Метронидазол



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

Форма выпуска:

Раствор для инфузий прозрачный, слабо-желтого цвета с зеленоватым оттенком.

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

Вспомогательные вещества: натрия хлорид 900 мг, натрия дигидрофосфата дигидрат (натрий фосфорнокислый однозамещенный 2-водный) 300 мг, вода д/и (до 100 мл).

100 мл - флаконы полиэтиленовые (1) - пакеты полиэтиленовые.

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 внутриклеточных транспортных белков анаэробных микроорганизмов и простейших. Восстановленная 5-нитрогруппа взаимодействует с ДНК клетки микроорганизмов, ингибируя синтез их нуклеиновых кислот, что ведет к гибели бактерий.

Активен в отношении Trichomonas vaginalis, Entamoeba histolytica, а также облигатных анаэробов Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides vulgatus), Fusobacterium spp., некоторых грамположительных микроорганизмов (Eubacterium spp., Clostridium spp., Peptococcus niger, Peptostreptococcus spp.).

Минимальная подавляющая концентрация 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 синергически с антибиотиками, эффективными против обычных аэробов.

Увеличивает чувствительность опухолей к облучению, вызывает сенсибилизацию к алкоголю (дисульфирамоподобное действие).

Фармакокинетика

Обладает высокой проникающей способностью, достигая бактерицидных концентраций в большинстве тканей и жидкостей организма, включая легкие, почки, печень, кожу, спинномозговую жидкость, мозг, желчь, слюну, амниотическую жидкость, полости абсцессов, вагинальный секрет, семенную жидкость, грудное молоко, проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер.

V_d: взрослые - примерно 0.55 л/кг, новорожденные – 0.54-0.81 л/кг. Связь с белками плазмы - 10-20%.

При в/в введении 500 мг в течение 20 мин C_{max} в сыворотке крови через 1 ч - 35.2 мкг/мл. Концентрация препарата в крови через 4ч - 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.

В организме метаболизируется около 30-60% метронидазола путем гидроксилирования. окисления и глюкуронирования. Основной метаболит (2-оксиметронидазол) также оказывает противопротозойное и противомикробное действие.

$T_{1/2}$ при нормальной функции печени - 8ч (от 6 до 12 ч), при алкогольном поражении печени - 18 ч (от 10 до 29 ч), у новорожденных, родившихся при сроке беременности 28-30 недель - примерно 75 ч, 32-35 недель - 35 ч, 36-40 недель - 25 ч. Выводится почками 60-80% (20% в неизмененном виде), через кишечник - 6-15%о. При выраженных нарушениях функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) у пациентов после повторного введения может наблюдаться кумулирование метронидазола в сыворотке крови, в связи с чем дозу препарата следует 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, включая амебный абсцесс печени;

— кишечный амебиаз (амебная дизентерия);

— трихомониаз;

— трихомонадный вагинит;

— трихомонадный уретрит;

— инфекции, вызываемые Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides vulgatus);

— инфекции костей и суставов;

— инфекции ЦНС, в т.ч. менингит;

— абсцесс мозга;

— бактериальный эндокардит;

— пневмония;

— эмпиема;

— абсцесс легких;

— сепсис;

— инфекции, вызываемые видами Clostridium spp., Peptococcus niger и Peptostreptococcus spp.;

— инфекции брюшной полости (перитонит, абсцесс печени);

— инфекции органов малого таза (эндометрит, абсцесс фаллопиевых труб и яичников, инфекции свода влагалища);

— псевдомембранозный колит (связанный с применением антибиотиков);

— гастрит или язва двенадцатиперстной кишки, связанные с Helicobacter pylori;

— профилактика послеоперационных осложнений (особенно вмешательства на ободочной кишке, параректальной области, аппендэктомия, гинекологические операции);

— лучевая терапия больных с опухолями - в качестве радиосенсибилизирующего лекарственного средства, в случаях, когда резистентность опухоли обусловлена гипоксией в клетках опухоли.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Абсцесс печени
- Амебиаз
- Амебная дизентерия
- Вагинит
- Гастрит
- Дизентерия
- Инфекции
- Колит
- Менингит
- Опухоли
- Перитонит
- Пневмония
- Сепсис
- Трихомониаз
- Уретрит
- Эмпиема
- Эндокардит
- Эндометрит
- Язва
- Язва двенадцатиперстной кишки

Противопоказания:

— лейкопения (в т.ч. в анамнезе);

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

— печеночная недостаточность (в случае назначения больших доз);

— беременность (I триместр);

— период лактации;

— повышенная чувствительность.

С *осторожностью*

Беременность (II и III триместры) только по жизненным показаниям, почечная/печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы:

В/в введение метронидазола показано при тяжелом течении инфекций, а также при отсутствии возможности приема препарата внутрь.

Для **взрослых и детей старше 12 лет** разовая доза составляет 500 мг, скорость в/в непрерывного (струйного) или капельного введения - 5 мл/мин. Интервал между введениями - 8 ч. Длительность курса лечения определяется индивидуально. Максимальная суточная доза - не более 4 г. По показаниям, в зависимости от характера инфекции, осуществляют переход на поддерживающую терапию пероральными формами метронидазола.

Детям в возрасте до 12 лет метронидазол вводят 7.5 мг/кг массы тела в 3 приема со скоростью 5 мл/мин.

Для *профилактики анаэробной инфекции перед плановой операцией на органах малого газа и мочевыводящих путях* **взрослым и детям старше 12 лет** метронидазол назначают в виде инфузий в дозе 500-1000 мг, в день операции и на следующий день - в дозе 1500 мг/сут (по 500 мг каждые 8 ч). Через 1-2 дня обычно переходят на поддерживающую терапию пероральными формами метронидазола.

Для **пациентов с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) и/или печени** максимальная суточная доза метронидазола составляет 1000 мг (кратность приема 2 раза/сут).

В *качестве радиосенсибилизирующего лекарственного средства*вводят в/в капельно, из расчета 160 мг/кг или 4-6 г/кв.м поверхности тела за 0.5-1 ч до начала облучения. Применяют перед каждым сеансом облучения в течение 1-2 нед. В оставшийся период лучевого лечения метронидазол не применяют. Максимальная разовая доза не должна превышать 10 г. курсовая - 60 г. Для снятия интоксикации, вызванной облучением, применяют капельное введение 5% раствора декстрозы, гемодеза или 0.9% раствора натрия хлорида.

При *раке шейки матки и тела матки, раке кожи* используют в виде местных аппликаций (3 г растворяют в 10% растворе диметилсульфоксиде, смачивают тампоны, которые применяют местно. за 1.5-2 ч до облучения). При плохой регрессии опухоли аппликации проводят в течение всего курса лучевой терапии. При положительной динамике очищения опухоли от некроза - в течение первых 2 недель лечения.

Метронидазол для в/в вливаний не рекомендуется смешивать с другими лекарственными препаратами!

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, потеря аппетита, кишечная колика, диарея, запор, обложенность языка, горький, металлический привкус во рту, стоматит, сухость во рту, глоссит, панкреатит.

Со стороны кроветворной системы: обратимая нейтропения (лейкопения).

Со стороны ЦНС: периферическая невропатия (чувство онемения конечностей), головные боли, судороги, сонливость, головокружение, нарушение координации движений, атаксия, спутанность сознания, депрессия, повышенная возбудимость, слабость, бессонница, галлюцинации, раздражительность.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, кожный зуд, многоформная экссудативная эритема, ангионевротический отек и анафилактическая реакция, гиперемия кожи, заложенность носа, лихорадка, артралгия.

Местные реакции: в месте введения возможен тромбофлебит (боль, гиперемия или отечность в месте инъекции).

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

Со стороны мочеполовой системы: дизурия, цистит, полиурия. недержание мочи, кандидоз слизистой оболочки влагалища, окрашивание мочи в красно-коричневый цвет (вызывает метаболит метронидазола, не имеет клинического значения).

Прочие: повышение температуры тела, уплощение зубца Т на ЭКГ.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, атаксия; при приеме в качестве радиосенсибилизирующего средства - судороги, периферическая невропатия.

Лечение: специфический антидот отсутствует, симптоматическая и поддерживающая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан в I триместре беременности и в период лактации. При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Беременность (II и III триместры) только по жизненным показаниям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиливает действие непрямых антикоагулянтов, что ведет к увеличению протромбинового времени.

Аналогично дисульфираму вызывает непереносимость этанола.

Одновременное применение метронидазола с дисульфирамом может привести к развитию различных неврологических симптомов (интервал между назначением - не менее 2 нед).

Метронидазол для в/в введения не рекомендуется смешивать с другими лекарственными средствами.

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

Одновременное назначение лекарственных средств, стимулирующих ферменты микросомального окисления в печени (фенобарбитал, фенитоин), может ускорять элиминацию метронидазола. в результате чего понижается его концентрация в плазме.

При одновременном приеме с препаратами лития может повышаться концентрация поледнего в плазме и развитие симптомов интоксикации.

Не рекомендуется сочетать с недеполяризующими миорелаксантами (векурония бромид).

Сульфаниламиды усиливают противомикробное действие метронидазола.

Особые указания и меры предосторожности:

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

При в/в капельном введении нельзя смешивать с другими препаратами. При применении препарата может наблюдаться обострение кандидоза.

Употребление спиртных напитков во время курса терапии строго запрещено.

При применении препарата может наблюдаться незначительная лейкопения, поэтому целесообразно контролировать картину крови (количество лейкоцитов) в начале и в конце терапии.

В комбинации с амоксициллином не рекомендуется применять у пациентов моложе 18 лет.

При лейкопении возможность продолжения лечения зависит от риска развития инфекционного процесса.

Появление атаксии, головокружения и любое другое ухудшение неврологического статуса больных требует прекращения лечения.

Может иммобилизовать трепонемы и приводить к ложноположительному тесту Нельсона. При лечении трихомонадного вагинита у женщин и трихомонадного уретрита у мужчин необходимо воздерживаться от половой жизни. Обязательно одновременное лечение половых партнеров. После терапии трихомониаза следует провести контрольные пробы в течение 3 очередных циклов до и после менструации.

При проведении терапии более чем 10 дней - только в обоснованных случаях, при строгом наблюдении за больным и регулярным контролем лабораторных показателей крови. Если необходим более длительный курс терапии из-за наличия хронических заболеваний, следует тщательно взвешивать соотношение между ожидаемым эффектом и потенциальным риском возникновения осложнений.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

Для **пациентов с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 30 мл/мин)** максимальная суточная доза метронидазола составляет 1000 мг (кратность приема 2 раза/сут).

При нарушениях функции печени

Для **пациентов с выраженными нарушениями функции печени** максимальная суточная доза метронидазола составляет 1000 мг (кратность приема 2 раза/сут).

Применение в детском возрасте

Детям в возрасте до 12 лет метронидазол вводят 7.5 мг/кг массы тела в 3 приема со скоростью 5 мл/мин.

Условия хранения:

Список Б. Хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре от 0 до 30°С. Не замораживать.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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