Доксициклин



Код АТХ:

- J01AA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Доксициклин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы	**1 капс.**
доксициклина гидрохлорид	100 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Полусинтетический тетрациклин, бактериостатический антибиотик широкого спектра действия. Проникая внутрь клетки, действует на внутриклеточно расположенных возбудителей. Подавляет синтез протеинов в микробной клетке, нарушает связь транспортных аминоацил-РНК с 30S субъединицей рибосомальной мембраны.

К нему *высокочувствительны грамположительные микроорганизмы:* Staphylococcus spp. (в т.ч. Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis), Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus pneumoniae), Clostridium spp., Listeria spp.; Actinomyces israeli; и *грамотрицательные микроорганизмы:* Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Haemophilus influenzae, Klebsiella spp., Escherichia coli, Shigella spp., Enterobacter, Salmonella spp., Bordetella pertussis. Bacteroides spp., Treponema spp. (в т.ч. штаммы, устойчивые к др. антибиотикам, например к современным пенициллинам и цефалоспоринам). Наиболее чувствительны Haemophilus influenzae (91-96%) и внутриклеточные патогены.

Доксициклин *активен в отношении большинства возбудителей опасных инфекционных заболеваний*: чумного (Yersinia spp.), туляремийного (Francisella tularensis), сибиреязвенного микробов (Bacillus anthracis), легионелл (Legionella spp.), бруцелл (Brucella spp.), холерного вибриона (Vibrio cholera), риккетсий (Rickettsia spp.), возбудителей сапа (Actinobacillus mallei), хламидий (возбудителей орнитоза (Chlamydia psittaci), пситтакоза (Rickettsiaformis psittacosi), трахомы (Chlamydia trachomatis;, венерической гранулемы (Calymmatobacterium granulomatis), малярии

(Plasmodium falciparum), амебной дизентерии (Entamoeba histolytica).

Не действует на большинство штаммов протея, синегнойной палочки и грибы.

В меньшей степени, чем другие антибиотики тетрациклинового ряда, угнетает кишечную флору, отличается от них более полным всасыванием и большей длительностью действия. По степени антибактериальной активности доксициклин превосходит природные тетрациклины. В отличие от тетрациклина и окситетрациклина обладает более высокой терапевтической эффективностью, проявляющейся при лечении в 10 раз меньшими дозами, и более длительным действием. Существует перекрестная устойчивость к другим тетрациклинам, а также к пенициллинам.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая и высокая (около 100%). Прием пиши не оказывает существенного влияния на степень абсорбции. Имеет высокую степень растворимости в липидах и низкую аффинность в отношении связывания ионов кальция (Ca^{2+}). После перорального приема 200 мг время достижения максимальной концентрации в плазме крови - 2.5 ч, максимальная концентрация в плазме крови - 2.5 мкг/мл, через 24 ч после приема - 1.25 мкг/мл.

Связь с белками плазмы - 80-93%. Хорошо проникает в органы и ткани; через 30-45 мин после приема внутрь обнаруживается в терапевтических концентрациях в печени, почках, легких, селезенке, костях, зубах, предстательной железе, тканях глаза, в плевральной и асцитической жидкостях, желчи, синовиальном экссудате, экссудате гайморовых и лобных пазух, в жидкости десневых борозд. Плохо проникает в спинномозговую жидкость (10-20% от уровня плазмы). Проникает через плацентарный барьер, определяется в материнском молоке. Объем распределения - 0.7 л/кг.

Метаболизируется в печени 30-60%. Период полувыведения — 10-16 ч (в основном — 12-14 ч, в среднем - 16.3 ч). При повторных введениях препарат может кумулировать. Накапливается в ретикуло-эндотелиальной системе и костной ткани. В костях и зубах образует нерастворимые комплексы с ионами кальция (Ca^{2+}). Выводится с желчью, где обнаруживается в высокой концентрации. Подвергается кишечно-печеночной рециркуляции, выводится кишечником (20-60%); 40% принятой дозы выделяется почками за 72 ч (из них 20-50% - в неизмененном виде), при тяжелой хронической почечной недостаточности - только 1-5%.

У больных с нарушением функции почек или азотемией важным путем выведения является желудочно-кишечная секреция.

Показания к применению:

— инфекционно-воспалительные заболевания, вызываемые чувствительными микроорганизмами: инфекции дыхательных путей (фарингит, бронхит острый и хронический, трахеит, бронхопневмония, долевая пневмония, абсцесс легкого, эмпиема плевры);

— инфекции ЛОР-органов (отит, тонзиллит, синусит и др.);

— инфекции мочеполовой системы (цистит, пиелонефрит, простатит, уретрит, уретроцистит, урогенитальный микоплазмоз, эндометрит, эндоцервицит, острый орхиэпидидимит; гонорея);

— инфекции желчевыводящих путей и желудочно-кишечного тракта (холецистит, холангит, гастроэнтероколит, бактериальная дизентерия, диарея "путешественников"); инфекции кожи и мягких тканей (флегмоны, абсцессы, фурункулез, панариции, инфицированные ожоги, раны и др.);

— инфекционные заболевания глаз, сифилис, фрамбезия, иерсиниоз, легионеллез, риккетсиоз, хламидиоз различной локализации (в т.ч. простатит и проктит), лихорадка Ку, пятнистая лихорадка Скалистых гор, тиф (в т.ч. сыпной, клещевой, возвратный), болезнь Лайма (I ст. - erythema migrans), бациллярная и амебная дизентерия, туляремия, холера, актиномикоз, малярия; в составе комбинированной терапии - лептоспироз, трахома, пситтакоз, орнитоз, гранулоцитарный эрлихиоз; коклюш, бруцеллез, остеомиелит; сепсис, подострый септический эндокардит, перитонит;

— профилактика послеоперационных гнойных осложнений; малярии, вызванной Plasmodium falciparum, при кратковременных путешествиях (менее 4 мес) на территории, где распространены штаммы, устойчивые к хлорохину и/или пириметамин-сульфадоксину;

— в качестве препарата "первого" ряда назначается пациентам до 65 лет при обострении хронического бронхита (в т.ч. на фоне бронхиальной астмы) без сопутствующих заболеваний (эти обострения часто вызваны Haemophilus influenzae). Эффективен при обострении бронхолегочной инфекции (обычно стафилококковой этиологии) у пациентов с муковисцидозом, хламидийным артритом, гранулоцитарным эрлихиозом. У пожилых пациентов используется для лечения острых простатитов и мочевой инфекции, вызванной Escherichia coli.

Относится к болезням:

- Абсцесс

- Амебная дизентерия
- Артрит
- Артроз
- Бронхит
- Бронхопневмония
- Гастрит
- Гастроэнтерит
- Гастроэнтероколит
- Гонорея
- Диарея
- Дизентерия
- Иерсиниоз
- Инфекции
- Коклюш
- Лептоспироз
- Лихорадка
- Малярия
- Микоплазмоз
- Муковисцидоз
- Ожоги
- Орнитоз
- Остеомиелит
- Отит
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Плеврит
- Пневмония
- Проктит
- Простатит
- Раны
- Сепсис
- Синусит
- Сифилис
- Тонзиллит
- Трахеит
- Трахома
- Уретрит
- Фарингит
- Флегмона
- Фурункул
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Цистит
- Эмпиема
- Эмпиема плевры
- Эндокардит
- Эндометрит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к доксициклину, компонентам препарата, другим тетрациклинам;

— дефицит лактазы;

— непереносимость лактозы;

— глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— порфирия;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— лейкопения;

— детский возраст (до 12 лет - возможность образования нерастворимых комплексов с ионами кальция (Ca^{2+}) с отложением в костном скелете, эмали и дентине зубов);

— дети в возрасте после 12 лет с массой тела до 45 кг.

Способ применения и дозы:

Внутрь, **у взрослых и детей старше 12 лет с массой тела более 45 кг** средняя суточная доза - 200 мг в первый день (делится на 2 приема - по 100 мг 2 раза в сутки), далее по 100 мг/сут.

При хронических инфекциях мочевыделительной системы - 200 мг/сут на протяжении всего периода терапии.

При лечении гонореи назначают по одной из следующих схем: острый неосложненный уретрит - курсовая доза 500 мг (1 прием - 300 мг, последующие 2 - по 100 мг с интервалом 6 ч) или 100 мг/сут до полного излечения (у женщин) или по 100 мг 2 раза в день в течение 7 дней (у мужчин); при осложненных формах гонореи курсовая доза -800-900 мг, которую распределяют на 6-7 приемов (300 мг - 1 прием, затем с интервалом 6 ч на 5-6 последующих).

При лечении сифилиса - по 300 мг/сут в течение не менее 10 дней.

При неосложненных инфекциях мочеиспускательного канала, шейки матки и прямой кишки, вызванных Chlamydia trachomatis, назначают по 100 мг 2 раза в сутки в течение не менее 7 дней.

Инфекции мужских половых органов - по 100 мг 2 раза в сутки в течение 4 нед. Лечение малярии, устойчивой к хлорохину, - 200 мг/сут в течение 7 дней (в сочетании с шизонтоцидными лекарственными средствами - хинином); профилактика малярии -100 мг 1 раз в сутки за 1-2 дня до поездки, затем ежедневно во время поездки и в течение 4 нед после возвращения;

Диарея "*путешественников*" *(профилактика)* - 200 мг в первый день поездки (за 1 прием или по 100 мг 2 раза в сутки), по 100 мг 1 раз в сутки в течение всего пребывания в регионе (не более 3 нед).

Лечение лептоспироза - 100 мг внутрь 2 раза в сутки в течение 7 дней; профилактика лептоспироза - 200 мг 1 раз в неделю в течение пребывания в неблагополучном районе и 200 мг в конце поездки.

Профилактика инфекций после медицинского аборта - 100 мг за 1 ч до аборта и 200 мг - через 30 мин после.

При угревой сыпи - 100 мг/сут, курс - 6-12 нед.

Максимальные суточные дозы для взрослых - до 300 мг/сут или до 600 мг/сут в течение 5 дней при тяжелых гонококковых инфекциях.

При наличии тяжелой печеночной недостаточности требуется снижение суточной дозы доксициклина, поскольку при этом происходит постепенное накопление его в организме (риск гепатотоксического действия).

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: доброкачественное повышение внутричерепного давления (снижение аппетита, рвота, головная боль, отек диска зрительного нерва), токсическое действие на центральную нервную систему (головокружение или неустойчивость),

Нарушение обмена веществ: анорексия.

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: звон в ушах.

Со стороны органов зрения: нечеткость зрения, скотома и диплопия в результате повышения внутричерепного давления.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, запоры или диарея, боль в животе, глоссит, дисфагия, эзофагит (в т.ч. эрозивный), гастрит, изъязвление желудка и 12-перстной кишки, псевдомембранозный колит, энтероколит (за счет пролиферации резистентных штаммов стафилококков).

Аллергические реакции: макулопапулезная сыпь, кожный зуд, гиперемия кожи, ангионевротический отек, анафилактоидные реакции, лекарственная красная волчанка, эритематозная сыпь, эксфолиативный дерматит, крапивница, анафилаксия, анафилактический шок, анафилактоидные реакции, синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: перикардит, снижение артериального давления, тахикардия, многоформная эритема.

Со стороны органов кроветворения: гемолитическая анемия, тромбоцитопения, нейтропения, лейкопения, эозинофилия, снижение протромбинового индекса.

Со стороны гепатобилиарной системы: нарушение функции печени, повышение уровня печеночных трансаминаз, аутоиммунный гепатит, холестаз.

Скелетно-мышечный аппарат: артралгия, миалгия.

Нарушение функции почек и мочевых путей: повышение уровня остаточного азота мочевины.

Прочие: фотосенсибилизация, суперинфекция; устойчивое изменение цвета зубной эмали, воспаление в аногенитальной зоне. Кандидоз (вагинит, глоссит, стоматит, проктит), дисбактериоз, синдром, сходный с сывороточной болезнью, токсический эпидермальный некролиз.

Передозировка:

Симптомы: при введении высоких доз, особенно у пациентов с нарушением функции печени возможно появление нейротоксических реакций: головокружения, тошноты, рвоты, судорог, нарушения сознания вследствие повышения внутричерепного давления.

Лечение: отмена лекарственного средства, промывание желудка с активированным углем, симптоматическая терапия, внутрь назначают антациды и сульфат магния для предотвращения абсорбции доксициклина. Специфического антидота не существует. Гемодиализ и перитонеальный диализ неэффективны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата в период беременности противопоказано, поскольку, проникая через плаценту, препарат может нарушить нормальное развитие зубов, вызвать угнетение роста костей скелета плода, а также вызвать жировую инфильтрацию печени.

В период лактации применение доксициклина противопоказано. В случае необходимости применения препарата, на период лечения кормление грудью следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Абсорбцию снижают антациды, содержащие соли алюминия (Al^{3+}), кальция (Ca^{2+}) и магния (Mg^{2+}), препараты железа (Fe), натрия гидрокарбонат, слабительные препараты, содержащие соли магния (Mg^{2+}), колестирамин и колестипол, поэтому их применение должно быть разделено интервалом в 3 часа.

В связи с подавлением кишечной микрофлоры снижает протромбиновый индекс, что требует коррекции дозы непрямых антикоагулянтов.

При сочетании с бактерицидными антибиотиками, нарушающими синтез клеточной стенки (пенициллины, цефалоспорины), эффективность последних снижается. Снижает надежность контрацепции и повышает частоту кровотечений "прорыва" на фоне приема эстрогенсодержащих пероральных контрацептивов.

Этанол, барбитураты, рифампицин, карбамазепин, фенитоин и др. стимуляторы микросомального окисления, ускоряя метаболизм доксициклина, снижают его концентрацию в плазме.

При одновременном применении с метоксифлураном возможно развитие острой почечной недостаточности, вплоть до летального исхода.

Одновременное применение ретинола способствует повышению внутричерепного давления.

Особые указания и меры предосторожности:

Для предотвращения местнораздражающего действия (эзофагит, гастрит, изъязвление слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта) рекомендуется прием в дневные часы с большим количеством жидкости, пищей. В связи с возможным развитием фотосенсибилизации необходимо ограничение инсоляции во время лечения и в течение 4-5 дней после него. При длительном использовании необходим периодический контроль функции печени, органов кроветворения. Может маскировать проявления сифилиса, в связи с чем при возможности микст-инфекции необходимо ежемесячное проведение серологического анализа на протяжении 4 мес. Все тетрациклины образуют стойкие комплексы с ионами кальция (Ca^{2+}) в любой костнообразующей ткани. В связи с этим прием в период развития зубов может стать причиной долговременного окрашивания зубов в желто-серо-коричневый цвет, а также гипоплазии эмали. Возможно ложное повышение уровня катехоламинов в моче при их определении флюоресцентным методом. При исследовании биоптата щитовидной железы у пациентов, длительно получавших доксициклин, возможно темно-коричневое прокрашивание ткани в микропрепаратах без нарушения ее функции.

В эксперименте установлено, что доксициклин может оказывать токсическое действие на развитие плода (задержка развития скелета) - блокирует металлопротеазы (ферменты, катализирующие деградацию коллагена и протеогликанов) в хряще, приводит к уменьшению поражений при деформирующем остеоартрозе. При увеличении дозы выше 4 г фармакокинетика доксициклина не зависит от дозы и концентрация в крови не возрастает.

При применении препарата, как на фоне приема, так и через 2-3 недели после прекращения лечения возможно

развитие диареи, вызванной Clostridium difficile. В легких случаях достаточно отмены лечения и применения ионнообменных смол (колестирамин, колестипол), в тяжелых случаях показано возмещение потери жидкости, электролитов и белка, назначение ванкомицина, бацитрацина или метронидазола. Нельзя применять лекарственные средства, тормозящие перистальтику кишечника.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам следует воздерживаться от всех видов деятельности, требующих повышенного внимания, быстрой психической и двигательной.

При нарушениях функции печени

Противопоказано при тяжелой печеночной недостаточности. При наличии тяжелой печеночной недостаточности требуется снижение суточной дозы доксициклина, поскольку при этом происходит постепенное накопление его в организме (риск гепатотоксического действия).

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям до 12 лет (возможность образования нерастворимых комплексов с ионами кальция (Ca^{2+}) с отложением в костном скелете, эмали и дентине зубов); и детям в возрасте после 12 лет с массой тела до 45 кг.

Применение возможно у детей старше 12 лет с массой тела более 45 кг согласно режиму дозирования.

Условия хранения:

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

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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