

Форкокс



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

| Таблетки, покрытые пленочной оболочкой | 1 таб. |
|---|---------------|
| рифампицин | 150 мг |
| пиразинамид | 400 мг |
| этамбутола гидрохлорид | 275 мг |
| изониазид | 75 мг |

6 шт. - упаковки безъячейковые контурные (10) - пачки картонные.

10 шт. - упаковки безъячейковые контурные (10) - пачки картонные.

| Таблетки, покрытые пленочной оболочкой | 1 таб. |
|---|---------------|
| рифампицин | 225 мг |
| пиразинамид | 750 мг |
| этамбутола гидрохлорид | 400 мг |
| изониазид | 150 мг |

6 шт. - упаковки безъячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Форкокс представляет собой комбинированный препарат, содержащий фиксированные количества рифампицина, изониазида, пиразинамида и этамбутола.

Комбинированное применение активных веществ, входящих в состав препарата, снижает риск развития резистентности, которая развивается при монотерапии туберкулеза.

Рифампицин

Механизм действия рифампицина заключается в угнетении ДНК-зависимой РНК-полимеразы. При туберкулезе рифампицин оказывает бактерицидное действие, как на внутриклеточные, так и на внеклеточные микроорганизмы.

Изониазид

Изониазид оказывает бактерицидное действие на активно делящиеся клетки *Mycobacterium tuberculosis*. Механизм его действия заключается в угнетении синтеза миколовых кислот, являющихся компонентом клеточной стенки микобактерий. Для *Mycobacterium tuberculosis* минимальная ингибирующая концентрация (МИК) изониазида составляет 0.05-0.025 мг/л. Резистентность к изониазиду возникает быстро.

Пиразинамид

Пиразинамид оказывает бактерицидное действие при кислых значениях pH. Предполагается, что для проявления

бактерицидной активности этого препарата необходимо ферментативное превращение пиразинамида в активную форму - пиразиновую кислоту.

Чувствительность различных штаммов *Mycobacterium tuberculosis* пиразинамиду зависит от активности этого фермента, которую можно измерить *in vitro*, оценив тем самым чувствительность конкретного штамма. При кислых значениях pH МИК пиразинамида *in vitro* составляет 20 мг/л. Пиразинамид не действует на атипичные микоактерии.

Этамбутол

Этамбутол - это бактериостатический препарат, который эффективен в отношении *Mycobacterium tuberculosis*, резистентных к другим противотуберкулезным препаратам. Этамбутол подавляет синтез клеточной стенки, блокируя включение в нее миколовых кислот. Этамбутол активен практически против всех штаммов *Mycobacterium tuberculosis* и *Mycobacterium bovis*, а также против *Mycobacterium kansasii*.

Фармакокинетика

Рифампицин

После приема препарата Форкокк здоровыми взрослыми C_{\max} рифампицина в плазме достигает 7.84 мкг/мл. В случае приема вместе с пищей абсорбция рифампицина, снижается на 30%. C_{\max} рифампицина в плазме достигается через 2 ч. Рифимпидин широко распределяется в организме, быстро проникая в органы и ткани (наибольшая концентрация создается в печени и почках), также проникает в костную ткань. Концентрация в слюне составляет 20% от плазменной. Рифампицин проникает через ГЭБ только в случае воспаления мозговых оболочек. Проникает через плаценту (концентрация в плазме плода - 33% от концентрации в плазме матери) и в грудное молоко (вскармливаемые грудным молоком дети получают не более 1% от терапевтической дозы препарата). Примерно 80% принятой дозы связывается с белками плазмы. $T_{1/2}$ рифампицина составляет, в среднем, 3.35 ± 0.66 ч. Рифампицин метаболизируется в печени до фармакологически активного дезацетилрифампицина, выводится из организма почками (до 30% принятой дозы).

Изониазид

После приема препарата Форкокк здоровыми взрослыми C_{\max} изониазид в плазме достигает 4.75 мкг/мл через 2 ч. $T_{1/2}$ изониазид из плазмы составляет 2-6 ч. Изониазид подвергается выраженному предсистемному метаболизму в стенке тонкой кишки и печени, в результате чего его концентрация в плазме больных с быстрым процессом ацетилирования составляет половину от концентрации у больных с медленным процессом ацетилирования. Кажущийся V_d изониазид составляет 61% от массы тела. Изониазид присутствует в эффективных концентрациях во многих тканях и биологических жидкостях, включая спинномозговую жидкость. До 95% принятой дозы изониазид выводится почками в течение 24 ч, остальное выводится через кишечник. Главными продуктами экскреции в моче являются N-ацетилизониазид и изоникотиновая кислота.

Пиразинамид

После приема препарата Форкокк здоровыми взрослыми C_{\max} пиразинамида в плазме достигает 24.13 мкг/мл через 3 ч. $T_{1/2}$ пиразинамида составляет 10-24 ч. Препарат широко распределяется в организме, хорошо проникает в ткани и биологические жидкости, включая спинномозговую жидкость. Его концентрации в спинномозговой жидкости почти идентичны таковым в крови. В печени пиразинамид превращается в главный активный метаболит - пиразиновую кислоту. Примерно 30-40% принятой дозы выводится почками в виде пиразиновой кислоты и 3.4% в виде неизмененного пиразинамида.

Этамбутол

После приема препарата Форкокк здоровыми взрослыми C_{\max} этамбутола в плазме достигает 3.45 мкг/мл через 2 ч. Далее концентрация снижается двухфазным образом: в начале $T_{1/2}$ составляет 4 ч и затем 10 ч. Этамбутол хорошо проникает в ткани и органы (в спинномозговую жидкость только при менингите). Примерно 50-70% принятой дозы выводится почками в неизмененном виде, а остальная часть - в виде альдегидных и карбоксильных метаболитов. Средний объем распределения составляет 3.89 л/кг. Около 10-40% препарата связывается с белками плазмы. Незначительная часть принятой дозы метаболизируется в печени и, возможно, в других тканях. Метаболит выводится почками. У пациентов с нарушениями функции почек элиминация этамбутола замедляется.

Показания к применению:

— начальная стадия туберкулеза легких и внелегочного туберкулеза.

Относится к болезням:

- [Туберкулез](#)

Противопоказания:

- нарушения зрения (диабетическая ретинопатия, поражение зрительного нерва, воспалительные заболевания глаз);
- эпилепсия и склонность к судорожным припадкам, перенесенный ранее полиомиелит;
- нарушения функции печени и почек, подагра, желтуха, острый гепатит;
- тромбофлебит, выраженный атеросклероз;
- повышенная чувствительность к любому ингредиенту этого препарата.

С осторожностью: при беременности и лактации, детям до 13 лет, лицам пожилого возраста, при психозе, подагре.

Способ применения и дозы:

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержащая изониазида 75 мг, рифампицина 150 мг, пиразинамида 400 мг, этамбутола 275 мг принимается внутрь за 1-2 ч до еды по 4 таб./сут однократно больным, масса тела которых не превышает 50 кг. Курс лечения - 2 мес.

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержащая изониазида 150 мг, рифампицина 225 мг, пиразинамида 750 мг, этамбутола 400 мг принимается внутрь за 1-2 ч до еды по 2 таб./сут однократно больными, масса тела которых не менее 60 кг. Курс лечения - 2 мес.

Возможно применение препарата в комбинации с другими противотуберкулезными средствами, такими как стрептомицин и др.

Побочное действие:

Побочные эффекты при лечении препаратом Форкокк определяются входящими в его состав активными ингредиентами.

Рифампицин может вызвать побочные эффекты *со стороны пищеварительной системы*, такие, как изжога, неприятные ощущения в эпигастрии, анорексия, тошнота, рвота, снижение аппетита, кишечные колики и диарея, эрозивный гастрит, псевдомембранозный энтероколит, повышение активности печеночных трансаминаз в сыворотке крови, гипербилирубинемия. У мужчин изредка наблюдается токсическое поражение печени, которое обычно развивается в первые две недели после начала лечения.

Со стороны нервной системы: боль, сонливость, слабость, атаксия, головокружение, спутанность сознания, зрительные расстройства, дезориентация.

Со стороны мочевыделительной системы: нефронекроз, интерстициальный нефрит.

Аллергические реакции: отек Квинке, бронхоспазм, артралгия, лихорадка, кожные высыпания и эозинофилия

Прочие: лейкопения, дисменорея, индукция порфирии, мышечная слабость, гиперурикемия, обострение подагры.

При нерегулярной терапии или при возобновлении лечения после перерыва, возможны: гриппоподобный синдром (лихорадка, озноб, головная боль, головокружение, боль в горле и болезненность языка, миалгия), кожные реакции, гемолитическая анемия, тромбоцитопеническая пурпура, острая почечная недостаточность.

Изониазид

Со стороны нервной системы: редко - чрезмерная утомляемость или слабость, раздражительность, эйфория, бессонница, неврит зрительного нерва, полиневрит, психозы, изменение настроения, депрессия; возможны головная боль, головокружение; у больных эпилепсией могут учащаться припадки. Длительный прием изониазида вызывает периферическую нейропатию у 3.5-17% пациентов.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, стенокардия, повышение АД.

Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, тошнота, рвота, развитие лекарственного гепатита. Профилактическое и лечебное использование изониазида в комбинации с другими противотуберкулезными препаратами связано со значительным риском токсического поражения печени.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, гипертермия, артралгия.

Редко: гинекомастия у мужчин и меноррагии у женщин.

Пиразинамид

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, "металлический" привкус во рту, обострение пептической язвы. Пиразинамид может вызвать поражение печени и молниеносный гепатит с нарушением функции печени (желтая атрофия печени). Вероятность токсического поражения печени возрастает с увеличением дозы и продолжительности лечения. При дозе 3 г в сутки признаки поражения печени наблюдаются примерно у 15% пациентов. Отмена пиразинамида приводит к быстрой нормализации уровней печеночных ферментов.

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, нарушения сна, повышенная возбудимость, депрессии; в отдельных случаях: галлюцинации, судороги, спутанность сознания.

Со стороны органов кроветворения и системы гемостаза: тромбоцитопения, сидеробластная анемия, вакуолизация эритроцитов, порфирия, гиперкоагуляция, спленомегалия.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия, миалгия.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, интерстициальный нефрит.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница.

Прочие: гипертермия, акне, гиперурикемия, обострение подагры, фотосенсибилизация, повышение концентрации сывороточного Fe.

Этамбутол

Самыми серьезными побочными эффектами этамбутола является ретробульбарный неврит, проявляющийся снижением остроты зрения, сужением поля зрения, центральной или нерефракционной скотомой и нарушение цветового восприятия, особенно способности различать зеленый и красный цвета.

Другие побочные эффекты включают:

Со стороны нервной системы: спутанность сознания, дезориентацию, галлюцинации, головную боль, головокружение, общее недомогание, слабость, депрессия, периферическую невропатию.

Со стороны пищеварительной системы: желудочно-кишечные нарушения: металлический привкус во рту, тошноту, рвоту, анорексию, боль в животе, желтуху и транзиторное нарушение функции печени.

Возможны гиперурикемия и обострение подагры, а также аллергические реакции: дерматит, кожная сыпь, зуд, артралгия, лихорадка, анафилаксия.

Передозировка:

Симптомы: отек легких, спутанность сознания, судороги, периферическая невропатия, нарушение функции печени, тошнота, рвота, нарушение зрения и слуха, невнятная речь, угнетение дыхания, ступор, кома.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля; симптоматическая терапия, форсированный диурез, искусственная вентиляция легких, в/в - барбитураты короткого действия, пиридоксин, осмотические диуретики, натрия бикарбонат при развитии метаболического ацидоза.

Применение при беременности и кормлении грудью:

С осторожностью: при беременности и лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Рифампицин

Рифампицин ускоряет метаболизм фенитоина, хинидина, пероральных антикоагулянтов и противогрибковых препаратов.

Антациды, опиаты снижают биодоступность рифампицина.

Рифампицин снижает активность пероральных гипогликемических препаратов, пероральных гормональных контрацептивов, препаратов наперстянки, антиаритмиков (дизопирида, мексилетина), глюкокортикостероидов, дапсона, гидантоинов (фенитоин), гексобарбитала, нортриптилина, бензодиазепинов, половых гормонов, теофиллина, хлорамфеникола, кетоконазола, интроконазола, циклоспорина А, бета-адреноблокаторов, эналаприла и циметидина.

Изониазид

Изониазид усиливает эффекты фенитоина, такие как сонливость и атаксия.

Преднизолон может существенно снижать конценграцию изониазида в плазме крови у медленных и быстрых ацетиляторов, но этот эффект более выражен у медленных ацетиляторов. Изониазид повышает частоту и тяжесть нарушений функции печени в комбинации с рифампицином у больных с предшествующими заболеваниями печени.

Препараты ПАСК, содержащие бентонит (алюминия гидросиликат), назначают спустя четыре часа после приема изониазида. Антациды уменьшают абсорбцию изониазида.

Изониазид снижает эффективность пероральных контрацептивных препаратов, пероральных гипогликемических препаратов, теофиллина, толазомида, витамина В₁ (усиливает его экскрецию); уменьшает выведение триазолама; снижает содержание цинка в крови (увеличивает его выведение).

Этамбутол

Гидроксид алюминия нарушает абсорбцию этамбутола, и поэтому необходимо использовать альтернативные антациды.

При совместном применении с нейротоксическими средствами возможно усиление нейротоксического действия этамбутола.

Пиразинамид

Пиразинамид несколько снижает концентрацию изониазида в сыворотке крови, особенно у медленных ацетиляторов.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом лечения рекомендуется проведение полного офтальмологического обследования пациента, которое включает в себя определение остроты зрения, цветного зрения, полей зрения и офтальмоскопию. Если до лечения использовались корректирующие очки, то они должны быть надеты во время оценки остроты зрения. В течение 1-2 лет терапии может развиваться ошибка рефракции, которая должна быть исправлена для получения точных результатов исследования. Исследование остроты зрения через стенопическое отверстие устраняет ошибку рефракции. Прогрессирующее ухудшение зрения во время лечения следует рассматривать как побочный эффект приема препарата Форкокк. Подобное нарушение со стороны органа зрения, в основном, обратимо после прекращения приема препарата. В редких случаях восстановление может быть отсрочено на 1 год и более и может носить необратимый характер. Поэтому пациентам необходимо рекомендовать немедленно сообщать врачу о любом изменении остроты зрения.

При назначении препарата следует учитывать, что моча, фекалии, слюна и слезы могут окрашиваться в оранжевый цвет.

В последнем триместре беременности Форкокк следует назначать с витамином К, т.к. рифампицин может вызвать постнатальные гемorragии у матери и плода. Нельзя прерывать (случайно или намеренно) прием препарата без согласования с врачом.

Женщинам в период лечения рекомендуется использовать негормональные методы контрацепции.

В период лечения не следует применять микробиологические методы определения концентрации фолиевой кислоты и цианокобаламина в сыворотке крови.

Следует соблюдать осторожность при применении у больных пожилого возраста, в связи с повышенным риском развития токсических явлений.

Во избежание развития гепатотоксического эффекта во время лечения следует избегать приема этанола.

Употребление в пищу во время терапии определенных сортов сыра (швейцарский, чеширский) или рыбы (тунец, сардины) может привести к появлению зуда кожных покровов, сердцебиения, озноба и головной боли (ингибирование MAO и диаминооксидазы плазмы изониазида, что влияет на метаболизм терамина и гистамина, обнаруженных в рыбе и сыре).

Пиразинамид ухудшает течение подагры и сахарного диабета, необходим контроль функции почек, мочевой кислоты. В случае стойкого повышения уровня кислоты и обострения подагрического артрита лечение отменяют.

При нарушениях функции печени

Во избежание развития гепатотоксического эффекта во время лечения следует избегать приема этанола.

Применение в пожилом возрасте

Следует соблюдать осторожность при применении у больных пожилого возраста, в связи с повышенным риском

Форкокк

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

развития токсических явлений.

Применение в детском возрасте

С осторожностью: детям до 13 лет.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25° С. Хранить в местах, недоступных для детей. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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