Лайкоцин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Порошок для приготовления раствора для в/в и в/м введения белого или почти белого цвета.

	1 фл.
капреомицина сульфат	1 г

Флаконы стеклянные вместимостью 10 мл (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Полипептидный антибиотик, продуцируемый Streptomyces capreolus (МПК - 1.25-2.5 мг/л при определении в жидкой среде). Ингибирует синтез белка в бактериальной клетке, оказывает бактериостатическое действие.

Активен в отношении Mycobacterium tuberculosis.

При монотерапии быстро вызывает появление резистентных штаммов, имеет полную перекрестную устойчивость с биомицином и частичную - с аминогликозидами.

Фармакокинетика

Всасывание

Практически не абсорбируется из ЖКТ (менее 1%). C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч после в/м введения в дозе 1 г и составляет 20-47 мг/л; через 10 ч концентрация составляет 4 мг/л. После в/в инфузии в течение 1 ч в дозе 1 г C_{max} составляет 30-50 мг/л. AUC при в/в и в/м введении одинакова.

Распределение и метаболизм

Не проникает через ГЭБ, проникает через плацентарный барьер.

Не метаболизируется.

Не кумулирует при нормальной функции почек.

Выведение

Выводится в основном почками (в течение 12 ч - 50-60% дозы) путем клубочковой фильтрации в неизмененном виде, в небольших количествах - с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При нарушении функции почек $T_{1/2}$ увеличивается.

Показания к применению:

— туберкулез легких, при неэффективности препаратов 1 ряда (изониазид, рифампин, аминосалициловая кислота и стрептомицин), токсическом действии или при устойчивых штаммах Mycobacterium tuberculosis.

Относится к болезням:

- Туберкулез

Противопоказания:

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— детский возраст;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Перед началом терапии следует провести анализ для подтверждения наличия чувствительного к капреомицину штамма Mycobacterium tuberculosis.

Капреомицин всегда назначают в сочетании хотя бы с еще одним противотуберкулезным препаратом, к которому чувствителен тот штамм Mycobacterium tuberculosis, который имеется у данного больного.

Средняя доза составляет 1 г/сут, не превышая 20 мг/кг/сут. Препарат вводят в/м или в/в в течение 60-120 дней, а затем - по 1 г любым из двух способов 2-3 раза в неделю.

Лечение туберкулеза следует продолжать в течение 12-24 мес. Если нет возможности вводить препараты парентерально, то при выписке пациента из больницы их следует заменить на препараты для приема внутрь.

Больным с нарушениями функции почек следует уменьшить дозу в соответствии с рекомендациями в таблице, приведенной ниже. При этих дозах достигается C_{ss} капреомицина 10 мг/л.

Расчет дозы препарата для достижения средней C_{ss} капреомицина в плазме крови10 мг/л, с учетом КК

КК (мл/мин)	**Клиренс капреомицина (л/кг/ч x 10^2)**	**Время полужизни**	**Доза (мг/кг) для следующих интервалов между введениями**		
			24 ч	**48 ч**	**72 ч**
0	0.54	55.5	1.29	2.58	3.87
10	1.01	29.4	2.43	4.87	7.3
20	1.49	20	3.58	7.16	10.7
30	1.97	15.1	4.72	9.45	14.2
40	2.45	12.2	5.87	11.7	
50	2.92	10.2	7.01	14	
60	3.4	8.8	8.16		
80	4.35	6.8	10.4		
100	5.31	5.6	12.7		
110	5.78	5.2	13.9		

Пациентам с нормальной функцией почек препарат вводят в средней дозе 1 г/сут, но не более 20 мг/кг/сут, в течение 60-120 дней, затем вводят по 1 г 2-3 раза в неделю.

Правила приготовления и введения растворов

Для в/м или в/в введения 1 г препарата (содержимое 1 флакона) растворяют в 2 мл 0.9% хлорида натрия д/и или

стерильной воды д/и. Для окончательного растворения содержимого флакона следует подождать 2-3 мин.

При в/в инфузии растворенный капреомицин следует развести в 100 мл 0.9% раствора хлорида натрия д/и и ввести в течение 60 мин.

При в/м инъекции растворенный капреомицин вводят глубоко в/м, поскольку поверхностная инъекция может вызвать повышенную болезненность и развитие асептических абсцессов.

Для введения дозы 1 г необходимо использовать все содержимое флакона. Для введения дозы менее 1 г рекомендуется пользоваться следующей таблицей разведений:

Количество растворителя, добавляемое во флакон емкостью 10 мл, содержащий дозу 1 г	Объем раствора капреомицина для инъекций	Концентрация* раствора (прибл.)
2.15 мл	2.85 мл	350 мг*/мл
2.63 мл	3.33 мл	300 мг*/мл
3.3 мл	4 мл	250 мг*/мл
4.3 мл	5 мл	200 мг*/мл

*Эквивалент активности капреомицина.

Раствор может приобрести бледно-соломенную окраску и со временем потемнеть, но это не сопровождается потерей активности или появлением токсичности. После разведения все растворы капреомицина для инъекций можно хранить в холодильнике не более 24 ч.

Побочное действие:

Со стороны мочевыделительной системы: нефротоксичность (олигурия, нарушение функции почек).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: нейротоксичность, нервно-мышечная блокада.

Со стороны органов чувств: ототоксичность, вестибулярные нарушения.

Аллергические реакции: крапивница, макуло-папулезная сыпь, гипертермия, эозинофилия.

Со стороны лабораторных показателей: тромбоцитопения, лейкопения, лейкоцитоз, повышение содержания мочевой кислоты (более 20 мг/100 мл), цилиндрурия, гематурия, лейкоцитурия.

Местные реакции: боль и уплотнение в месте инъекции, асептический абсцесс.

Прочие: кровоточивость.

Передозировка:

Симптомы: нефротоксический эффект, наблюдавшийся при парентеральном введении капреомицина для инъекций, связан с концентрацией препарата в сыворотке крови.

Для пациентов пожилого возраста, пациентов с нарушениями функции почек или обезвоживанием и пациентов, получающих другие нефротоксические препараты, риск развития острого некроза канальцев значительно выше.

Повреждение слухового и вестибулярного отделов VIII пары черепно-мозговых нервов происходит у пациентов с нарушением функции почек или обезвоживанием, а также при лечении препаратами, оказывающими ототоксическое действие. Часто такие больные испытывают головокружение и шум в ушах.

После быстрого в/в введения возможны нервно-мышечная блокада или дыхательный паралич.

При развитии токсического действия капреомицина наблюдались гипокалиемия, гипокальциемия, гипомагниемия и нарушения электролитного баланса, напоминающие синдром Бартера.

Лечение: мероприятия, направленные на поддержание дыхания, кровообращения, а также тщательный контроль концентрации газов крови, электролитов сыворотки.

Для выведения капреомицина у пациентов с тяжелыми заболеваниями почек можно применять гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Частичная нервно-мышечная блокада, которая наблюдалась при в/в введении Лайкоцина в высоких дозах, усиливалась при проведении наркоза с применением эфира (как это было показано для неомицина) и ослаблялась неостигмином.

Другие противотуберкулезные средства (стрептомицин, виомицин) оказывают аналогичное и иногда необратимое токсическое действие, в особенности на VIII пару черепно-мозговых нервов и функцию почек (одновременное назначение с Лайкоцином не рекомендуется). Применять Лайкоцин с полимиксином-А сульфатом, колистина сульфатом, амикацином, гентамицином, тобрамицином, ванкомицином, канамицином и неомицином, которые могут оказывать ототоксическое и нефротоксическое действие, следует с большой осторожностью.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью следует применять Лайкоцин у пациентов с почечной недостаточностью и уже имеющимися нарушениями слуха. При необходимости назначения препарата в таких случаях следует сопоставить соотношение ожидаемой пользы терапии и риска дополнительного нарушения функции VIII пары черепно-мозговых нервов и повреждения почек.

С осторожностью назначать Лайкоцин (как и другие антибиотики) пациентам с какими-либо формами аллергии, в особенности лекарственной.

До начала лечения Лайкоцином и регулярно в процессе лечения следует проводить аудиометрию и оценку вестибулярной функции, контролировать функцию почек (еженедельно).

Повреждение почек, которое может наблюдаться на фоне применения Лайкоцина, сопровождается некрозом канальцев, повышением уровня азота мочевины в крови или сывороточного креатинина, появлением патологического осадка в моче. Незначительное повышение азота мочевины и сывороточного креатинина наблюдалось у большой части больных, получавших длительную терапию. У многих из них отмечалось появление в моче цилиндров, эритроцитов и лейкоцитов. При повышении уровня азота мочевины более чем 30 мг/100 мл, а также при любых других признаках снижения почечной функции с повышением уровня азота мочевины или без него, а также при подозрении на нарушение функции почек требуется тщательное обследование пациента, снижение дозы или полная отмена препарата. Клинически значимое появление патологического мочевого осадка и повышение уровня азота мочевины в крови (или сывороточного креатинина) под действием Лайкоцина для инъекций не выявлено.

При в/в введении Лайкоцина в высоких дозах наблюдалась частичная нервно-мышечная блокада.

Поскольку во время лечения может развиться гипокалиемия, следует проводить частые определения содержания калия в сыворотке.

При нарушениях функции почек

Больным с нарушениями функции почек следует уменьшить дозу в соответствии с рекомендациями в таблице, приведенной ниже. При этих дозах достигается C_{ss} капреомицина 10 мг/л.

Расчет дозы препарата для достижения средней C_{ss} капреомицина в плазме крови10 мг/л, с учетом КК

КК (мл/мин)	**Клиренс капреомицина (л/кг/ч x 10^2)**	**Время полужизни**	**Доза (мг/кг) для следующих интервалов между введениями**		
			24 ч	**48 ч**	**72 ч**
0	0.54	55.5	1.29	2.58	3.87
10	1.01	29.4	2.43	4.87	7.3
20	1.49	20	3.58	7.16	10.7
30	1.97	15.1	4.72	9.45	14.2
40	2.45	12.2	5.87	11.7	
50	2.92	10.2	7.01	14	
60	3.4	8.8	8.16		
80	4.35	6.8	10.4		
100	5.31	5.6	12.7		

110	5.78	5.2	13.9		

Пациентам с нормальной функцией почек препарат вводят в средней дозе 1 г/сут, но не более 20 мг/кг/сут, в течение 60-120 дней, затем вводят по 1 г 2-3 раза в неделю.

Повреждение почек, которое может наблюдаться на фоне применения Лайкоцина, сопровождается некрозом канальцев, повышением уровня азота мочевины в крови или сывороточного креатинина, появлением патологического осадка в моче.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности – 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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