться машиной.

Побочные реакции

Расстройства крови и лимфатической системы: анемия, экхимоз, кровотечение, лейкопения, тромбоцитопения, нарушения коагуляции.

Расстройство иммунной системы: светочувствительность, аллергические реакции.

Нарушения обмена веществ и питания: анорексия, прибавка в весе, похудение.

Психические расстройства: тяжелая эмоциональная способность / депрессия.

Расстройства нервной системы: головная боль, головокружение, повышенное потоотделение, бессонница, гиперкинезия, парестезия.

Глазные расстройства: слезотечение, амблиопия, расстройства уха, звон в ушах

Респираторные, грудные расстройства и средостения: диспноэ.

Желудочно-кишечные расстройства: тошнота, диарея, диспепсия, боль в животе, живот увеличен, кровотечение из прямой кишки, расстройство желудка, рвота, язва рта, метеоризм, запор.

Заболевания кожи и подкожной клетчатки: периферический отек, алопеция, сыпь, увеличенный размер родинки

Опорно-двигательный аппарат и соединительная ткань: боль в спине, миалгия, артралгия.

Почечные и мочевые расстройства: частое мочеиспускание.

Общие расстройства: астения, тазовая боль, нарушения функции печени.

Передозировка

В случае случайной передозировки, пациенты должны быть оценены на наличие потенциальных побочных эффектов пентосана полисульфата натрия, таких как желудочно-кишечные симптомы или кровотечение. В случае возникновения побочных реакций лечение может быть приостановлено до тех пор, пока симптомы не исчезнут, и лечение следует продолжить в рекомендованной дозе после критического уравнивания рисков после этого.

Условия хранения

При комнатной температуре, в месте, недоступном для детей.

Срок годности

3 года.

Категория отпуска

По рецепту.