

Флуконазол (капсулы)



Код АТХ:

- [J02AC01](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Флуконазол](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

♦ **Капсулы** размер №1, корпус и крышечка голубого цвета; содержимое капсул - гранулированный порошок белого или белого со слегка желтоватым оттенком цвета.

	1 капс.
флуконазол	150 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный 129 мг, поливинилпирролидон низкомолекулярный 18 мг, магния стеарат или кальция стеарат 3 мг.

Состав крышечки и корпуса капсул: титана диоксид 1%, индигодин (E132) 0.1333%, желатин до 100%.

- 1 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
- 1 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
- 1 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
- 3 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
- 3 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
- 3 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.

♦ **Капсулы** размер №3, корпус белого цвета, крышечка голубого цвета; содержимое капсул - гранулированный порошок белого или белого со слегка желтоватым оттенком цвета.

Флуконазол (капсулы)

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

	1 капс.
флуконазол	50 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный 43 мг, поливинилпирролидон низкомолекулярный 6 мг, магния стеарат или кальция стеарат 1 мг.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид 2%, желатин до 100%.

Состав крышечки капсулы: титана диоксид 1%, индигодин (E132) 0.1333%, желатин до 100%.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (7) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противогрибковое средство, обладает высокоспецифичным действием, ингибируя активность ферментов грибов, зависящих от цитохрома P450. Блокирует превращение ланостерола клеток грибов в эргостерол; увеличивает проницаемость клеточной мембраны, нарушает ее рост и репликацию.

Флуконазол, являясь высокоизбирательным для цитохрома P450 грибов, практически не угнетает эти ферменты в организме человека (в сравнении с итраконазолом, клотримазолом, эконазолом и кетоконазолом в меньшей степени подавляет зависящие от цитохрома P450 окислительные процессы в микросомах печени человека). Не обладает антиандрогенной активностью.

Активен при оппортунистических микозах, в т.ч. вызванных *Candida spp.* (включая генерализованные формы кандидоза на фоне иммунодепрессии), *Cryptococcus neoformans* и *Coccidioides immitis* (включая менингит и энцефалит), *Microsporium spp.* и *Trichophyton spp.*; при эндемических микозах, вызванных *Blastomyces dermatidis*, *Histoplasma capsulatum* (в т.ч. при иммунодепрессии).

Фармакокинетика

После приема внутрь флуконазол хорошо всасывается, прием пищи не влияет на скорость всасывания флуконазола, его биодоступность - 90%. Время C_{max} после приема внутрь, натощак 150 мг препарата - 0.5-1.5 ч и составляет 90% от концентрации в плазме при в/в введении в дозе 2.5-3.5 мг/л. $T_{1/2}$ флуконазола составляет 30 ч. Связывание с белками плазмы - 11-12%. Концентрация в плазме находится в прямой зависимости от дозы. 90% уровень равновесной концентрации достигается к 4-5 дню лечения препаратом (при приеме 1 раз/сут).

Введение "ударной" дозы (в первый день), в 2 раза превышающей обычную суточную дозу, позволяет достичь уровень концентрации, соответствующей 90% равновесной концентрации, ко второму дню.

Флуконазол хорошо проникает во все биологические жидкости организма. Концентрация активного вещества в грудном молоке, суставной жидкости, слюне, мокроте и перитонеальной жидкости аналогична таковой в плазме крови. Постоянные значения в вагинальном секрете достигаются через 8 ч после приема внутрь и удерживаются на этом уровне не менее 24 ч. Флуконазол хорошо проникает в спинномозговую жидкость (СМЖ), при грибковом менингите концентрация в СМЖ составляет около 85% от его уровня в плазме. В потовой жидкости, эпидермисе и роговом слое (селективное накопление) достигаются концентрации, превышающие сывороточные. После приема внутрь 150 мг на 7 день концентрация в роговом слое кожи - 23.4 мкг/г, а через 1 неделю после приема второй дозы - 7.1 мкг/г; концентрация в ногтях после 4 мес применения в дозе 150 мг 1 раз в неделю - 4.05 мкг/г в здоровых и 1.8 мкг/г в пораженных ногтях. V_d приближается к общему содержанию воды в организме. Является ингибитором изофермента CYP2C9 в печени. Выводится преимущественно почками (80% - в неизмененном виде, 11% - в виде метаболитов). Клиренс флуконазола пропорционален клиренсу креатинина (КК). Метаболитов флуконазола в периферической крови не обнаружено. Фармакокинетика флуконазола существенно зависит от функционального состояния почек, при этом существует обратная зависимость между $T_{1/2}$ и клиренсом креатинина. После гемодиализа в течение 3 ч концентрация флуконазола в плазме снижается на 50%.

Показания к применению:

— криптококкоз, включая криптококковый менингит и другие локализации данной инфекции (в т.ч. легкие, кожа), как у больных с нормальным иммунным ответом, так и у больных с различными формами иммунодепрессии (в т.ч. у больных СПИД, при трансплантации органов); препарат может использоваться для профилактики криптококковой инфекции у больных СПИД;

— генерализованный кандидоз, включая кандидемию, диссеминированный кандидоз и другие формы инвазивных кандидозных инфекций (инфекции брюшины, эндокарда, глаз, дыхательных и мочевых путей). Лечение может проводиться у больных со злокачественными новообразованиями, больных отделений интенсивной терапии, больных, проходящих курс цитостатической или иммуносупрессивной терапии, а также при наличии других факторов, предрасполагающих к развитию кандидоза;

— кандидоз слизистых оболочек, в том числе полости рта и глотки (в т.ч. атрофический кандидоз полости рта, связанный с ношением зубных протезов), пищевода, неинвазивные бронхолегочные кандидозы, кандидурия, кандидозы кожи; профилактика рецидивов орофарингеального кандидоза у больных СПИД;

— генитальный кандидоз: вагинальный кандидоз (острый и хронический рецидивирующий), профилактическое применение с целью уменьшения частоты рецидивов вагинального кандидоза (3 и более эпизодов в год);

— кандидозный баланит;

— профилактика грибковых инфекций у больных со злокачественными новообразованиями, которые предрасположены к таким инфекциям в результате химиотерапии цитостатиками или лучевой терапии;

— микозы кожи, включая микозы стоп, тела, паховой области;

— отрубевидный (разноцветный лишай) лишай;

— онихомикоз;

— кандидоз кожи;

— глубокие эндемические микозы, включая кокцидиомикоз и гистоплазмоз, у больных с нормальным иммунитетом.

Относится к болезням:

- [Баланит](#)
- [Бронхит](#)
- [Вагинит](#)
- [Инфекции](#)
- [Кандидоз кожи](#)
- [Лишай](#)
- [Менингит](#)
- [Микоз](#)
- [Разноцветный лишай](#)
- [Эндокардит](#)

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к препарату (в т.ч. к другим азольным противогрибковым лекарственным средствам в анамнезе);

— одновременный прием терфенадина (на фоне постоянного приема флуконазола в дозе 400 мг/сут и более) или астемизола, а также других препаратов, удлиняющих интервал QT;

— детский возраст до 4-х лет.

С осторожностью

Печеночная и/или почечная недостаточность, появление сыпи на фоне применения флуконазола у пациентов с поверхностной грибковой инфекцией и инвазивными/системными грибковыми инфекциями, одновременный прием потенциально гепатотоксичных лекарственных средств, потенциально проаритмогенные состояния у пациентов с множественными факторами риска (органические заболевания сердца, нарушения электролитного баланса, одновременный прием лекарственных средств, вызывающих аритмии), беременность.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Взрослым и детям старше 15 лет (масса тела более 50 кг) при криптококковом менингите и криптококковых инфекциях других локализаций в первый день обычно назначают 400 мг (8 капсул по 50 мг), а затем продолжают лечение в дозе 200 мг (4 капсулы по 50 мг) - 400 мг (8 капсул по 50 мг) 1 раз/сут. Продолжительность лечения при криптококковых инфекциях зависит от клинической эффективности, подтвержденной микологическим исследованием; при криптококковом менингите курс лечения должен быть не менее 6-8 недель.

Флуконазол (капсулы)

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

Для профилактики рецидива криптококкового менингита у больных СПИД, после завершения полного курса первичной терапии, флуконазол назначают в дозе 200 мг (4 капсулы по 50 мг)/сут в течение длительного периода времени.

При кандидемии, диссеминированном кандидозе и других инвазивных кандидозных инфекциях в первые сутки доза составляет 400 мг (8 капсул по 50 мг), а затем - по 200 мг (4 капсулы по 50 мг)/сут. При недостаточной клинической эффективности доза препарата может быть увеличена до 400 мг (8 капсул по 50 мг)/сут. Длительность терапии зависит от клинической эффективности препарата (100% рекомендуемой дозы).

При **КК от 11 до 50 мл/мин** применяется 50% от рекомендуемой дозы или обычная доза 1 раз в 2 дня.

Пациентам с нарушенной функцией почек флуконазол вводят по следующей схеме.

Клиренс креатинина	Интервал/суточная доза
более 40 мл/мин	24 ч (обычный режим дозирования)
21-40 мл/мин	48 ч (1 раз в двое суток) или половина обычной суточной дозы (1 раз в 24 ч)
10-20 мл/мин	72 ч (1 раз в трое суток) или 1/2 обычной суточной дозы (1/3 в 24 ч)

Больным, находящимся на гемодиализе, одна доза препарата применяется после каждого сеанса гемодиализа.

Побочное действие:

Нежелательные явления, представленные ниже, перечислены в зависимости от анатомо-физиологической классификации и частоты встречаемости. Частота встречаемости определяется следующим образом: часто - более 1%; нечасто - 0.1-1%; редко - 0.01-0.1%; очень редко - менее 0.01%.

Со стороны пищеварительной системы: снижения аппетита, изменение вкуса, тошнота, диарея, метеоризм, боль в животе, рвота, абдоминальные боли; редко - нарушение функции печени (желтуха, гепатоцеллюлярный некроз, гипербилирубинемия, повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ), аспаратаминотрансферазы (АСТ) и щелочной фосфатазы (ЩФ), гепатит, гепатонекроз), в т.ч. тяжелое.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, чрезмерная утомляемость; редко - судороги.

Со стороны органов кроветворения: редко - лейкопения, тромбоцитопения (кровотечения, петехии), нейтропения, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: кожная сыпь; редко - мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), анафилактоидные реакции (в т.ч. ангионевротический отек, отек лица, крапивница, зуд кожи).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: увеличение продолжительности интервала QT, мерцание/трепетание желудочков.

Прочие: редко - нарушение функции почек, алоpecia, гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия, гипокалиемия.

Передозировка:

Симптомы: галлюцинации, параноидальное поведение.

Лечение: симптоматическое (промывание желудка, форсированный диурез). Гемодиализ в ближайшие 3 ч снижает концентрацию на 50%.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата у беременных нецелесообразно, за исключением тяжелых или угрожающих жизни форм грибковых инфекций, когда потенциальная польза от применения флуконазола для матери значительно превышает риск для плода.

Поскольку концентрация флуконазола в грудном молоке и в плазме одинакова, применять препарат в период лактации противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При применении флуконазола с варфарином увеличивается протромбиновое время (в среднем на 12%). Рекомендуется контролировать протромбиновое время при сочетании флуконазола с кумариновыми антикоагулянтами

Флуконазол увеличивает $T_{1/2}$ из плазмы пероральных гипогликемических средств - производных сульфонилмочевины (хлорпропамид, глибенкламид, глипизид, толбутамид) у здоровых людей. Совместное применение Флуконазола и пероральных гипогликемических средств у больных сахарным диабетом допускается, однако врач должен иметь в виду возможность развития гипогликемии.

Одновременное применение флуконазола и фенитоина может привести к возрастанию концентрации фенитоина в плазме до клинически значимой степени. Поэтому при необходимости совместного применения этих препаратов необходимо мониторировать концентрации фенитоина с коррекцией его дозы с целью поддержания концентрации препарата в пределах терапевтического интервала.

Комбинация с рифампицином приводит к снижению AUC на 25 % и укорочению $T_{1/2}$ флуконазола из плазмы на 20%. Поэтому больным, получающим одновременно рифампицин, дозу флуконазола целесообразно увеличить.

Рекомендуется контролировать концентрацию циклоспорина в крови у пациентов получающих флуконазол, т.к. при применении флуконазола и циклоспорина у пациентов с пересаженной почкой прием флуконазола в дозе 200 мг/сут приводит к медленному повышению концентрации циклоспорина в плазме.

Больные, которые получают высокие дозы теофиллина или у которых имеется вероятность развития теофиллиновой интоксикации, должны находиться под наблюдением с целью выявления симптомов передозировки теофиллина, т.к. одновременные прием флуконазола приводит к снижению клиренса теофиллина из плазмы крови.

Имеются сообщения о взаимодействии флуконазола и рифабутина, сопровождавшегося повышением сывороточной концентрации последнего. При одновременном применении флуконазола и рифабутина описаны случаи увеита. Необходимо тщательно наблюдать больных, одновременно получающих рифабутин и флуконазол.

У больных, получающих комбинацию флуконазола и зидовудина, наблюдается увеличение концентрации зидовудина, которое вызвано снижением превращения последнего в его главный метаболит, поэтому следует ожидать увеличения побочных эффектов зидовудина.

При одновременном применении флуконазола, терфенадина и цизаприда описаны случаи нежелательных реакций со стороны сердца, включая аритмию типа "пируэт".

Одновременное применение флуконазола и гидрохлортиазида может привести к увеличению концентрации флуконазола на 40%.

Повышает концентрацию мидазолама, в связи с чем увеличивается риск развития психомоторных эффектов (более выражено при применении флуконазола внутрь, чем внутривенно).

Повышает концентрацию такролимуса, в связи с чем возрастает риск нефротоксического действия.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение необходимо продолжать до появления клинико-гематологической ремиссии. Преждевременное прекращение лечения приводит к рецидивам.

В редких случаях применение флуконазола сопровождалось токсическими изменениями печени, в т.ч. с летальным исходом, главным образом у больных с серьезными сопутствующими заболеваниями. В случае гепатотоксических эффектов, связаны с флуконазолом, не отмечено явной зависимости их от общей суточной дозы, длительности терапии, пола и возраста больного. Гепатотоксическое действие флуконазола обычно было обратимым; признаки его исчезали после прекращения терапии. При появлении клинических признаков поражения печени, которые могут быть связаны с флуконазолом, препарат следует отменить.

Больные СПИД более склонны к развитию тяжелых кожных реакций при применении многих препаратов. В тех случаях, когда у больных с поверхностной грибковой инфекцией развивается сыпь, и она расценивается как определенно связанная с флуконазолом, препарат следует отменить. При появлении сыпи у больных с инвазивными системными грибковыми инфекциями, их следует тщательно наблюдать и отменить флуконазол при появлении буллезных изменений или многоформной эритемы.

Необходимо соблюдать осторожность при одновременном приеме флуконазола с цизапридом, рифабутином или другими препаратами, метаболизирующимися системой цитохрома P450.

При нарушениях функции почек

Флуконазол (капсулы)

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

С осторожностью: почечная недостаточность.

При **КК от 11 до 50 мл/мин** применяется 50% от рекомендуемой дозы или обычная доза 1 раз в 2 дня.

Пациентам с нарушенной функцией почек флуконазол вводят по следующей схеме.

Клиренс креатинина	Интервал/суточная доза
более 40 мл/мин	24 ч (обычный режим дозирования)
21-40 мл/мин	48 ч (1 раз в двое суток) или половина обычной суточной дозы (1 раз в 24 ч)
10-20 мл/мин	72 ч (1 раз в трое суток) или 1/2 обычной суточной дозы (1/3 в 24 ч)

Больным, находящимся на гемодиализе, одна доза препарата применяется после каждого сеанса гемодиализа.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 4 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

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