Ципролет



Код АТХ:

- J01MA02

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:

Таблетки, покрытые оболочкой в блистере 10 шт.; в пачке картонной 1 блистер.

Раствор для инфузий во флаконах по 100 мл; в пачке картонной 1 флакон.

Капли глазные во флаконах по 5 мл с крышкой-капельницей; в пачке картонной 1 флакон.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: ципрофлоксацин (в виде гидрохлорида моногидрата) 250 мг/500 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, МКЦ, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, кремний коллоидный, тальк, гипромеллоза, кислота сорбиновая, титана диоксид, макрогол 6000, полисорбат 80, диметикон.

100 мл раствора для инфузий содержат

Активное вещество: ципрофлоксацин (в виде гидрохлорида моногидрата) 250 мг,

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, кислота молочная, динатрия эдетат, кислоты лимонной моногидрат, натрия гидроксид, кислота хлористоводородная, вода для инъекций.

1 мл глазных капель содержит

Активное вещество: ципрофлоксацина гидрохлорид 3, 49 мг (эквивалентно ципрофлоксацину 3 мг)

Вспомогательные вещества: динатрия эдетат, натрия хлорид, бензалкония хлорида 50% раствор, кислота хлористоводородная, вода для инъекций.

Описание:

Таблетки, покрытые оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гладкой поверхностью с обеих сторон; на изломе белая со слегка желтоватым оттенком масса.

Раствор для инфузий в виде прозрачной, бесцветной или светло-желтой жидкости.

Капли глазные бесцветные или светло-желтого цвета, прозрачные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Таблетки и раствор для инфузий:

Противомикробный препарат широкого спектра действия из группы фторхинолонов. Действует бактерицидно. Препарат ингибирует фермент ДНК-гиразу бактерий, вследствие чего нарушаются репликация ДНК и синтез клеточных белков бактерий. Ципрофлоксацин действует как на размножающиеся микроорганизмы, так и на находящиеся в фазе покоя. К ципрофлоксацину чувствительны грамотрицательные аэробные бактерии: энтеробактерии (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., Chlamydia trachomatis, Listeria monocytogenes, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium kansasii, Mycobacterium avium-intracellulare.

К ципрофлоксацину чувствительны также грамположительные аэробные бактерии: Staphylococcus spp. (S.aureus, S.haemolyticus, S.hominis, S.saprophyticus), Streptococcus spp. (St. pyogenes, St.agalactiae). Большинство стафилококков, устойчивых к метициллину, устойчивы и к ципрофлоксацину. Чувствительность бактерий Streptococcus pneumoniae, Enterococcus faecalis умеренна.

К препарату резистентны Corynebacterium spp., Bacteroides fragilis, Pseudomonas cepacia, Pseudomonas maltophilia, Ureaplasma urealyticum, Clostridium difficile, Nocardia asteroides. Действие препарата в отношении Treponema pallidum изучено недостаточно.

Глазные капли:

Ципролет® является антимикробным препаратом группы фторхинолонов. Механизм действия ципрофлоксацина связан с воздействием на ДНК-гиразу (топоизомеразу) бактерий, играющую важную роль в репродукции бактериальной ДНК. Ципрофлоксацин оказывает быстрое бактерицидное действие на микроорганизмы, находящиеся как в стадии покоя, так и размножения. Спектр действия ципрофлоксацина включает следующие виды грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов: E.coli, Shigella, Salmonella, Citrobacter, Klebsiella, Enterobacter, Serratia, Hafnia, Edwardsiella, Proteus (индолположительные и индолотрицательные), Providencia, Morganella, Yersinia, Vibrio, Aeromonas, Plesiomonas, Pasteurella, Haemophilus, Campylobacter, Pseudomonas, Legionella, Neisseria, Moraxella, Branhamella, Acinetobacter, Brucella, Staphylococcus, Sreptococcus agalactiae, Listeria, Corynebacterium, Chlamydia. Ципрофлоксацин эффективен в отношении бактерий, продуцирующих бета-лактамазы. Чувствительность к ципрофлоксацину варьирует у: Gardnerella, Flavobacterium, Alcaligenes, Streptococcus faecalis, Streptococcus pyogenes, Streptococcus pneumonia, Streptococcus viridans, Mycoplasma hominis, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium fortuitum. К ципрофлоксацину чаще всего резистентны Clostridium difficile, Ureaplasma urealyticum, Nocardia asteroides. Анаэробы за некоторым исключением умеренно чувствительны (Peptococcus, Peptostreptococcus) или устойчивы (Bacteroides) к ципрофлоксацину. Ципрофлоксацин не действует на Treponema pallidum и грибы. Резистентность к ципрофлоксацину вырабатывается медленно и постепенно, плазмидная резистентность отсутствует. Ципрофлоксацин активен в отношении возбудителей резистентных, например к бета-лактамным антибиотикам, аминогликозидам или тетрациклинам.

Фармакокинетика

Таблетки:

При пероральном приеме ципрофлоксацин быстро всасывается из ЖКТ. Биодоступность препарата составляет

50–85%. C_{max} препарата в сыворотке крови здоровых добровольцев при пероральном приеме (до еды) 250, 500, 750 и 1000 мг препарата, достигается через 1–1,5 ч и составляет 1,2; 2,4; 4,3 и 5,4 мкг/мл соответственно.

Перорально принятый ципрофлоксацин распределяется в тканях и жидкостях организма. Высокие концентрации препарата наблюдаются в желчи, легких, почках, печени, желчном пузыре, матке, семенной жидкости, ткани простаты, миндалинах, эндометрии, фаллопиевых трубах и яичниках. Концентрация препарата в этих тканях выше, чем в сыворотке. Ципрофлоксацин также хорошо проникает в кости, глазную жидкость, бронхиальный секрет, слюну, кожу, мышцы, плевру, брюшину, лимфу.

Накапливающаяся концентрация ципрофлоксацина в нейтрофилах крови в 2–7 раз выше, чем в сыворотке.

Объем распределения в организме составляет 2–3,5 л/кг. В спинно-мозговую жидкость препарат проникает в небольшом количестве, где его концентрация составляет 6–10% от таковой сыворотки.

Степень связывания ципрофлоксацина с белками плазмы составляет 30%.

У больных с неизмененной функцией почек $T_{1/2}$ составляет обычно 3–5 ч. При нарушении функции почек $T_{1/2}$ увеличивается.

Основной путь выведения ципрофлоксацина из организма — почки. С мочой выводится 50–70%. От 15 до 30% выводится с экскрементами.

Больным с тяжелой почечной недостаточностью (Cl креатинина <20 мл/мин/1,73м^2) необходимо назначать половину суточной дозы препарата.

Раствор для инфузий:

После в/в инфузии 200 или 400 мг TC_{max} — 60 мин, C_{max} — 2,1 мкг/мл и 4,6 мкг/мл соответственно. Объем распределения — 2–3 л/кг, связывание с белками плазмы — 20–40%.

Хорошо распределяется в тканях организма (исключая ткань, богатую жирами, например нервную ткань). Содержание 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, матке, семенной жидкости, ткани простаты, эндометрии, фаллопиевых трубах и яичниках, 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 невоспаленных мозговых оболочках составляет 6–10% от таковой в сыворотке крови, а при воспаленных — 14–37%. Ципрофлоксацин также хорошо проникает в глазную жидкость, бронхиальный секрет, плевру, брюшину, лимфу, через плаценту. Концентрация ципрофлоксацина в нейтрофилах крови в 2–7 раз выше, чем в сыворотке.

Активность несколько снижается при кислых значениях pH.

Метаболизируется в печени (15–30%) с образованием малоактивных метаболитов (диэтилципрофлоксацин, сульфоципрофлоксацин, оксоципрофлоксацин, формилципрофлоксацин).

При в/в введении $T_{1/2}$ — 5–6 ч, при хронической почечной недостаточности — до 12 ч. Выводится в основном почками путем тубулярной фильтрации и канальцевой секреции в неизмененном виде (при в/в введения — 50–70%) и в виде метаболитов (при в/в введении — 10%), остальная часть — через ЖКТ. 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 сыворотке, что значительно превосходит 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 (Cl креатинина >20 мл/мин) процент выводимого через почки препарата снижается, но кумуляции в организме не происходит вследствие компенсаторного увеличения метаболизма препарата и выведения с каловыми массами. Больным с тяжелой почечной недостаточностью (Cl креатинина <20 мл/мин/1,73 м^2) необходимо назначать половину суточной дозы.

Показания к применению:

Таблетки и раствор для инфузий:

— инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к ципрофлоксацину микроорганизмами: инфекции дыхательных путей; уха, горла и носа; почек и мочевыводящих путей; половых органов (гонорея, простатиты); гинекологические (аднекситы) и послеродовые инфекции (только раствор для инфузий); пищеварительной системы (в т.ч. рта, зубов, челюстей); желчного пузыря и желчевыводящих путей; кожных покровов, слизистых оболочек и мягких тканей; опорно-двигательного аппарата;

— лечение сепсиса и перитонита;

— профилактика и лечение инфекций у больных со сниженным иммунитетом (при терапии иммунодепрессантами).

Глазные капли:

— местное лечение различных инфекционных заболеваний глаза и его придатков, вызванных чувствительными к препарату бактериями: острых и подострых конъюнктивитов, блефароконъюнктивитов, блефаритов, бактериальных язв роговицы с/без гипопиона, бактериальных кератитов и кератоконъюнктивитов, хронических дакриоциститов и мейбомитов;

— предоперационная профилактика в офтальмохирургии;

— лечение послеоперационных инфекционных осложнений;

— лечение и профилактика инфекционных осложнений после травм (с или без инородных тел) глазного яблока и его придаточного аппарата.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Бактериальные язвы роговицы
- Блефарит
- Блефароконъюнктивит
- Гонорея
- Дакриоцистит
- Инфекции
- Кератит
- Конъюнктивит
- Мейбомит
- Перитонит
- Простатит
- Сепсис

Противопоказания:

Для всех лекарственных форм:

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к ципрофлоксацину или другим препаратам из группы фторхинолонов.

*Таблетки и раствор для инфузий (дополнительно):*псевдомембранозный колит.

Раствор для инфузий (дополнительно): дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

С осторожностью (таблетки и раствор для инфузий):

— выраженный атеросклероз сосудов головного мозга;

— нарушение мозгового кровообращения;

— психические заболевания;

— судорожный синдром, эпилепсия;

— выраженная почечная и/или печеночная недостаточность;

— пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, в/в, наружно.

Внутрь, натощак, запивая достаточным количеством жидкости.

Доза таблеток Ципролет зависит от тяжести заболевания, типа инфекции, состояния организма, возраста, массы тела и функции почек у пациента. Обычно рекомендуемые дозы:

— неосложненные заболевания почек и мочевыводящих путей — по 250 мг, в осложненных случаях — по 500 мг 2

раза в сутки;

— заболевания нижних отделов дыхательных путей средней тяжести — по 250 мг, а в более тяжелых случаях — по 500 мг 2 раза в сутки;

— для лечения гонореи рекомендуется однократный прием — 250–500 мг;

— гинекологические заболевания, энтериты и колиты с тяжелым течением и высокой температурой, простатиты, остеомиелиты — по 500 мг 2 раза в сутки (для лечения банальной диареи можно использовать в дозе 250 мг 2 раза в сутки).

Пациентам с выраженными нарушениями функции почек следует назначать половинную дозу препарата.

Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания, но лечение всегда должно продолжаться как минимум еще 2 дня после исчезновения симптомов болезни. Обычно продолжительность лечения составляет 7–10 дней.

Рекомендуемые дозы препарата для больных с хронической почечной недостаточностью:

Cl креатинина, мл/мин	Доза
>50	Обычный режим дозирования
30–50	250–500 мг 1 раз в 12 ч
5–29	250–500 мг 1 раз в 18 ч
Больные, находящиеся на гемо- или перитонеальном диализе	После диализа 250–500 мг 1 раз в 24 ч

В/в, капельно в течение 30 мин (200 мг) и 60 мин (400 мг). Раствор для инфузии можно совмещать с 0,9% раствором натрия хлорида, раствором Рингера, 5 и 10% раствором декстрозы, 10% раствором фруктозы, а также раствором, содержащим 5% раствор декстрозы с 0,225 или 0,45% раствором натрия хлорида.

Доза раствора Ципролет зависит от тяжести заболевания, типа инфекции, состояния организма, возраста, массы тела и функции почек у пациента. Обычно рекомендуемые дозы:

- для в/в введения: разовая доза — 200 мг (при тяжелых инфекциях — 400 мг), кратность введения — 2 раза/сут; продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания — 1–2 нед (и более при необходимости);

- при острой гонорее — 100 мг однократно, в/в;

- для профилактики послеоперационных инфекций — 200–400 мг, в/в, за 30–60 мин до операции.

Местно, в конъюнктивальный мешок.

При легкой и умеренно тяжелой инфекции: по 1–2 капли в пораженный глаз каждые 4 ч.

При тяжелой инфекции: по 2 капли в глаз каждый час.

После улучшения состояния частоту инстилляций можно уменьшить.

При бактериальной язве роговицы

: по 1 капле каждые 15 мин в течение 6 ч, затем по 1 капле каждые 30 мин в часы бодрствования; на 2-й день — по 1 капле каждый час в часы бодрствования; с 3-го по 14-й день — по 1 капле каждые 4 ч в часы бодрствования. Если после 14 дней терапии эпителизация не произошла, лечение можно продолжить.

Побочное действие:

Таблетки и раствор для инфузий:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, диарея, рвота, абдоминальные боли, метеоризм, анорексия, 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), потливость, повышение внутричерепного давления, тревожность, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, а также другие проявления психотических реакций (изредка прогрессирующих до состояний, в которых пациент может причинить себе вред), мигрень, обморок, 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 АД, приливы крови лицу.

Со стороны кроветворной системы: лейкопения, гранулоцитопения, анемия, тромбоцитопения, лейкоцитоз,

тромбоцитоз, гемолитическая анемия.

Со стороны лабораторных показателей: гипопротромбинемия, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, гипергликемия.

Со стороны мочевыделительной системы: гематурия, кристаллурия (прежде всего при щелочной моче и низком диурезе), гломерулонефрит, дизурия, полиурия, задержка мочи, альбуминурия, уретральные кровотечения, гематурия, снижение азот-выделительной функции почек, интерстициальный нефрит.

Аллергические реакции: кожный зуд, крапивница, образование волдырей, сопровождающихся кровотечениями, и маленьких узелков, образующих струпья, лекарственная лихорадка, точечные кровоизлияния (петехии), отек лица или гортани, одышка, эозинофилия, повышенная светочувствительность, васкулит, узловая эритема, экссудативная мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона (злокачественная экссудативная эритема), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Прочие: артралгия, артрит, тендовагинит, разрывы сухожилий, общая слабость, миалгия, суперинфекции (кандидоз, псевдомембранозный колит); боль и жжение в месте введения, флебит (дополнительно для раствора для инфузий).

Глазные капли:

Препарат обычно хорошо переносится больными.

Применение глазных капель может в редких случаях сопровождаться незначительными болевыми ощущениями, гиперемией конъюнктивы, однако отмены препарата при этом не требуется.

Если после применения капель продолжается или нарастает раздражение, то следует прекратить использование препарата и обратиться к врачу.

Передозировка:

Лечение: необходимо тщательно контролировать состояние больного, сделать промывание желудка, проводить обычные меры неотложной помощи, обеспечить достаточное поступление жидкости.

Специфический антидот неизвестен. С помощью гемо- или перитонеального диализа может быть выведено лишь незначительное (<10%) количество препарата.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Таблетки:

При одновременном применении Ципролета® с диданозином всасывание ципрофлоксацина снижается вследствие образования комплексов ципрофлоксацина с содержащимися в диданозине алюминиевыми и магниевыми солями.

Одновременный прием Ципролета® и теофиллина может привести к повышению концентрации теофиллина в плазме крови, за счет конкурентного ингибирования в участках связывания цитохрома Р450, что приводит к увеличению $T_{1/2}$ теофиллина и возрастанию риска развития токсического действия, связанного с теофиллином.

Одновременный прием антацидов, а также препаратов, содержащих ионы алюминия, цинка, железа или магния, может вызвать снижение всасывания ципрофлоксацина, поэтому интервал между назначением этих препаратов должен быть не менее 4 ч.

При одновременном применении Ципролета® и антикоагулянтов удлиняется время кровотечения.

При одновременном применении Ципролета® и циклоспорина усиливается нефротоксическое действие последнего.

Раствор для инфузий:

Вследствие снижения активности процессов микросомального окисления в гепатоцитах, повышает концентрацию и удлиняет $T_{1/2}$ теофиллина (и других ксантинов, например кофеина), пероральных гипогликемических препаратов, непрямых антикоагулянтов, способствует снижению протромбинового индекса. НПВС (исключая АСК) повышают риск развития судорог.

Метоклопрамид ускоряет абсорбцию, что приводит к уменьшению времени достижения его С

max·

Совместное назначение урикозурических препаратов приводит к замедлению выведения (до 50%) и повышению плазменной концентрации ципрофлоксацина. При сочетании с другими противомикробными препаратами (бета-лактамы, 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 изоксазолпенициллинами и ванкомицином — при стафилококковых инфекциях; с метронидазолом и клиндамицином — при анаэробных инфекциях.

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

При одновременном приеме усиливает действие непрямых антикоагулянтов.

Инфузионный раствор фармацевтически несовместим со всеми инфузионными растворами и препаратами, которые физико-химически неустойчивы при кислой среде (pH инфузионного раствора ципрофлоксацина — 3,5–4,6). Нельзя смешивать раствор для в/в введения с растворами, имеющими pH более 7.

Особые указания и меры предосторожности:

Больным с эпилепсией, приступами судорог в анамнезе, сосудистыми заболеваниями и органическими поражениями мозга в связи с угрозой развития побочных реакций со стороны ЦНС Ципролет® следует назначать только по жизненным показаниям.

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

При возникновении болей в сухожилиях или при появлении первых признаков тендовагинита лечение следует прекратить в связи с тем, что описаны отдельные случаи воспаления и даже разрыва сухожилий во время лечения фторхинолонами.

В период лечения Ципролетом® необходимо обеспечить достаточное количество жидкости при соблюдении нормального диуреза.

В период лечения Ципролетом® следует избегать контакта с прямыми солнечными лучами.

Пациентам, принимающим Ципролет®, следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций (особенно при одновременном употреблении алкоголя).

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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