

Майзер



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Циклосерин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы	1 капс.
Циклосерин	250 мг

10 шт. - упаковки безъячейковые контурные (10) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки безъячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки безъячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противотуберкулезный препарат. Циклосерин - это бактерицидный антибиотик широкого спектра действия. Циклосерин ингибирует синтез клеточной оболочки чувствительных штаммов грамположительных и грамотрицательных бактерий и *Mycobacterium tuberculosis*. *Активен в отношении* грамотрицательных микроорганизмов, в концентрации 10-100 мг/л - *Rickettsia spp.*, *Treponema spp.*, минимальная подавляющая концентрация по отношению к *Mycobacterium tuberculosis* составляет 3-25 мг/л на жидкой и 10-20 мг/л и более - на плотной питательной среде. Лекарственная устойчивость возникает медленно.

Фармакокинетика

Циклосерин быстро всасывается из ЖКТ после приема внутрь, создавая обнаруживаемые уровни концентрации препарата в плазме в течение одного часа, абсорбция 70-90%. Практически не связывается с белками плазмы. Время достижения C_{max} в крови 3-4 ч; пропорционально принятой дозе 0.25, 0.5 и 1.0 г C_{max} составляет 6.24 и 30 мкг/л, соответственно. После приема 250 мг каждые 12 ч C_{max} 25-30 мкг/мл. Он свободно распределяется по жидкостям и тканям тела.

Циклосерин проникает через гематоэнцефалический барьер, уровни в цереброспинальной жидкости примерно такие же, как и в плазме. У больных туберкулезом Циклосерин обнаруживается в мокроте, а также в плевральной и лецитической жидкостях, в желчи, амниотической жидкости и в крови плода, в грудном молоке, тканях легких и в лимфоидной ткани.

Циклосерин выводится с мочой, в которой он обнаруживается через 30 мин после приема дозы. Около 66% дозы обнаруживается в неизменном виде в моче в течение 24 ч. Другие 10% выводятся в течение следующих 48 ч. С калом выводятся незначительные количества. Около 35% метаболизируется, но метаболиты до настоящего времени не идентифицированы. $T_{1/2}$ циклосерина колеблется в пределах 8-12 часов.

Циклосерин проходит через плаценту. В брюшной и плевральной полости содержится 50-100% от концентрации препарата в сыворотке крови. При хронической почечной недостаточности через 2-3 дня могут возникнуть явления кумуляции.

Показания к применению:

- лечение туберкулеза легких в активной форме;
- лечение внелегочного туберкулеза (включая заболевания почек) при условии чувствительности микроорганизмов к этому препарату и после неудачного адекватного лечения основными лекарственными препаратами (стрептомицином, изониазидом, рифампицином и этамбутолом);
- Подобно всем противотуберкулезным препаратам циклосерин следует использовать в сочетании с другими химиотерапевтическими средствами, а не как монотерапию.
- применяется также при атипичных бактериальных инфекциях (в т.ч. вызванных *Mycobacterium avium*);
- может быть эффективным для лечения острых инфекций мочевыводительных путей, вызванных чувствительными штаммами грамположительных и грамотрицательных бактерий, в особенности видами *Klebsiella/Enterobacter* и *Escherichia coli*;
- лечение инфекций мочевыводящих путей, вызываемых бактериями, за исключением микобактерий.

Применять Циклосерин для лечения этих инфекций следует только после того, как исчерпаны все обычные средства лечения и когда определена чувствительность микроорганизмов к данному лекарственному препарату.

Относится к болезням:

- [Инфекции](#)
- [Инфекции мочевыводящих путей](#)
- [Туберкулез](#)

Противопоказания:

- органические заболевания ЦНС;
- эпилепсия, эпилептические припадки (в т.ч. в анамнезе);
- депрессия;
- выраженные состояния возбуждения или психозы;
- сердечная недостаточность;
- тяжелая почечная недостаточность;
- злоупотребление алкоголем (в т.ч. в анамнезе);
- беременность;
- период лактации;
- повышенная чувствительность к циклосерину.

С *осторожностью* назначать Циклосерин в детском возрасте.

Способ применения и дозы:

Циклосерин применяется внутрь, непосредственно перед приемом пищи (при раздражении слизистой оболочки ЖКТ - после еды).

Взрослые. Обычная доза составляет от 500 мг до 1 г/сут. Начальная доза для **взрослых** чаще всего составляет 250 мг 2 раза /сут с 12-ти ч интервалом в течение первых двух недель. Периодически (после нескольких приемов, контролируется уровня препарата в крови). Суточная доза не должна превышать 1 г.

Дети. Обычная начальная доза составляет от 10 мг/кг массы тела/сут, после чего она изменяется в зависимости от уровня препарата в крови и терапевтического эффекта. Суточная доза для **детей** - 0.01-0.02 г/кг массы тела (не выше 0.75 г/сут.).

Пожилые. Назначается также как и **взрослым**, но дозу уменьшают в случае **нарушенной функции почек**.
Пациентам старше 60 лет, а также с массой тела менее 50 кг - по 0.25 г 2 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: связаны с высокими дозами препарата, т.е. более 500 мг в сутки: судороги, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения, споровозное состояние, головная боль, тремор, дизартрия, головокружение, спутанность сознания и нарушение ориентации, сопровождавшееся потерей памяти, тревожность, периферический неврит, психозы, возможно с попытками самоубийства, изменения характера, эйфория, депрессия, повышенная раздражительность, агрессивность, парез, гиперрефлексия, парестезия, большие и малые приступы клонических судорог и кома.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, изжога, диарея.

Прочие: лихорадка, усиление кашля.

К другим установленным побочным эффектам относятся: аллергические реакции, зуд, мегалобластная анемия и увеличение аминотрансфераз в сыворотке, в особенности у пожилых больных с ранее существовавшими заболеваниями печени. Возможно внезапное развитие застойной сердечной недостаточности у больных, принимавших от 1 до 1.5 г циклосерина/сут.

Передозировка:

Симптомы: острое отравление может наблюдаться, если взрослый больной принял внутрь более 1 г. Явления передозировки могут наблюдаться при концентрации циклосерина в плазме крови 25-30 мг/мл (прием высоких доз, если ежедневно в организм вводится более 500 мг циклосерина, нарушение клиренса креатинина). Обычно токсические эффекты встречаются со стороны ЦНС. Они могут включать головную боль, головокружение, полубессознательное состояние, спутанность сознания, повышенную раздражимость, парестезию, дизартрию и психозы. При употреблении высоких доз может наблюдаться парез, судороги и кома. Этанол может увеличивать опасность развития эпилептических припадков.

Лечение: рекомендуется проведение симптоматического и поддерживающего лечения. Противосудорожные средства. Для профилактики нейротоксических эффектов противосудорожные и седативные средства. Активированный уголь может быть более эффективным для уменьшения всасывания препарата, нежели вызывание рвоты и промывание желудка. У взрослых нейротоксические эффекты могут лечиться и предупреждаться в результате введения 200-300 мг пиридоксина/сут. Проведение гемодиализа выводит Циклосерин из крови, но не исключает развития отравления угрожающего жизни.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не установлено вызывает ли циклосерин повреждение плода при введении беременным женщинам или оказывает ли он влияние на репродуктивную способность. Циклосерин следует назначать беременным женщинам только в случаях крайней необходимости.

Концентрации в материнском молоке приближаются к концентрациям, обнаруживаемым в сыворотке крови матери. Решение об отмене кормления грудью или прекращения лечения препаратом необходимо принимать с учетом значения лечения препаратом для матери.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Циклосерин увеличивает скорость выведения пиридоксина почками (может вызывать развитие анемии и периферического неврита, требуется увеличение дозы пиридоксина).

Одновременное введение этионамида потенцирует нейротоксические побочные эффекты.

Алкоголь и циклосерин несовместимы, в особенности при лечении высокими дозами циклосерина. Алкоголь увеличивает возможность и опасность эпилептических припадков.

Больные, получающие циклосерин и изониазид, должны находиться под контролем, поскольку эти препараты оказывают комбинированное токсическое действие на ЦНС. Может потребоваться корректировка дозы.

Этионамид повышает риск возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно судорожного синдрома.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение циклосерином необходимо отменить или следует уменьшить дозу, если у больного развиваются аллергические дерматиты или симптомы интоксикации центральной нервной системы, например, судороги, психозы, сонливость, угнетение, спутанность сознания, гиперрефлексия, головная боль, тремор, головокружение, парез или диаррея.

Нейротоксический эффект обычно наблюдается при уровнях препарата в крови более 30 мг/мл (что может быть результатом передозировки или нарушенного клиренса креатинина). Опасность развития судорожного синдрома увеличивается у больных хроническим алкоголизмом. При приеме препарата следует контролировать гематологические показатели, выделительную функцию почек, уровень препарата в крови и состояние функции печени.

Перед началом лечения циклосерином необходимо выделить культуры микроорганизмов и определить чувствительность штаммов к данному препарату. В случае туберкулезной инфекции необходимо определить чувствительность штамма к другим противотуберкулезным препаратам.

При лечении пациентов со сниженной функцией почек, принимающих суточную дозу более 500 мг и у которых предположительно обнаруживаются признаки и симптомы отравления, уровень препарата в крови необходимо контролировать, по крайней мере, один раз в неделю. Дозу необходимо корректировать таким образом, чтобы поддерживать уровень препарата в крови ниже 30 мг/мл.

Противосудорожные или седативные препараты могут быть эффективными для профилактики нейротоксических реакций.

Больные, получающие более 500 мг циклосерина в сутки, должны находиться под непосредственным наблюдением из-за возможного развития подобных симптомов. Значение пиридоксина в предупреждении нейротоксических реакций не установлено.

В редких случаях применение циклосерина и других противотуберкулезных препаратов может вызвать развитие недостаточности витамина В₁₂ и/или фолиевой кислоты, мегалобластной и сидеробластной анемий. В случае возникновения анемии во время лечения необходимо провести соответствующее обследование и лечение больного. Предупредить или уменьшить токсическое действие циклосерина можно, назначая в период лечения глутаминовую кислоту по 0.5 г 3-4 раза/сут (до еды), и ежедневным в/м введением натриевой соли АТФ (1 мл 1% раствора), пиридоксина 200-300 мг/сут.

Следует ограничить психическое напряжение больных и исключить возможные факторы перегрева (пребывание на солнце с непокрытой головой, горячий душ).

В связи с быстрым развитием устойчивости при монотерапии циклосерином, рекомендуется его сочетание с другими противотуберкулезными препаратами.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не установлено.

При нарушениях функции почек

Противопоказан:

— тяжелая почечная недостаточность.

При лечении пациентов со сниженной функцией почек, принимающих суточную дозу более 500 мг и у которых предположительно обнаруживаются признаки и симптомы отравления, уровень препарата в крови необходимо контролировать, по крайней мере, один раз в неделю. Дозу необходимо корректировать таким образом, чтобы поддерживать уровень препарата в крови ниже 30 мг/мл.

Применение в пожилом возрасте

Назначается также как и взрослым, но дозу уменьшают в случае нарушенной функции почек. **Пациентам старше 60 лет, а также с массой тела менее 50 кг** - по 0.25 г 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

С осторожностью назначается в детском возрасте.

Обычная начальная доза составляет от 10 мг/кг массы тела/сут, после чего она изменяется в зависимости от уровня препарата в крови и терапевтического эффекта. Суточная доза для **детей** - 0.01-0.02 г/кг массы тела (не выше 0.75 г/сут.).

Условия хранения:

Хранить препарат в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Не использовать позже даты, указанной на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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