Экзифин



Код АТХ:

- D01BA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тербинафин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки	**1 таб.**
тербинафин (в форме гидрохлорида)	250 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая (тип 102) - 47 мг, натрия крахмала гликолат (тип А) - 36.96 мг, крахмал прежелатинизированный - 25 мг, магния стеарат - 7 мг, кремний коллоидный безводный - 3 мг.

4 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (7) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Тербинафин относится к группе аллиламинов. Обладает широким спектром противогрибкового действия. В низких концентрациях оказывает фунгицидное действие на дерматофиты Trychophyton (T. rubrum, T. menlagrophytes, T. tonsurans, T. verrucosum, T.violaccum), Microsporum canis, Epidermophyton floccosum, плесневые грибы (например, Aspergillus, Cladosporium, Scopulariopsis brevicalius), дрожжевые грибы, главным образом Candida albicans, и некоторые диморфные грибы. На грибы Candida и его мицелиальные формы оказывает в зависимости от вида гриба фунгицидное или фунгистатическое действие. Тербинафин нарушает ранний этап биосинтеза основного компонента клеточной мембраны гриба эргостсрола путем ингибирования фермента сквален-эпоксидазы. Сквален-эпоксидаза не связана с системой цитохрома Р450 (CYP450), поэтому тербинафин не влияет на метаболизм гормонов и лекарственных препаратов, метаболизм которых связан с CYP450.

При пероральном применении накапливается в коже, ногтях и волосах в количестве, оказывающим фунгицидное действие.

Системное лечение разноцветного лишая, вызванного Malassezia furfur, неэффективно.

Фармакокинетика

При пероральном приеме хорошо абсорбируется, через 0.8 ч абсорбируется половина принятой дозы; через 4.6 ч половина принятой дозы распределяется в организме. Через 1-2 ч после приема внутрь однократной 250 мг дозы C_{max} препарата в плазме крови достигает 0.97 мкг/мл. Биодоступность - 80%. Прием пиши не влияет на биодоступность тербинафина.

Тербинафин интенсивно связывается с белками плазмы крови (99%), быстро распространяется в тканях, проникает в дермальный слой кожи и нопевые пластинки. Проникает в секрет сальных желез и накапливается в высоких концентрациях в волосяных фолликулах, в волосах, коже и в подкожной клетчатке. Уже через несколько недель лечения накапливается в ногтях и концентрациях, обеспечивающих фунгицидное действие. $T_{1/2}$ - 16-18 ч. $T_{1/2}$ терминальной фазы - 200-400 ч.

Биотрансформируегся в печени до неактивных метаболитов: 80% принятой дозы выводится с мочой в виде метаболитов, остальная часть (20%) с каловыми массами. Не кумулирует в организме. Возраст больных не влияет на фармакокинетику тербинафина, однако элиминация может снижаться при поражениях почек или печени, приводя к высоким концентрациям тербинафина в крови.

Выделяется вместе с грудным молоком.

Показания к применению:

— микозы волосистой части головы (трихофития, микроспория);

— микозы кожи и ногтей, обусловленные Trychophyton (T. rubnim, T. mentagrophytes, T. verrucosum, T. violaceum). Microsporum (M. canis, M. gypseum) и Epidermophylom floccosum;

— онихомикозы;

— тяжелые, распространенные дерматомикозы гладкой кожи туловища и конечностей, требующие системного лечения;

— кандидозы кожи и слизистых оболочек.

Относится к болезням:

- Дерматит
- Микоз

Противопоказания:

— детский возраст до 2 лет, т.к. нет достаточного количества данных о применении препарата детьми с массой тела менее 12 кг;

— беременность;

— период кормления грудью;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* печеночная и/или почечная недостаточность; алкоголизм; заболевания крови; опухоли; болезни обмена веществ; патология сосудов конечностей, псориаз.

Способ применения и дозы:

Длительность курса лечения и режим дозирования устанавливается в индивидуальном порядке и зависит от локализации процесса и тяжести заболевания.

Онихомикозы

Обычная доза: 250 мг 1 раз/сут. Продолжительность терапии - около 6-12 петель. При *поражении ногтей пальцев кистей и стоп (за исключением большою пальца стоны),* или при молодом возрасте больного длительность лечение может быть менее 12 недель. При инфекции большого пальца стопы 3-месячный курс лечения обычно достаточен. В редких случаях, при замедленной скорости роста ногтей, может потребоваться более длительное лечение до 6 и более месяцев.

Грибковые инфекции кожи.

Продолжительность лечения при *межпальцевой, подошвенной или по типу "носков" локализации инфекции* составляет 2-6 недель, при микозах других участков тела: голеней - 2-4 недель, туловища - 4 недели, при *микозах, вызванных Candida* - 2-4 недели; при *микозах головы, вызванных Microsporum canis* - более 4 недель.

Детям обычно назначают 125 мг (1/2 таблетки). Продолжительность лечения микозов волосистой части головы - около 4 недель, при заражении Microsporum canis может быть более длительной.

При **массе тела менее 20 кг** - 62.5 мг (1/4 таблетки) 1 раз/сут, при **массе от 20 до 40 кг** - 125 мг (1/2 таблетки) 1 раз/сут, при **массе более 40 кг** - 250 мг (1 таблетка) 1 раз/сут.

Пожилым больным препарат назначают в тех же лозах, что и взрослым.

При **выраженных нарушениях функции печени и/или почек (КК 50 мл/мин либо концентрация креатинина в крови более 300 мкмоль/л) -** 125 мг 1 раз/сут.

Побочное действие:

Побочные действия обычно средней и легкой степени тяжести и носят временный характер.

Со стороны пищеварительной системы: часто - чувство переполненного желудка, диспепсия, тошнота, потеря аппетита, боли в животе, диарея; нечасто - нарушение вкусового восприятия, в т.ч. потеря, которая восстанавливается через несколько недель после прекращения лечения; редко - холестаз, желтуха, гепатит, бессимптомное увеличение уровня трансаминаз печени. Несмотря на недоказанность причинной связи этих нарушений с приемом тербинафина, в случае развития гепатобилиарной дисфункции лечение Экзифином следует прекратить.

Со стороны ЦНС: редко - парестезия, гипестезия, головокружение; очень редко - депрессия, чувство повышенной тревоги.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия, миалгия.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: часто - крапивница, многоформная эритема, редко системные аллергические реакции (реакции подобные сывороточной болезни, ангионевротический отек); очень редко - тяжелые кожные реакции (токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона, фоточувствительность). При прогрессировании кожных высыпаний лечение тербинафином следует прекратить.

Прочие: часто - головная боль, плохое самочувствие, чувство усталости; очень редко - экзацербация псориаза, усиленное выпадение волос.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, боли в нижней части живота, в эпигастральной области.

Лечение: промывание желудка с последующим назначением активированного угля и/или симптоматическая терапия

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Практически не влияет на клиренс препаратов, метаболизирующихся с участием цитохрома Р450 (например, циклоспорин, терфенадин, толбутамид, триазолам, пероральные контрацептивы).

Иигибирует CYP206 и препятствует метаболизму таких препаратов как трициклические антидепрессанты и селективные блокаторы захвата серотонина (дезипрамин, флувоксамин), бета-адреноблокаторы (метопролол, пропранолол), противоаритмические средства (флекаинид, проавфенон), МАО-ингибиторы типа В (селегилин) и антинсихотические (хлорпромазин, галоперидол).

Лекарственные препараты - индукторы ферментов CYP450 (например, рифампицин) могут ускорять выведение тербинафина из организма.

Лекарственные препараты - ингибиторы CYP450 (например, циметидин) могут замедлить метаболизм и выведение тербинафина из организма. При одновременном применении этих препаратов может потребоваться коррекция дозы тербинафина.

Возможно нарушение менструального цикла при одновременном приеме тербинафина и пероральных контрацептивов.

Снижает клиренс кофеина на 21% и продливает время его полураспада на 31%.

Не влияет на клиренс антипирина, дигоксина, варфарина.

Этанол и другие гепатотоксичные препараты повышают риск развития гепатотоксического эффекта.

Особые указания и меры предосторожности:

Нерегулярное применение тербинафина или преждевременное прекращение лечения приводит к рецидиву заболевания.

На длительность терапии могут влиять и такие факторы, как наличие сопутствующих заболеваний, состояние ногтей в начале курса лечения.

Если через 2 недель лечения кожной инфекции не отмечается улучшения состояния, необходимо повторно определить возбудителя заболевания и его чувствительность к препарату.

Системное применение при онихомикозе оправдано только в случае тотального поражения большинства ногтей, наличия выраженного подногтевого гиперкератоза, неэффективности предшествующей местной терапии. При лечении онихомикоза клинический ответ, обычно, наблюдается через несколько месяцев после микологического излечения и прекращения курса лечения, что обусловлено скоростью отрастания здорового ногтя. Удаления ногтевых пластинок при лечении онихомикоза кистей в течение 3 нед. и онихомикоза стоп в течение 6 нед. не требуется.

При наличии тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 50 мл/мин или креатинин в крови более 300 мкмоль/л), при нарушении функции печени дозу тербинафина следует уменьшить вдвое.

При наличии заболевания печени клиренс тербинафина может быть сниженным.

При сниженной функции печени назначают половину взрослой дозой. Во время лечения необходимо контролировать уровень трансаминаз печени в сыворотке крови. В редких случаях через 3 месяца лечения возникает холестаз и гепатит. При появлении признаков нарушения функции печени (слабость, персистирующая тошнота, потеря аппетита, боли в животе, желтуха, потемнение мочи или бесцветный стул) препарат следует отменить.

Назначение тербинафина больным псориазом требует повышенной осмотрительности, т.к. в очень редких случаях тербинафин может спровоцировать вспышку псориаза.

П1ри лечении тербинафиием следует соблюдать общие правила гигиены для предотвращения возможности повторною инфицирования через белье и обувь. В процессе лечения (каждые 2 нед.) и в конце его необходимо производить противогрибковую обработку обуви, носков и чулок.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Тербинафин не влияет на способность управлять автомобилем и выполнять работы, требующие повышенной концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

С осторожностью.

При **выраженных нарушениях функции или почек (КК 50 мл/мин либо концентрация креатинина в крови более 300 мкмоль/л) -** 125 мг 1 раз/сут.

При нарушениях функции печени

С осторожностью.

При **выраженных нарушениях функции печени -** 125 мг 1 раз/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым больным препарат назначают в тех же лозах, что и взрослым.

Применение в детском возрасте

Противопоказан:

— детский возраст до 2 лет, т.к. нет достаточного количества данных о применении препарата детьми с массой тела менее 12 кг.

Детям обычно назначают 125 мг (1/2 таблетки). Продолжительность лечения микозов волосистой части головы - около 4 недель, при заражении Microsporum canis может быть более длительной.

При **массе тела менее 20 кг** - 62.5 мг (1/4 таблетки) 1 раз/сут, при **массе от 20 до 40 кг** - 125 мг (1/2 таблетки) 1 раз/сут, при **массе более 40 кг** - 250 мг (1 таблетка) 1 раз/сут.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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