

Циклосерин



Код АТХ:

- [J04AB01](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Циклосерин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, размер №1, с белым или почти белым корпусом и красной крышечкой; содержимое капсул - порошок от белого до светло-желтого цвета.

| | |
|------------|----------------|
| | 1 капс. |
| Циклосерин | 250 мг |

Вспомогательные вещества: магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, кальция фосфат, тальк.

Состав оболочки капсулы: титана диоксид, краситель пунцовый Понсо 4R, краситель хинолин желтый, желатин, вода.

10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик широкого спектра действия. Действует бактериостатически или бактерицидно в зависимости от концентрации в очаге воспаления и чувствительности микроорганизмов.

Нарушает синтез клеточной стенки, действуя как конкурентный антагонист D-аланина. Подавляет активность ферментов, ответственных за синтез клеточной стенки. Активен в отношении грамотрицательных микроорганизмов, в концентрации 10-100 мг/л - *Rickettsia* spp., *Treponema* spp. 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 мес лечения развивается в 20-80% случаев).

Фармакокинетика

Циклосерин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Абсорбция после перорального приема - 70-90%. Практически не связывается с белками плазмы.

$T_{C_{max}}$ - 3-4 ч; пропорционально принятой дозе 0.25, 0.5 и 1 г C_{max} составляет 6, 24 и 30 мкг/л соответственно. После приема 250 мг каждые 12 ч C_{max} - 25-30 мкг/мл. Хорошо проникает в жидкости и ткани организма, включая спинно-мозговую жидкость, грудное молоко, желчь, мокроту, лимфатическую ткань, легкие, асцитическую и синовиальную жидкости, плевральный выпот, проходит через плаценту. В брюшной и плевральной полостях содержится 50-100% от концентрации препарата в сыворотке крови. Метаболизируется до 35% введенной дозы. $T_{1/2}$ при нормальной функции почек - 10 ч. Выводится путем клубочковой фильтрации в неизменном виде: 50% через 12 ч, 65-70% в пределах 24-72 ч, небольшие количества - с каловыми массами.

При хронической почечной недостаточности через 2-3 дня могут возникнуть явления кумуляции.

Показания к применению:

- туберкулез (хронические формы, препарат резерва, в составе комбинированной терапии);
- атипичные микобактериальные инфекции (в т.ч. вызванные *Mycobacterium avium*);
- инфекции мочевыводящих путей.

Относится к болезням:

- [Инфекции](#)
- [Инфекции мочевыводящих путей](#)
- [Туберкулез](#)

Противопоказания:

- гиперчувствительность;
- органические заболевания ЦНС;
- эпилепсия;
- эпилептические припадки (в т.ч. в анамнезе);
- нарушения психики (тревожность, психоз, депрессия, в т.ч. в анамнезе);
- хроническая сердечная недостаточность;
- хроническая почечная недостаточность (КК менее 50 мл/мин);
- алкоголизм.

С осторожностью применять в детском возрасте.

Способ применения и дозы:

Внутрь, непосредственно перед приемом пищи (при раздражении слизистой оболочки ЖКТ - после еды), **взрослым** - по 0.25 г каждые 12 ч в течение первых 12 ч, затем при необходимости с учетом переносимости дозу осторожно увеличивают до 250 мг каждые 6-8 ч под контролем концентрации препарата в сыворотке крови.

Максимальная суточная доза - 1 г. **Пациентам старше 60 лет**, а также с **массой тела менее 50 кг** - по 0.25 г 2 раза/сут. Суточная доза для **детей** - 0.01-0.02 г/кг (не выше 0.75 г/сут).

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница или сонливость, кошмарные сновидения, тревожность, раздражительность, снижение памяти, парестезии, периферический неврит, тремор, эйфория, депрессия, суицидальная настроенность, психоз, эпилептиформные судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: обострение хронической сердечной недостаточности у больных, принимавших от 1 до 1.5 г циклосерина в сутки.

Циклосерин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, изжога, диарея.

Аллергические реакции: (кожная сыпь, зуд), мегалобластная анемия и увеличение уровня аминотрансфераз печени, тошнота, изжога, диарея в особенности у пожилых больных с ранее существовавшими заболеваниями печени.

Прочие: лихорадка, усиление кашля.

Передозировка:

Передозировка наблюдается при концентрации циклосерина в плазме 25-30 мг/мл в результате приема циклосерина в высоких дозах и/или нарушения почечного клиренса. Острое отравление может возникнуть при приеме внутрь более 1 г/сут. *Симптомы* хронической интоксикации при длительном приеме в дозе более 500 мг/сут: головная боль, головокружение, спутанность сознания, повышенная раздражительность, парестезии, психоз, дизартрия, парез, судороги, кома.

Лечение: симптоматическое, активированный уголь, противоэпилептические лекарственные средства. Для профилактики нейротоксических эффектов вводят пиридоксин в дозе 200-300 мг/сут, противосудорожные и седативные лекарственные средства.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применяется только в случаях жизненно важной необходимости.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Увеличивает скорость выведения пиридоксина почками (может вызывать развитие анемии и периферического неврита, требуется увеличение дозы пиридоксина). Этанол увеличивает риск развития эпилептических припадков, особенно у лиц, страдающих хроническим алкоголизмом.

Этионамид повышает риск возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно судорожного синдрома.

Изониазид увеличивает частоту возникновения головокружения, сонливости.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом терапии циклосерином необходимо выделить культуры микроорганизмов и определить чувствительность штаммов к данному препарату. В случае туберкулезной инфекции необходимо определить чувствительность штамма к другим противотуберкулезным препаратам.

Лечение циклосерином необходимо отменить или следует уменьшить дозу, если у пациента развиваются аллергический дерматит или симптомы поражения центральной нервной системы, а именно: головная боль, головокружение, сонливость, спутанность сознания, тремор, периферические парезы, дизартрия, судороги и психоз. Ввиду низкого терапевтического индекса циклосерина опасность развития судорог увеличивается у больных хроническим алкоголизмом.

Отравление обычно наблюдается при концентрациях препарата в крови более 30 мг/л, что может быть результатом передозировки или нарушенного клиренса почек. При приеме препарата следует контролировать гематологические показатели, функцию почек (концентрацию креатинина и азота мочевины в крови), концентрацию препарата в крови и функцию печени.

При лечении пациентов со сниженной функцией почек, принимающих суточную дозу более 500 мг и у которых предположительно обнаруживаются признаки и симптомы передозировки, уровень препарата в крови необходимо контролировать, по крайней мере, один раз в неделю. Дозу необходимо корректировать таким образом, чтобы поддерживать уровень препарата в крови ниже 30 мг/л.

Для профилактики симптомов поражения центральной нервной системы, в частности, судорог, состояния возбуждения или тремора, возможно использование противосудорожных или седативных препаратов. Пациенты, получающие более 500 мг циклосерина в сутки, должны находиться под непосредственным наблюдением врача из-за возможного развития подобных симптомов. Предупредить или уменьшить токсическое действие циклосерина можно, назначая в период лечения глутаминовую кислоту по 500 мг 3-4 раза/сут (до еды), и ежедневным в/м введением натриевой соли АТФ (1 мл 1% раствора), а также пиридоксина в дозе 200-300 мг/сут.

Для профилактики побочных нейротоксических эффектов назначают психотропные препараты бензодиазепинового ряда диазепам (5 мг) или феназепам (1 мг) на ночь, а также пирacetам в дозе 800 мг 2 раза/сут. В некоторых случаях применение циклосерина может вызвать развитие недостаточности витамина В

Циклосерин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

¹²и/или фолиевой кислоты, мегалобластной и сидеробластной анемий. В случае возникновения анемии во время лечения необходимо провести соответствующее обследование и лечение пациента.

Следует ограничить психическое напряжение пациентов и исключить возможные факторы перегрева (пребывание на солнце с непокрытой головой, горячий душ).

В связи с быстрым развитием устойчивости при монотерапии циклосерином рекомендуется его сочетание с другими противотуберкулезными лекарственными средствами.

Влияние приема циклосерина на способность вождения автомобиля и использования механизмов не установлено.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: хроническая почечная недостаточность (КК менее 50 мл/мин).

При лечении пациентов со сниженной функцией почек, принимающих суточную дозу более 500 мг, и у которых предположительно обнаруживаются признаки и симптомы передозировки, уровень препарата в крови необходимо контролировать, по крайней мере, один раз в неделю. Дозу необходимо корректировать таким образом, чтобы поддерживать уровень препарата в крови ниже 30 мг/л.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам старше 60 лет - по 0.25 г 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

С осторожностью применять в детском возрасте.

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в местах, недоступных для детей.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Cikloserin>