Канамицин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Канамицин

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы аминогликозидов широкого спектра действия, продуцируемый Streptomyces kanamyceticus. Оказывает бактерицидное действие.

Активен в отношении Mycobacterium tuberculosis, грамотрицательных бактерий: Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Proteus spp., Enterobacter spp., Klebsiella pneumoniae, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis; грамположительных кокков: Staphylococcus spp. (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу).

К канамицину малочувствительны или устойчивы Pseudomonas spp., Streptococcus spp.

К канамицину устойчивы анаэробные бактерии, дрожжи, вирусы и большинство простейших.

Фармакокинетика

При приеме внутрь практически не абсорбируется (через неповрежденную слизистую оболочку кишечника всасываются лишь около 1%, через поврежденную или изъязвленную слизистую оболочку ЖКТ могут всасываться большие количества), оказывает местное действие. Время достижения C_{max} при в/м введении - 0.5-1.5 ч, после 30 мин в/в инфузии – 30 мин, после 60 мин в/в инфузии – 15 мин. C_{max} после в/в или в/м введения 7.5 мг/кг – 22 мкг/мл. Проникает в плевральную полость, лимфатическую, синовиальную и перитонеальную жидкости, сыворотку крови, бронхиальный секрет и желчь. В желчи C_{max} достигается через 6 ч. Высокие концентрации обнаруживаются в моче; низкие концентрации - в желчи, грудном молоке, водянистой влаге, бронхиальном секрете, мокроте и спинномозговой жидкости. Хорошо проникает во все ткани организма, где накапливается внутриклеточно; высокие концентрации отмечаются в органах с хорошим кровоснабжением: легкие, печень, миокард, селезенка, и особенно в почках, где накапливается в корковом веществе, более низкие концентрации – в мышцах, жировой ткани и костях. В норме канамицин не проходит через ГЭБ, однако при воспалении мозговых оболочек концентрация препарата в спинномозговой жидкости достигает 30-60% от таковой в плазме. У новорожденных создаются более высокие концентрации в спинномозговой жидкости, чем у взрослых. Проникает через плацентарный барьер, обнаруживается в крови плода и амниотической жидкости. V_d у взрослых – 0.26 л/кг, у детей – 0.2-0.4 л/кг, у новорожденных в возрасте до 1 недели и массой тела менее 1.5 кг - до 0.68 л/кг, в возрасте до 1 недели и массой тела более 1.5 кг - до 0.58 л/кг, у больных муковисцидозом – 0.3-0.39 л/кг. Не метаболизируется.

$T_{1/2}$ у взрослых – 2-4 ч, у новорожденных – 5-8 ч, у детей более старшего возраста – 2.5-4 ч. Конечный $T_{1/2}$ – более 100 ч (высвобождение из внутриклеточных депо). После парентерального введения выводится почками путем клубочковой фильтрации преимущественно в неизмененном виде (70-95% обнаруживается в моче через 24 ч), при приеме внутрь – с калом. $T_{1/2}$ у взрослых при нарушении функции почек варьирует в зависимости от степени

нарушения функции до 100 ч, у больных с муковисцидозом – 1-2 ч, у больных с ожогами и гипертермией $T_{1/2}$ может быть короче по сравнению со средними показателями вследствие повышенного клиренса. Выводится при гемодиализе (50% за 4-6 ч), перитонеальный диализ менее эффективен (25% за 48-72 ч).

Показания к применению:

Для парентерального применения: инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к канамицину микроорганизмами; туберкулез (в случае устойчивости микобактерий к стрептомицину и фтивазиду).

Для приема внутрь: кишечные инфекции, вызванные чувствительной микрофлорой (в т.ч. дизентерия, дизентерийное бактерионосительство, бактериальный колит, энтероколит); подготовка к операциям на органах ЖКТ.

Для местного применения в офтальмологии: конъюнктивит, блефарит, кератит, язвы роговицы.

Относится к болезням:

- Блефарит
- Дизентерия
- Инфекции
- Кератит
- Колит
- Конъюнктивит
- Туберкулез
- Энтерит

Противопоказания:

Нарушение функции печени, снижение слуха (в т.ч. в результате поражения слухового нерва), непроходимость ЖКТ, повышенная чувствительность к канамицину и другим аминогликозидам в анамнезе.

Для парентерального введения: тяжелая хроническая почечная недостаточность с азотемией и уремией, неврит VIII пары ЧМН, беременность.

Способ применения и дозы:

При инфекциях нетуберкулезной этиологии взрослым в/м или в/в (капельно) вводят по 500 мг каждые 8-12 ч, суточная доза составляет 1-1.5 г; максимальная разовая доза - 1 г с интервалом между введениями 12 ч, максимальная суточная доза - 2 г. Длительность лечения - 5-7 дней. Детям вводят только в/м, максимальная суточная доза - 15 мг/кг, кратность введения - 2-3 раза/сут.

При туберкулезе взрослым - 1 г 1 раз/сут, детям - по 15 мг/кг. Вводят в течение 6 дней ежедневно, на 7-й день - перерыв. Количество курсов и общая продолжительность лечения определяются индивидуально.

Канамицин вводят в полости (плевральную, полость сустава) в виде водного раствора, применяют в виде аэрозоля и тепловлажных ингаляций.

При проведении перитонеального диализа 1-2 г растворяют в 500 мл диализирующей жидкости.

При почечной недостаточности следует уменьшить дозу или увеличить интервалы между введениями.

При приеме внутрь разовая доза для взрослых составляет 0.5-1 г. Для детей доза составляет 50 мг/кг/сут. Частота применения зависит от показаний.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, нарушение функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия); при длительном приеме внутрь – синдром мальабсорбции (диарея, метеоризм, светлый, пенистый, масляный стул).

Со стороны системы кроветворения: анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, сонливость, слабость, нейротоксическое действие (подергивание мышц, ощущение онемения, покалывания, парестезии, эпилептические припадки); при парентеральном введении (главным образом при в/в и внутриполостном) возможна нервно-мышечная блокада.

Со стороны органов чувств: ототоксичность (звон или ощущение закладывания в ушах, снижение слуха вплоть до необратимой глухоты), токсическое действие на вестибулярный аппарат (дискоординация движений, головокружение, тошнота, рвота), неврит слухового нерва; при местном применении - ощущение инородного тела в глазу (в течение 3-5 мин), слезотечение, отек и гиперемия век.

Со стороны мочевыделительной системы: увеличение или уменьшение частоты мочеиспускания, жажда, нарушение функции почек (цилиндрурия, микрогематурия, альбуминурия).

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, гиперемия кожи, лихорадка, отек Квинке.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Канамицин противопоказан к применению при беременности. При необходимости применения канамицина в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении бета-лактамные антибиотики (цефалоспорины, пенициллины) у больных с тяжелой хронической почечной недостаточностью снижают эффект аминогликозидов.

При одновременном применении налидиксовая кислота, полимиксин, цисплатин и ванкомицин увеличивают риск развития ото- и нефротоксичности.

При одновременном применении диуретики (особенно фуросемид), цефалоспорины, пенициллины, сульфаниламиды и НПВС, конкурируя за активную секрецию в канальцах нефрона, блокируют элиминацию аминогликозидов, повышают их концентрацию в сыворотке крови, усиливая нефро- и нейротоксичность.

Циклопропан увеличивает риск развития апноэ при внутрибрюшинном введении канамицина.

Парентеральное введение индометацина увеличивает риск развития токсических действий аминогликозидов (увеличение $T_{1/2}$ и снижение клиренса).

Канамицин снижает эффект антимиастенических лекарственных средств, усиливает миорелаксирующее действие курареподобных препаратов, общих анестетиков и полимиксинов.

При одновременном применении метоксифлуран, полимиксины для парентерального введения и другие лекарственные средства, блокирующие нервно-мышечную передачу (галогенизированные углеводороды в качестве препаратов для ингаляционной анестезии, опиоидные анальгетики, переливание больших количеств крови с цитратными консервантами), увеличивают риск возникновения нефротоксического действия и остановки дыхания (в результате усиления нервно-мышечной блокады).

Канамицин фармацевтически несовместим с стрептомицином, гентамицином, мономицином, пенициллинами, гепарином, цефалоспоринами, капреомицином, амфотерицином В, эритромицином, нитрофурантоином, виомицином.

Особые указания и меры предосторожности:

Не применять одновременно или последовательно с другими антибиотиками, обладающими ототоксическими и нефротоксическими свойствами (в т.ч. со стрептомицином, мономицином, неомицином, гентамицином, флоримицином), совместно с диуретиками (в т.ч. в фуросемидом, маннитолом) и миорелаксантами (усиление и увеличение длительности миорелаксации).

С осторожностью и только по жизненным показаниям применять при миастении, паркинсонизме, ботулизме (аминогликозиды могут вызвать нарушение нервно-мышечной передачи, что приводит к дальнейшему ослаблению скелетной мускулатуры), почечной недостаточности, у пациентов пожилого возраста.

При появлении симптомов побочного действия канамицин следует отменить.

В период лечения рекомендуется контролировать функцию почек и проводить аудиометрию - не реже 1 раза в неделю при лечении инфекций нетуберкулезной этиологии и не реже 1 раза в месяц при лечении туберкулеза.

При в/в или внутриплевральном введении в случае появления признаков угнетения дыхания следует прекратить введение канамицина и немедленно ввести в/в раствор хлористого кальция и п/к раствор прозерина с атропином. При необходимости больного переводят на управляемое дыхание.

Пациентам с инфекционно-воспалительными заболеваниями мочевыводящих путей рекомендуется принимать повышенное количество жидкости. При отсутствии положительной клинической динамики следует помнить о

возможности развития резистентных микроорганизмов. В подобных случаях необходимо отменить лечение и начать проведение соответствующей терапии. В связи с возможностью развития нервно-мышечной блокады в/в введение неразбавленного канамицина не рекомендуется. При печеночной коме применяют с целью длительного угнетения бактерий кишечной флоры для уменьшения интоксикации аммиаком.

С осторожностью и только по жизненным показаниям применять у недоношенных детей, у детей в возрасте до 1 месяца.

При нарушениях функции почек

Противопоказанием для парентерального введения является тяжелая хроническая почечная недостаточность с азотемией и уремией.

С осторожностью и только по жизненным показаниям применять при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при нарушении функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью и только по жизненным показаниям применять у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

С осторожностью и только по жизненным показаниям применять у недоношенных детей, у детей в возрасте до 1 месяца.

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