Басиджен



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ципрофлоксацин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для инфузий	**1 мл**
ципрофлоксацин	2 мг

100 мл - флаконы (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство широкого спектра действия, производное хинолона, подавляет бактериальную ДНК-гиразу (топоизомеразы II и IV, ответственные за процесс суперспирализации хромосомной ДНК вокруг ядерной РНК, что необходимо для считывания генетической информации), нарушает синтез ДНК, рост и деление бактерий; вызывает выраженные морфологические изменения (в т.ч. клеточной стенки и мембран) и быструю гибель бактериальной клетки.

Действует бактерицидно на грамотрицательные организмы в период покоя и деления (т.к. влияет не только на ДНК-гиразу, но и вызывает лизис клеточной стенки), на грамположительные микроорганизмы действует только в период деления.

Низкая токсичность для клеток макроорганизма объясняется отсутствием в них ДНК-гиразы. На фоне приема ципрофлоксацина не происходит параллельной выработки устойчивости к другим антибиотикам, не принадлежащим к группе ингибиторов ДНК-гиразы, что делает его высокоэффективным по отношению к бактериям, которые устойчивы, например к аминогликозидам, пенициллинам, цефалоспоринам, тетрациклинам.

К ципрофлоксацину чувствительны *грамотрицателъные аэробные бактерии:* энтеробактерин (Escherichia coli, Salmonella spp., Shigella spp., Citrobacter spp., Klebsiella spp., Enterobacter spp., Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Serratia marcescens, Hafnia alvei, Edwardsiella tarda, Providencia spp., Morganella morganii, Vibrio spp., Yersinia spp.), другие грамотрицательные бактерии (Haemophilus spp., Pseudomonas aeruginosa, Moraxella catarrhalis, Aeromonas spp., Pasteurella multocida, Plesiomonas shigelloides, Campylobacter jejuni, Neisseria spp.), некоторые внутриклеточные возбудители - Legionella pneumophila, Brucella spp., Listeria monocytogenes, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium kansasii;

грамположительные аэробные бактерии: Staphylococcus spp. (Staphylococcus aureus, Staphylococcus haemolyticus, Staphylococcus hominis, Staphylococcus saprophyticus), Streptococcus spp. (Streptococcus pyogenes, Streptococcus agalactiae). Активен в отношении Bacillus anthracis.

Большинство стафилококков, устойчивых к метициллину, резистентны и к ципрофлоксацину. Чувствительность Streptococcus pneumoniae, Enterococcus faecalis, Mycobacterium avium (расположенных внутриклеточно) - умеренная (для их подавления требуются высокие концентрации).

К препарату резистентны: Bacteroides fragilis, Pseudomonas cepacia, Pseudomonas maltophilia, Urcaplasma urcalyticum, Clostridium difficile, Nocardia asteroides. Неэффективен в отношении Treponema pallidum.

Резистентность развивается крайне медленно, поскольку, с одной стороны, после действия ципрофлоксацина практически не остается персистирующих микроорганизмов, а с другой - у бактериальных клеток нет ферментов, инактивирующих его.

Фармакокинетика

После в/в инфузии 200 мг время достижения C_{max} - 60 мин, C_{max} – 2.1 мкг/мл, связь с белками плазмы - 20-40%. Хорошо распределяется в тканях организма. Концентрация в тканях в 2-12 раз выше, чем в плазме. Терапевтические концентрации достигаются в слюне, миндалинах, печени, желчном пузыре, желчи, кишечнике, органах брюшной полости и малого таза (эндометрии, фаллопиевых трубах и яичниках, матке), семенной жидкости, ткани предстательной железы, почках и мочевыводящих органах, легочной ткани, бронхиальном секрете, костной ткани, мышцах, синовиальной жидкости и суставных хрящах, перитонеальной жидкости, коже. В спинно-мозговую жидкость проникает в небольшом количестве, где его концентрация при отсутствии воспаления мозговых оболочек составляет 6-10% от таковой в плазме крови, а при воспаленных - 14-37%. Ципрофлоксацин хорошо проникает также в глазную жидкость, плевру, брюшину, лимфу, через плаценту. Концентрация ципрофлоксацина в нейтрофилах крови в 2-7 раз выше, чем в плазме крови.

Метаболизируется в печени (15-30%) с образованием малоактивных метаболитов (диэтилципрофлоксацин, сульфоципрофлоксацин, оксоципрофлоксацин, формилципро-флоксацин).

$T_{1/2}$ — 5-6 ч, при хронической почечной недостаточности — до 12 ч. Выводится в основном почками путем канальцевой фильтрации и канальцевой секреции в неизмененном виде (50-70%) и в виде метаболитов (10%), остальная часть — через желудочно-кишечный тракт. Небольшое количество выводится с грудным молоком. После в/в введения концентрация в моче в течение первых 2 ч после введения почти в 100 раз больше, чем в плазме крови, что значительно превосходит минимальную подавляющую концентрацию (МПК) для большинства возбудителей инфекций мочевыводящих путей. Почечный клиренс - 3-5 мл/мин/кг; общий клиренс - 8-10 мл/мин/кг.

При хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина (КК) выше 20 мл/мин) процент выводимого через почки препарата снижается, но кумуляции в организме не происходит вследствие компенсаторного увеличения метаболизма препарата и выведения через желудочно-кишечный тракт.

Показания к применению:

Бактериальные инфекции, вызванные чувствительными к ципрофлоксацину микроорганизмами:

— заболевания нижних дыхательных путей (обострение хронического бронхита, пневмония, бронхоэктатическая болезнь, инфекционные осложнения муковисцидоза);

— инфекции ЛОР-органов (острый синусит);

— инфекции почек и мочевыводящих путей (цистит, пиелонефрит);

— осложненные интраабдоминальные инфекции (в комбинации с метронидазолом), в т.ч. перитонит;

— хронический бактериальный простатит;

— неосложненная гонорея;

— брюшной тиф;

— инфекционная диарея (в том числе кампилобактериоз, шигеллез, диарея "путешественников");

— инфекции кожи и мягких тканей (инфицированные язвы, раны, ожоги, абсцессы, флегмона);

— костей и суставов (остеомиелит, септический артрит);

— септицемия;

— инфекции на фоне иммунодефицита (возникающего при лечении иммунодепрессивными лекарственными средствами или у больных с нейтропенией);

— профилактика и лечение легочной формы сибирской язвы. Профилактика инфекций при хирургических вмешательствах.

Дети:

— терапия осложнений, вызванных Pseudomonas aeruginosa у детей с муковисцидозом легких от 5 до 17 лет;

— профилактика и лечение легочной формы сибирской язвы (инфицирование Bacillus anthracis).

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Артрит
- Артроз
- Бронхит
- Бронхоэктатическая болезнь
- Брюшной тиф
- Гонорея
- Диарея
- Инфекции
- Муковисцидоз
- Ожоги
- Остеомиелит
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Простатит
- Раны
- Синусит
- Флегмона
- Цистит
- Шигеллез

Противопоказания:

Гиперчувствительность к ципрофлоксацину, любому другому компоненту препарата или другим препаратам из группы фторхинолонов, одновременный прием с тизанидином (риск выраженного снижения артериального давления, сонливости), детский и подростковый возраст до 18 лет (кроме терапии осложнений, вызванных Pseudomonas aeruginosay детей с муковисцидозом легких от 5 до 17 лет); профилактики и лечения легочной формы сибирской язвы). *С осторожностью:* выраженный атеросклероз сосудов головного мозга, нарушение мозгового кровообращения, психические заболевания, эпилепсия, выраженная почечная и/или печеночная недостаточность, пожилой возраст, поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении хинолонами.

Способ применения и дозы:

Раствор для инфузий вводят в/в капельно. Длительность в/в вливания 200 мг (100 мл инфузионного раствора) должна составлять не менее 30 мин. Инфузионные растворы, готовые к использованию, можно смешивать с 0.9% раствором натрия хлорида, раствором Рингера и Рингер-лактата, 5% и 10% раствором декстрозы, 10% раствором фруктозы, а также раствором, содержащим 5% раствор декстрозы с 0.225-0.45% раствором натрия хлорида.

При инфекциях нижних дыхательных путей - 200-400 мг 2 раза в сут.

При инфекциях мочевыводящих путей: острые неосложненные - 100 мг 2 раза в сут; цистит у женщин (до менопаузы) - однократно 100 мг; осложненные - 200 мг 2 раза в сут.

При неосложненной гонорее - 100 мг однократно, при экстрагенитальной - 100 мг 2 раза в сут.

Инфекционная диарея - 200 мг 2 раза, курс лечения - 5-7 дней.

Особо тяжелые инфекции (стрептококковая пневмония, инфекционные осложнения муковисцидоза, инфекции костей и суставов, септицемия, перитонит), особенно вызванные Pseudomonas, Staphylococcus - 400 мг 3 раза в сут.

Легочная форма сибирской язвы (лечение и профилактика) - 400 мг 2 раза в сут.

Для профилактики инфекций при хирургических вмешательствах — 200-400 мг за 0.5-1 ч до операции; при продолжительности операции свыше 4 ч вводят повторно в той же дозе.

При других инфекциях (в зависимости от тяжести течения) - 200-400 мг 2 раза в сут.

Пациентам пожилого возраста назначают более низкие дозы в зависимости от тяжести инфекции и показателя КК.

В педиатрии:

При лечении осложнений, вызванных Pseudomonas aeruginosay детей с муковисцидозом легких от 5 до 17 лет - 10 мг/кг 3 раза в сут (максимальная доза 1200 мг). Продолжительность лечения - 10-14 дней.

При легочной форме сибирской язвы (профилактика и лечение) - 10 мг/кг 2 раза в день. Максимальная разовая доза - 400 мг, суточная - 800 мг. Общая продолжительность приема ципрофлоксацина - 60 дней.

Применение у больных с хронической почечной недостаточностью:

При скорости клубочковой фильтрации (КК 31-60 мл/мин/1.73 кв.м или плазменной концентрации креатинина от 1.4 до 1.9 мг/100 мл) максимальная суточная доза - 800 мг. При скорости клубочковой фильтрации (КК ниже 30 мл/мин/1.73 кв.м или плазменной концентрации креатинина выше 2 мг/100 мл) и при проведении гемодиализа максимальная суточная доза - 400 мг; при гемодиализе ципрофлоксацин вводят после сеанса гемодиализа. При перитонеальном диализе инфузионный раствор добавляется к диализату (внутриперитонеально) в дозе 50 мг на 1 л диализата 4 раза в сут (каждые 6 ч).

Средний курс лечения: 1 день - при острой неосложненной гонорее и цистите; до 7 дней - при инфекциях почек, мочевыводящих путей и брюшной полости; в течение всего периода нейтропенической фазы у больных с ослабленными защитными силами организма, но не более 2 месяцев - при остеомиелите и 7-14 дней - при всех остальных инфекциях. При стрептококковых инфекциях в связи с опасностью поздних осложнений лечение должно продолжаться не менее 10 дней.

Лечение следует проводить еще не менее 3 дней после нормализации температуры тела или исчезновения клинических симптомов.

После в/в применения можно продолжить лечение перорально.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, диарея, рвота, боль в животе, метеоризм, снижение аппетита, холестатическая желтуха (особенно у пациентов с перенесенными заболеваниями печени), гепатит, гепатонекроз.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, повышенная утомляемость, тревожность, тремор, бессонница, "кошмарные" сновидения, периферическая паралгезия (аномалия восприятия чувства боли), повышение внутричерепного давления, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, а также другие проявления психотических реакции (изредка прогрессирующих до состояний, в которых пациент может причинить себе вред), мигрень, обморочные состояния, тромбоз церебральных артерий.

Со стороны органов чувств: нарушения вкуса и обоняния, нарушение зрения (диплопия, изменение цветовосприятия), шум в ушах, снижение слуха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, нарушения сердечного ритма, снижение артериального давления.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, гранулоцитопения, анемия, тромбоцитопения, лейкоцитоз, тромбоцитоз, гемолитическая анемия.

Лабораторные показатели: гипопротромбинемия, повышение активности "печеночных" трансаминаз и щелочной фосфатазы, гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, гипергликемия.

Со стороны мочевыделительной системы: гематурия, кристаллурия (прежде всего при щелочной реакции мочи и шоком диурезе), гломерулонефрит, дизурия, полиурия, задержка мочи, альбуминурия, уретральные кровотечения, снижение азотовыделительной функции почек, интерстициальный нефрит.

Аллергические реакции: кожный зуд, крапивница, образование волдырей, сопровождающихся кровотечениями, и появление маленьких узелков, образующих струпья, лекарственная лихорадка, точечные кровоизлияния на коже (петехии), отек лица или гортани, одышка, эозинофилия, васкулит, узловатая эритема, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия, артрит, тендовагинит, разрывы сухожилий, миалгия.

Местные реакции: флебит, болезненность в месте введения.

Прочие: астения, суперинфекции (кандидоз, псевдомембранозный колит), повышенное потоотделение, "приливы" крови к лицу, повышенная светочувствительность.

Передозировка:

Лечение: специфический антидот неизвестен. Необходимо тщательно контролировать состояние больного, провести другие меры неотложной помощи, обеспечить достаточное поступление жидкости. С помощью гемо- или перитонеального диализа может быть выведено лишь незначительное (менее 10%) количество препарата.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан: беременность, период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Вследствие снижения активности процессов микросомального окисления в гепатоцитах повышает концентрацию и удлиняет период полувыведения теофиллина и других ксантинов (например кофеина), пероральных гипогликемических лекарственных средств, непрямых антикоагулянтов (усиление действия), способствует снижению протромбинового индекса. При сочетании с другими противомикробными лекарственными средствами (бета-лактамные антибиотики, аминогликозиды, клиндамицин, метронидазол) обычно наблюдается синергизм; может успешно применяться в комбинации с азлоциллином и цефтазидимом при инфекциях, вызванных Pseudomonas spp.; с мезлоциллином, азлоциллином и другими бета-лактамными антибиотиками - при стрептококковых инфекциях; с изоксазолилпенициллинами и ванкомицином - при стафилококковых инфекциях; с метронидазолом и клиндамицином - при анаэробных инфекциях.

Усиливает нефротоксическое действие циклоспорина, отмечается увеличение концентрации сывороточного креатинина, у таких пациентов необходим контроль этого показателя 2 раза в неделю.

Нестероидные противовоспалительные препараты (исключая ацетилсалициловую кислоту) повышают риск развития судорог.

Совместное назначение урикозурических лекарственных средств приводит к замедлению выведения (до 50%) и повышению плазменной концентрации ципрофлоксацина. Повышает C_{max} в 7 раз (от 4 до 21 раза) и AUC в 10 раз (от 6 до 24 раз) тизанидина, что повышает риск выраженного снижения артериального давления и сонливости.

Инфузионный раствор фармацевтически несовместим со всеми инфузионными растворами и лекарственными средствами, которые физико-химически неустойчивы при кислой среде (pH инфузионного раствора ципрофлоксацина – 3.5-4.6). Нельзя смешивать раствор для внутривенного введения с растворами, имеющими pH более 7.

Особые указания и меры предосторожности:

Ципрофлоксацин не является препаратом выбора при подозреваемой или установленной пневмонии, вызванной Streptococcus pneumoniae.

При одновременном в/в введении ципрофлоксацина и лекарственных средств для общей анестезин из группы производных барбитуровой кислоты необходим постоянный контроль частоты сердечных сокращений, артериального давления, электрокардиограммы. Во избежание развития кристаллурии недопустимо превышение рекомендованной суточной дозы, необходимо также достаточное потребление жидкости и поддержание кислой реакции мочи.

Больным с эпилепсией, приступами судорог в анамнезе, сосудистыми заболеваниями и органическими поражениями головного мозга, в связи с угрозой развития побочных реакций со стороны центральной нервной системы, ципрофлоксацин следует назначать только по "жизненным" показаниям.

При возникновении во время или после лечения тяжелой и длительной диареи следует исключить диагноз псевдомембранозного колита, который требует немедленной отмены препарата и назначения соответствующего лечения.

При появлении болей в сухожилиях или первых признаков тендовагинита лечение следует прекратить (описаны отдельные случаи воспаления и даже разрыва сухожилий во время лечения фторхинолонами).

В период лечения следует избегать контакта с прямыми солнечными лучами, искусственного УФ-облучения.

Влияние на способность управлять механизмами и автомобилем. Пациентам, принимающим ципрофлоксацин, следует воздержаться от вождения автомобиля и занятия другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: выраженная почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: выраженная печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилой возраст. Пациентам пожилого возраста назначают более низкие дозы в зависимости от тяжести инфекции и показателя КК.

Применение в детском возрасте

Противопоказан: детский и подростковый возраст до 18 лет (кроме терапии осложнений, вызванных Pseudomonas aeruginosay детей с муковисцидозом легких от 5 до 17 лет

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 3 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Basidzhen