Клион (раствор)



Код АТХ:

- J01XD01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Метронидазол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для инфузий прозрачный, бесцветный или слегка зеленоватого или зеленовато-желтого цвета, без механических включений.

	1 мл	**1 фл.**
метронидазол	5 мг	500 мг

Вспомогательные вещества: натрия дигидрофосфата дигидрат, натрия гидрофосфата додекагидрат, натрия хлорид, вода д/и.

100 мл - флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопротозойный и противомикробный препарат, производное 5-нитроимидазола. Механизм действия

заключается в биохимическом восстановлении 5-нитрогруппы метронидазола внутриклеточными транспортными протеинами анаэробных микроорганизмов и простейших. Восстановленная 5-нитрогруппа метронидазола взаимодействует с ДНК клетки микроорганизмов, ингибируя синтез нуклеиновых кислот, что ведет к гибели микроорганизмов.

Активен в отношении Trichomonas vaginalis, Entamoeba hystolitica, Gardnerella vaginalis, Giardia intestinalis, а также облигатных анаэробов Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides distasonis, Bacteroides vulgatus), Fusobacterium spp., Veillonella spp., Prevotella (Prevotella bivia, Prevotella buccae, Prevotella disiens) и некоторых грамположительных микроорганизмов (Eubacterium spp., Clostridium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp.). МПК для этих штаммов составляет 0.125-6.25 мкг/мл. В сочетании с амоксициллином проявляет активность в отношении Helicobacter pylori (амоксициллин подавляет развитие резистентности к метронидазолу).

К метронидазолу нечувствительны аэробные микроорганизмы и факультативные анаэробы, но в присутствии смешанной флоры (аэробы и анаэробы) метронидазол действует синергично с антибиотиками, эффективными против обычных аэробов.

Увеличивает чувствительность опухолей к облучению, вызывает дисульфирамоподобные реакции, стимулирует репаративные процессы.

Фармакокинетика

Распределение

Обладает высокой проникающей способностью, достигая бактерицидных концентраций в большинстве тканей и жидкостей организма, в т.ч. в легких, почках, печени, коже, спинномозговой жидкости, мозге, желчи, слюне, амниотической жидкости, полости абсцессов, вагинальном секрете, семенной жидкости, грудном молоке, проникает через ГЭБ и плацентарный барьер.

V_d для взрослых составляет примерно 0.55 л/кг, для новорожденных 0.54-0.81 л/кг. C_{max} составляет от 6 до 40 мкг/мл в зависимости от дозы. Связь с белками плазмы - 10-20%. При в/в введении 500 мг в течение 20 мин C_{max} в сыворотке крови через 1 час - 35.2 мкг/мл. Концентрация метронидазола в сыворотке крови через 4 ч - 33.9 мкг/мл, через 8 ч - 25.7 мкг/мл; C_{min} при последующем введении - 18 мкг/мл. T_{max} - 30-60 мин, терапевтическая концентрация сохраняется в течение 6-8 ч. При нормальном желчеобразовании концентрация метронидазола в желчи после в/в введения может значительно превышать концентрацию в плазме.

Метаболизм

Около 30-60% введеной дозы метронидазола метаболизируется путем гидроксилирования, окисления и глюкуронирования. Основной метаболит (2-оксиметронидазол) также оказывает противопротозойное и противомикробное действие.

Выведение

$T_{1/2}$ при нормальной функции печени - 8 ч (от 6 до 12 ч). Выводится почками 60-80% (20% - в неизмененном виде), 6-15% выводится через кишечник.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ при алкогольном поражении печени - 18 ч (от 10 до 29 ч), у новорожденных, родившихся на сроке беременности 28-30 нед. - примерно 75 ч, на сроке 32-35 нед. - 35 ч, на сроке 36-40 нед. - 25 ч.

При выраженных нарушениях функции почек (КК менее 10 мл/мин) у пациентов может наблюдаться кумуляция метронидазола в сыворотке крови после повторного введения препарата. В этом случае дозу препарата необходимо уменьшить вдвое.

Метронидазол и основные метаболиты быстро удаляются из крови при гемодиализе ($T_{1/2}$ сокращается до 2.6 ч). При перитонеальном диализе выводится в незначительных количествах.

Показания к применению:

— протозойные инфекции: внекишечный амебиаз, в т.ч. амебный абсцесс печени, кишечный амебиаз (амебная дизентерия), трихомониаз (в т.ч. трихомонадный вагинит, трихомонадный уретрит), балантидиаз, лямблиоз, кожный лейшманиоз;

— инфекции, вызываемые Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides distasonis, Bacteroides vulgatus): инфекции костей и суставов, инфекции ЦНС (в т.ч. менингит, абсцесс мозга), бактериальный эндокардит, пневмония, эмпиема и абсцесс легких, сепсис;

— инфекции, вызываемые Clostridium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp.: инфекции брюшной полости (перитонит, абсцесс печени), инфекции органов малого таза (эндометрит, абсцесс фаллопиевых труб и яичников,

инфекции свода влагалища), инфекции кожи и мягких тканей;

— псевдомембранозный колит (связанный с применением антибиотиков);

— гастрит или язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированные с Helicobacter pylori;

— профилактика послеоперационных осложнений (особенно после вмешательств на ободочной кишке, околоректальной области, аппендэктомии, а также после гинекологических операций).

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Абсцесс печени
- Амебиаз
- Амебная дизентерия
- Баланит
- Балантидиаз
- Вагинит
- Гастрит
- Дизентерия
- Инфекции
- Колит
- Лейшманиоз
- Менингит
- Перитонит
- Пневмония
- Сепсис
- Трихомониаз
- Уретрит
- Эмпиема
- Эндокардит
- Эндометрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки

Противопоказания:

— органические поражения ЦНС (в т.ч. эпилепсия);

— печеночная недостаточность (в случае назначения препарата в высоких дозах);

— лейкопения (в т.ч. в анамнезе);

— I триместр беременности;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к метронидазолу или к другим нитроимидазолам.

С *осторожностью:* II и III триместры беременности, почечная/печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы:

В/в капельно. Скорость введения - 5 мл/мин.

При улучшении состояния больного следует переводить на пероральный прием препарата.

Инфекции, вызванные анаэробными микроорганизмами

Взрослые (с массой тела около 70 кг) и дети в возрасте старше 12 лет: начальная доза составляет 15 мг/кг (3 мл/кг). Поддерживающая доза составляет 7.5 мг/кг (1.5 мл/кг) каждые 6 ч в течение 3 сут. Далее в той же дозе - каждые 12 ч. Максимальная суточная доза - 4 г.

Средняя продолжительность терапии составляет 7-10 дней, однако для лечения более тяжелых инфекций может потребоваться 2-3 недели.

Дети в возрасте младше 12 лет: начальная доза составляет 7.5 мг/кг (1.5 мл/кг) каждые 8 ч в течение 3 сут. Далее в той же дозе - каждые 12 ч.

Для предупреждения послеоперационных осложнений

Взрослые (с массой тела около 70 кг) и дети старше 12 лет: в/в капельно в дозе 15 мг/кг (3 мл/кг) в течение 30-60 мин. Введение препарата необходимо прекратить за 1 ч до начала операции. В случае необходимости через 6-8 ч или даже через 12-16 ч после операции препарат можно ввести в дозе 7.5 мг/кг (1.5 мл/кг).

Дети в возрасте до 12 лет: схема введения препарата одинакова с вышеуказанной, но разовая в/в доза составляет 7.5 мг/кг (1.5 мл/кг).

Нарушение функции почек не оказывает существенного влияния на фармакокинетические показатели препарата, поэтому дозы Клиона можно не менять. У **пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек, не находящихся на гемодиализе, при КК < 10 мл/мин** суточную дозу препарата следует уменьшить в 2 раза.

Метронидазол и его метаболиты хорошо выводятся при гемодиализе. Т.к. во время **гемодиализа** $T_{1/2}$ резко уменьшается (приблизительно до 3 ч), в некоторых случаях может быть необходимо дополнительное введение препарата.

При **тяжелых заболеваниях печени** метронидазол метаболизируется медленнее. Вследствие этого метронидазол и его метаболиты могут накапливаться в плазме крови. В этих случаях дозу и интервалы между введениями препарата устанавливают в зависимости от степени поражения печени.

У **пациентов пожилого возраста** возможно изменение фармакокинетики метронидазола, поэтому может потребоваться контроль концентрации метронидазола в сыворотке крови.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, потеря аппетита, обложенность языка, горький, металлический привкус во рту, сухость во рту, глоссит, схваткообразные боли внизу живота, диарея, запор, панкреатит.

Со стороны гепатобилиарной системы: повышение активности печеночных ферментов, холестаз, желтуха.

Со стороны системы кроветворения: обратимая нейтропения (лейкопения).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: периферическая невропатия (чувство онемения конечностей), редко и только при длительном применении встречаются головные боли, судороги, сонливость, головокружение, нарушение координации движений, спутанность сознания, депрессия, повышенная возбудимость, слабость, бессонница, галлюцинации.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, кожный зуд, многоформная экссудативная эритема, ангионевротический отек и анафилактическая реакция.

Местные реакции: возможен тромбофлебит в месте введения.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, цистит, полиурия, недержание мочи, кандидоз, окрашивание мочи в красно-коричневый цвет (вследствие содержания метаболита метронидазола, клинического значения не имеет).

Прочие: повышение температуры тела, снижение амплитуды зубца Т на ЭКГ.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, атаксия.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Специфического антидота нет. Метронидазол и его метаболиты хорошо элиминируются при гемодиализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Метронидазол противопоказан к применению в I триместре беременности. Назначение препарата в II и III триместрах беременности возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Противопоказано применение препарата в период лактации (грудного вскармливания). Метронидазол выделяется с грудным молоком. При необходимости применения препарата следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Метронидазол способен усиливать действие пероральных антикоагулянтов. Протромбиновое время может увеличиваться, поэтому необходима коррекция дозы пероральных антикоагулянтов.

Циметидин ингибирует метаболизм метронидазола, что может привести к повышению его концентрации в сыворотке крови и увеличению риска развития побочных реакций.

Индукторы ферментов микросомального окисления печени (например, фенитоин, фенобарбитал) способны ускорять элиминацию метронидазола, что приводит к снижению его концентрации в плазме крови.

Одновременное употребление алкоголя вызывает реакции, подобные реакциям на введение дисульфирама (схваткообразные боли в животе, тошнота, головная боль, гиперемия кожи). Не допустимо совместное применение с дисульфирамом (аддитивное действие, может вызывать спутанность сознания).

Во время лечения метронидазолом возможно повышение концентрации лития в крови, поэтому перед началом применения Клиона необходимо снизить дозу препаратов лития или прекратить их прием на время лечения.

Одновременное введение циклоспорина с метронидазолом может привести к увеличению концентрации циклоспорина в плазме, что требует контроля концентрации циклоспорина в плазме крови.

Метронидазол снижает клиренс фторурацила, в связи с чем увеличивается токсичность последнего.

При лабораторных исследованиях во время приема препарата возможны затруднения при определении активности печеночных трансаминаз, ЛДГ и содержания триглицеридов.

Одновременное введение препарата с другими растворами, содержащими соли натрия, может привести к задержке натрия в организме.

Особые указания и меры предосторожности:

В/в введение раствора Клиона показано больным, у которых пероральный прием препарата невозможен. При смешанных инфекциях раствор Клиона можно применять в комбинации с парентеральными антибиотиками, не смешивая препараты между собой.

При в/в капельном введении нельзя смешивать Клион с другими препаратами.

При длительности курса лечения более10 дней необходимо тщательное наблюдение за состоянием больного и регулярный контроль лабораторных показателей крови. Если необходим более длительный курс лечения из-за наличия хронических заболеваний, следует тщательно взвешивать соотношение между ожидаемой пользой и потенциальным риском возникновения осложнений.

При применении Клиона возможно обострение кандидоза.

Употребление спиртных напитков во время лечения Клионом строго запрещено.

При применении Клиона может наблюдаться незначительная лейкопения, поэтому целесообразно контролировать показатели общего анализа крови (количество лейкоцитов) в начале и в конце терапии.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При появлении побочных эффектов со стороны ЦНС следует воздержаться от управления автотранспортом и работы с потенциально опасными механизмами.

При нарушениях функции почек

Препарат с осторожностью назначают при почечной недостаточности. При выраженных нарушениях функции почек (КК менее 10 мл/мин) у пациентов может наблюдаться кумулирование метронидазола в сыворотке крови после повторного введения препарата. В этом случае дозу препарата необходимо уменьшить вдвое.

Метронидазол и его метаболиты хорошо выводятся при гемодиализе. Так как во время гемодиализа $T_{1/2}$ резко уменьшается (приблизительно до 3 ч), в некоторых случаях может быть необходимо дополнительное введение препарата.

При нарушениях функции печени

Препарат с осторожностью назначают при почечной недостаточности (противопоказано назначение препарата в больших дозах). При тяжелых заболеваниях печени метронидазол метаболизируется медленнее. Вследствие этого метронидазол и его метаболиты могут накапливаться в плазме крови. В этих случаях дозу и интервалы между введениями препарата устанавливают в зависимости от степени поражения печени.

Противопоказан при печеночной недостаточности (в случае назначения препарата в высоких дозах).

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов: фаркмакокинетика метронидазола может изменяться, поэтому может возникнуть необходимость контроля концентрации метронидазола в сыворотке крови.

Применение в детском возрасте

Данные по использованию раствора Клион у детей не предоставлены.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре от 15° до 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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