Цикломицин Плюс



Код АТХ:

- J04AB01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пиридоксин
- Циклосерин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
циклосерин	250 мг
пиридоксина гидрохлорид	10 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный препарат.

Циклосерин - бактерицидный антибиотик широкого спектра действия, нарушает синтез клеточной стенки, действуя как конкурентный антагонист D-аланина, подавляет ферменты, ответственные за синтез клеточной стенки. Активен в отношении трамотрицательных микроорганизмов в концентрации 10-100 мг/л (Rickettsia spp., Treponema spp). Минимальная подавляющая концентрация (МПК) по отношению к Mycobacterium tuberculosis составляет 3-25 мг/л на жидкой и 10-20 мг/л и более - на плотной питательной среде. Лекарственная устойчивость возникает медленно (после 6 месяцев лечения развивается в 20-60% случаев).

Пиридоксин, входящий в состав препарата, уменьшает выраженность побочных реакций циклосерина со стороны ЦНС.

Фармакокинетика

Циклосерин быстро всасывается из ЖКТ. Абсорбция после перорального приема - 70-90%. Практически не связывается с белками плазмы. Время достижения максимальной концентрации (TC_{max}) - 3-4 ч. После приема 250 мг каждые 12 ч максимальная концентрация (C_{max}) - 25-30 мкг/мл. Хорошо проникает в жидкости и ткани организма. Проникает в лимфоидную ткань, ткани легких, плевральную и асцитическую жидкости, мокроту, желчь, грудное молоко. В брюшной и плевральной полостях содержится 50-100% от концентрации препарата в сыворотке крови. Проходит плацентарный барьер и гематознцефалический барьер (концентрация в цереброспинальной жидкости соответствует концентрации в плазме, определяется в амниотической жидкости и крови плода). Метаболизируется около 35% введенной дозы. Выделяется, в основном, почками в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации (50% - обнаруживается в моче в течение 12 ч, 65-70% в пределах 24-72 ч), небольшие количества выводятся кишечником. Период полувыведения циклосерина ($T_{1/2}$) при нормальной функции почек около 10 ч. При хронической почечной недостаточности через 2-3 дня могут возникнуть явления кумуляции.

Пиридоксин быстро всасывается на всем протяжении тонкой кишки, большее количество абсорбируется в тощей кишке. Метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов (пиридоксаль фосфат и пиридоксаминофосфат). Пиридоксаль фосфат с белками плазмы связывается на 90%. Хорошо проникает во все ткани, накапливается преимущественно в печени, меньше - к мышцах и ЦНС. Проникает через плаценту, секретируется с грудным молоком. Выводится почками. Период полувыведения пиридоксина ($T_{1/2}$) - 15-20 дней.

Показания к применению:

— в составе комбинированной терапии после неудачного адекватного лечения основными лекарственными средствами в случае чувствительности микроорганизмов к циклосерину;

— активный туберкулез легких, внелегочный туберкулез (в том числе поражение почек), хронические формы туберкулеза;

— сочетание туберкулеза с острыми инфекциями мочевыводящих путей, вызванных чувствительными штаммами грамположительных и грамотрицательных бактерий, в особенности Klebsiella spp. Enterobacter spp., Escherichia coli при неэффективности основных лекарственных средств;

— атипичные микобактериальные инфекции (в т.ч. вызванные Mycobacterium avium).

Относится к болезням:

- Инфекции
- Туберкулез

Противопоказания:

— гиперчувствительность к компонентам препарата;

— органические заболевания ЦНС;

— эпилепсия;

— депрессия;

— выраженное состояние возбуждения;

— психоз;

— хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинииа менее 50 мл/мин);

— острая и хроническая сердечная недостаточность;

— алкоголизм;

— наркомания;

— беременность;

— период лактации;

— детский возраст до 3 лет.

С осторожностью

— нарушение функции почек (риск возникновения явлений кумуляции препарата);

— детский возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, непосредственно перед приемом пищи (при раздражении слизистой оболочки ЖКТ - после еды).

Взрослым назначают по 12.5 мг/кг массы тела или 500-750 мг/сутки (по циклосерину) в 2-3 приема (начальная доза циклосерина 250 мг каждые 12 ч в течение первой недели, затем при необходимости с учетом переносимости дозу осторожно увеличивают до 250 мг каждые 6-8 ч под контролем уровня циклосерина в крови). Высшая разовая доза циклосерина для взрослых - 250 мг; максимальная суточная доза - 1 г. Пациентам старше 60 лет, а также с массой тела менее 50 кг назначают по 250 мг (но циклосерину) 2 раза в сутки.

У детей начальная доза циклосерина составляет 10-20 мг/кг массы тела в сутки, максимальная суточная доза - 750 мг.

Побочное действие:

При лечении могут наблюдаться побочные явления, обусловленные главным образом влиянием циклосерина на нервную систему. Эти явления обычно проходят при уменьшении дозы или отмене препарата.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: судороги, сонливость, головная боль, тремор, дизартрия, головокружение, спутанность сознания и нарушение ориентации, сопровождающиеся потерей памяти, психозы (в т.ч. с суицидальными попытками), раздражительность, агрессивность, периферические парезы, гиперрефлексия, парестезия, большие и малые приступы клонических судорог, кома.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, изжога, диарея, повышение активности "печеночных" аминотрансфераз в сыворотке.

Со стороны сердечно-сосудистой системы и системы кроветворения: сидеробластная и мегалобластная анемия, при применении в дозе 1 г/сут обострение хронической сердечной недостаточности.

Прочие: дефицит цианокобаламина и фолиевой кислоты, аллергические реакции (кожная сыпь, зуд, лихорадка, усиление кашля).

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются или отмечиются любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, следует немедленно сообщить об этом врачу.

Передозировка:

Передозировка наблюдается при концентрации циклосерина в плазме 25-30 мг/мл (прием высоких доз, нарушение почечного клиренса). Острое отравление может возникнуть при приеме внутрь более 1 г в сутки. Симптомы хронической интоксикации возникают при длительном приеме циклосерина в дозе более 500 мг в сутки.

Симптомы: головная боль, головокружение, повышенная раздражительность, парестезия, дизартрия, парез, судороги, психоз, спутанность или потеря сознания (кома).

Лечение: симптоматическое (активированный уголь, противосудорожные и седативные средства). Эффективен гемодиализ. Для профилактики нейротоксических эффектов вводят пиридоксин из расчета 200-300 мг/сут. Все мероприятия проводятся на фоне отмены препарата.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности.

Проникает в грудное молоко, при необходимости применения препарата на время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Циклосерин увеличивает скорость выведения пиридоксина почками. Снижает резистентность к изониазиду, стрептомицину и парааминосалициловой кислоте (ПАСК). Изониазид усиливает токсическое действие препарата на центральную нервную систему (увеличивает частоту возникновения головокружения, сонливости; может

потребоваться коррекция дозы обоих препаратов).

Этионамид усиливает нейротоксическос действие циклосерина (одновременный прием этионамида повышает риск возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно судорожного синдрома).

Пиридоксин уменьшает интенсивность побочных реакций циклосерина со стороны нервной системы. Усиливает действие диуретиков, ослабляет активность леводоны.

Изониазид, пеницилламин, циклосерин и эстрогенсодержашие пероральные контрацептивы ослабляют эффект пиридоксина.

Этанол увеличивает риск развития судорог, особенно у лиц, страдающих хроническим алкоголизмом.

Особые указания и меры предосторожности:

При монотерапии вотможно быстрое развитие устойчивости микобактерий к циклосерину, поэтому препарат следует применять только в сочетании с другими противотуберкулезными средствами в случае отсутствия эффекта от лечения препаратами первой линии, такими как стрептомицин, изониазид, рифампицин, этамбутол. Перед началом лечения необходимо выделить культуру микроорганизмов, определить чувствительность штамма к циклосерину и другим противотуберкулезным препаратам. В период лечении не допускается употребления алкоголя.

Для выявления признаков токсического действия препарата на ЦНС необходимо тщательное наблюдение за пациентами, получающими циклосерин в дозе свыше 500 мг/сут. Прием препарата следует производить под контролем уровня циклосерина в крови (концентрация циклосерина не должна превышать 30 мг/мл при более высокой концентрации вероятны проявления токсичности). В период лечения следует также контролировать гематологические показатели, функцию почек и печени. У пациентов со сниженной функцией почек необходимо еженедельно контролировать анализ мочи. Для профилактики нейротоксических эффектов (в том числе судорог, возбуждения, тремора) в период лечения возможно назначение противосудорожных и седативных средств, препаратов бензодиазепинового ряда (диазепам) и ноотропных препаратов (пирацетам). Предупредить или уменьшить токсическое действие циклосерина можно также назначая глутаминоную кислоту по 0.5 г 3-4 раза в сутки (до еды), и ежедневным в/м введением натриевой соли АТФ (1 мл 1% раствора).

Для уменьшения побочных реакций следует ограничить психическое напряжение больных и исключить возможные факторы перегрева (пребывание на солнце с непокрытой головой, горячий душ).

Следует учитывать, что присутствие в препарате пиридоксина может вызывать искажение результатов при определении уробилиногена с помощью реагента Эрлиха.

В случае развития на фоне лечения аллергического дерматита или симптомов поражения ЦНС (судороги, психоз, сонливость, спутанность сознания, гиперрефлексия, головная боль, головокружение, тремор, периферические парезы, дизартрия) лечение препаратом необходимо отменить. В период лечения следует контролировать электроэнцефалограмму (ЭЭГ). В некоторых случаях применение циклосерина и других противотуберкулезных лекарственных средств может привести к развитию недостаточности цианокобаламина и фолиевой кислоты, мегатобластной анемии.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Учитывая возможные побочные действия, при приеме препарата следует соблюдать осторожность во время работы водителям транспортных средств и людям, профессия которых требует повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций

При нарушениях функции почек

Противопоказано при хронической почечной недостаточности (КК менее 50 мл/мин). С осторожностью при нарушениях функции почек (риск возникновения явлений кумуляции препарата).

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям до 3-х лет. С осторожностью у детей старше 3-х лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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