Метронидазол-АКОС (раствор)



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 0.5% прозрачный, с зеленоватым оттенком.

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

Вспомогательные вещества: динатриевая соль этилендиаминтетрауксусной кислоты, вода д/и.

100 мл - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопротозойный и противомикробный препарат, производное 5-нитроимидазола. Механизм действия заключается в биохимическом восстановлении 5-нитрогруппы внутриклеточными транспортными протеинами анаэробных микроорганизмов и простейших. Восстановленная 5-нитрогруппа взаимодействует с ДНК клетки микроорганизмов, ингибируя синтез их нуклеиновых кислот, что ведет к гибели бактерий.

Препарат *активен в отношении:* Trichomonas vaginalis, Entamoeba histolytica, Gardnerella vaginalis, Giardia intestinalis, Lamblia spp.; *анаэробных бактерий:* Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides vulgatus), Fusobacterium spp., Veillonella spp., Prevotella spp. (Prevotella bivia, Prevotella buccae, Prevotella disiens), 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 препарату *устойчивы* аэробные микроорганизмы и факультативные анаэробы, но в присутствии смешанной флоры (аэробы и анаэробы) метронидазол действует синергически с антибиотиками, эффективными против аэробов.

Препарат увеличивает чувствительность опухолей к облучению, оказывает дисульфирамоподобное действие, стимулирует репаративные процессы.

Фармакокинетика

Всасывание

После в/в введения в дозе 500 мг в течение 20 мин C_{max} в сыворотке крови через 1 ч составляет 35.2 мкг/мл, через 4 ч – 33.9 мкг/мл, через 8 ч – 25.7 мкг/мл; C_{min} при последующем введении – 18 мкг/мл.

При в/в введении C_{max} достигается через 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.

Распределение

Связывание с белками плазмы – 10-20%. V_d у взрослых – 0.55 л/кг, у новорожденных – 0.54-0.81 л/кг.

Метронидазол обладает высокой проникающей способностью. Достигает бактерицидных концентраций в легких, почках, печени, мозге, коже, спинномозговой жидкости, желчи, слюне, амниотической жидкости, полости абсцессов, вагинальном секрете, семенной жидкости, грудном молоке. Проникает через ГЭБ, проходит через плацентарный барьер.

Метаболизм

Метаболизируется (около 30-60%) путем гидроксилирования, окисления и глюкуронирования. Основной метаболит – 2 оксиметронидазол – оказывает противопротозойное и противомикробное действие.

Выведение

Выводится почками (60-80%), 20% - в неизмененном виде; через кишечник выводится 6-15%. $T_{1/2}$ - 8 ч (6-12 ч). Почечный клиренс – 10.2 мл/мин.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При алкогольном поражении печени $T_{1/2}$ составляет 18 ч (10-29 ч), у новорожденных, родившихся при сроке беременности 28-30 недель – 75 ч, при сроке 32-35 недель – 35 ч, при сроке 36-40 недель – 25 ч.

У больных с нарушением функции почек после повторного введения может наблюдаться кумуляция метронидазола в сыворотке крови.

Показания к применению:

—протозойные инфекции (внекишечный амебиаз /в т.ч. абсцесс печени/, кишечный амебиаз, трихомониаз, балантидиаз, лямблиоз (жиардиаз), кожный лейшманиоз, 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 и абсцесс легких);

—инфекции, вызываемые Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis), Clostridium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp. (инфекции брюшной полости /перитонит, абсцесс печени/, инфекции органов малого таза /эндометрит, эндомиометрит, абсцесс фаллопиевых труб и яичников, инфекции свода влагалища после хирургических вмешательств/, инфекции кожи и мягких тканей);

—сепсис, вызываемый Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis) и Clostridium spp.;

—псевдомембранозный колит (связанный с применением антибиотиков);

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

—алкоголизм;

—в качестве радиосенсибилизирующего средства при лучевой терапии (в случаях, когда резистентность опухоли обусловлена гипоксией в клетках опухоли);

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

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Абсцесс печени
- Алкоголизм

- Амебиаз
- Баланит
- Балантидиаз
- Вагинит
- Гастрит
- Инфекции
- Колит
- Лейшманиоз
- Менингит
- Опухоли
- Пневмония
- Сепсис
- Трихомониаз
- Уретрит
- Эмпиема
- Эндокардит
- Эндомиометрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки

Противопоказания:

—лейкопения (в т.ч. в анамнезе);

—органические поражения ЦНС;

—эпилепсия;

—печеночная недостаточность (при применении препарата в высоких дозах);

—беременность (I триместр);

—лактация (грудное вскармливание);

—повышенная чувствительность к препарату.

Способ применения и дозы:

В/в капельно **взрослым и детям старше 12 лет** препарат назначают в начальной дозе 0.5-1 г (длительность инфузии 30-40 мин). Затем каждые 8 ч по 500 мг со скоростью 5 мл/мин. При хорошей переносимости после первых 2-3 инфузий переходят на струйное введение. Курс лечения – 7 дней. При необходимости в/в введение продолжают в течение более длительного времени. Максимальная суточная доза – 4 г. По показаниям переходят на поддерживающий прием внутрь в дозе по 400 мг 3 раза/сут.

Детям в возрасте до 12 лет назначают по той же схеме в разовой дозе 7.5 мг/кг.

При *гнойно-септических заболеваниях* обычно проводят 1 курс лечения.

В *профилактических целях* **взрослым и детям старше 12 лет** назначают капельно по 0.5-1 г накануне операции, в день операции и на следующий день – 1.5 г/сут (по 500 мг каждые 8 ч). Через 1-2 дня переходят на поддерживающую терапию внутрь.

Для **пациентов с хронической почечной недостаточностью (при КК менее 30 мл/мин)** максимальная суточная доза составляет 1 г.

В *качестве радиосенсибилизирующего средства* препарат вводят в/в капельно, из расчета 160 мг/кг или 4-6 г/м^2 поверхности тела за 0.5-1 ч до начала облучения. Применяют перед каждым сеансом облучения в течение 1-2 недель. В оставшийся период радиотерапии метронидазол не применяют. Максимальная разовая доза – 10 г, курсовая – 60 г.

Для снятия интоксикации, вызванной облучением, применяют капельное введение растворов глюкозы, гемодеза или изотонического раствора натрия хлорида.

При *раке шейки матки и тела матки, раке кожи* препарат используют в виде местных аппликаций (3 г растворяют в 10% растворе диметилсульфоксида), 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.

Побочное действие:

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

Со стороны нервной системы: головокружение, нарушение координации движений, атаксия, спутанность сознания, раздражительность, депрессия, повышенная возбудимость, слабость, бессонница, головная боль, судороги, галлюцинации, периферическая невропатия.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, цистит, полиурия, недержание мочи, окрашивание мочи в красно-коричневый цвет.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, гиперемия кожи, заложенность носа, лихорадка, артралгия.

Местные реакции: при в/в введении – тромбофлебит (боль, покраснение, отечность).

Прочие: кандидоз, нейтропения, лейкопения, уплощение зубца Т на ЭКГ.

Передозировка:

Данные по передозировке препарата отсутствуют.

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

С осторожностью следует назначать препарат во II и III триместрах беременности.

Препарат противопоказан к применению в I триместре беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении метронидазола с непрямыми антикоагулянтами отмечается увеличение времени образования протромбина.

При одновременном применении Метронидазола-АКОС с препаратами солей лития возможно повышение концентрации лития в плазме крови и развитие симптомов интоксикации.

При одновременном применении с циметидином отмечается ингибирование метаболизма метронидазола, что может приводить к повышению концентрации метронидазола в плазме крови и увеличению риска развития побочных реакций.

При одновременном применении с метронидазолом препаратов, стимулирующих ферменты микросомального окисления в печени (фенитоин, фенобарбитал), может ускоряться выведение метронидазола, в результате чего снижается его концентрация в плазме крови.

Сульфаниламиды усиливают противомикробное действие метронидазола.

При одновременном применении с этанолом отмечается развитие дисульфирамоподобных реакций.

Фармацевтическое взаимодействие

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

Особые указания и меры предосторожности:

Следует учитывать, что в период применения препарата противопоказан прием этанола, т.к. возможно развитие дисульфирамоподобной реакции (спастические боли в животе, тошнота, рвота, головная боль, внезапный прилив крови к лицу).

При длительной терапии следует контролировать картину крови.

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

При развитии неврологических симптомов следует прекратить применение препарата.

При лечении трихомонадного вагинита у женщин и трихомонадного уретрита у мужчин необходимо воздерживаться от половой жизни. Одновременное лечение половых партнеров обязательно. Во время менструации следует продолжать лечение. После окончания лечения трихомониаза следует провести контрольные исследования в течение 3 очередных циклов до и после менструации.

После окончания лечения лямблиоза (если сохраняются симптомы) через 3-4 недели следует провести 3 анализа кала с интервалами в несколько дней (у некоторых успешно леченных больных непереносимость лактозы, вызванная инвазией, может сохраняться в течение нескольких недель или месяцев, напоминая симптомы лямблиоза).

Препарат может иммобилизовать трепонемы и приводить к ложноположительному тесту Нельсона.

Не рекомендуется сочетать с недеполяризующими миорелаксантами (например, векурония бромидом).

Использование в педиатрии

Не рекомендуется применять препарат в комбинации с амоксициллином у пациентов **моложе 18 лет**.

При нарушениях функции почек

Для **пациентов с хронической почечной недостаточностью (при КК менее 30 мл/мин)** максимальная суточная доза составляет 1 г.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности (при применении препарата в высоких дозах);

Применение в детском возрасте

В/в капельно **детям старше 12 лет** препарат назначают в начальной дозе 0.5-1 г (длительность инфузии 30-40 мин). Затем каждые 8 ч по 500 мг со скоростью 5 мл/мин. При хорошей переносимости после первых 2-3 инфузий переходят на струйное введение. Курс лечения – 7 дней. При необходимости в/в введение продолжают в течение более длительного времени. Максимальная суточная доза – 4 г. По показаниям переходят на поддерживающий прием внутрь в дозе по 400 мг 3 раза/сут.

Детям в возрасте до 12 лет назначают по той же схеме в разовой дозе 7.5 мг/кг.

В *профилактических целях* **детям старше 12 лет** назначают капельно по 0.5-1 г накануне операции, в день операции и на следующий день – 1.5 г/сут (по 500 мг каждые 8 ч). Через 1-2 дня переходят на поддерживающую терапию внутрь.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С. Срок годности – 2 года.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

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