Микозорал



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кетоконазол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или белого с кремоватым или сероватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской; допускается наличие мраморности.

	1 таб.
кетоконазол	200 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 16 мг, крахмал картофельный - 60 мг, повидон - 22.6 мг, кремния диоксид коллоидный - 12 мг, тальк - 6.2 мг, магния стеарат - 3.2 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кетоконазол синтетическое производное имидазолдиоксолана, обладающее фунгицидным или фунгистатическим действием против дерматофитов, дрожжеподобных (Candida, Pityrosporum, Torulopsis, Cryptococcus), диморфных грибов и высших грибов (эумицетов).

Менее чувствительны к действию кетоконазола Aspergillus spp., Sporothrix schenckii, другие Dermatiaceae, Mucor spp. и другие фикомицеты, за исключением Enomophthorales.

Активен также в отношении стафилококков и стрептококков.

Кетоконазол ингибирует биосинтез эргостерола в грибах, что приводит к изменению состава липидных компонентов в мембранах.

Уменьшает образование андрогенов.

Фармакокинетика

Абсорбция - высокая (особенно в кислой среде желудка). *Биодоступность* находится в прямой зависимости от величины принятой дозы. Средняя C_{max} кетоконазола в плазме (3.5 мкг/мл) достигается через 1-2 ч после однократного перорального приема 200 мг препарата во время еды. *Выведение* из плазмы является двухфазным: в течение первых 10 ч $T_{1/2}$ составляет 2 ч, а в последующем - 8 ч. Связь с белками плазмы крови - 99%. Хорошо распределяется в тканях и жидкостях организма. В незначительных количествах проникает в спинномозговую жидкость и яички (не создает терапевтических концентраций), проникает через плаценту и в грудное молоко. Метаболизируется в печени в большое число неактивных метаболитов. Главными путями метаболизма являются окисление и расщепление имидазольного и пиперазинового колец, окислительное о-дезалкилирование и ароматическое гидроксилирование. Является ингибитором изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7. Выводится в неизмененном виде и в виде неактивных метаболитов: за 4 сут выводится 70% от принятой дозы (57% - с желчью и 13% - почками). Фармакокинетические характеристики кетоконазола в целом незначительно отличаются у пациентов с печеночной или почечной недостаточностью и у пациентов без таковых.

Показания к применению:

Инфекции гладкой кожи, волосистой части головы, вызванные дерматофитами и/или дрожжевыми грибами в тех случаях, когда местное лечение неприменимо вследствие большого размера пораженных участков, значительной глубины поражения, а также при отсутствии эффекта от проводимого ранее местного лечения:

— дерматофития;

— разноцветный лишай;

— фолликулит, вызванный грибами рода Pityrosporum;

— хронический кандидбз кожи и слизистых оболочек (в т.ч. полости рта, глотки и пищевода);

— хронический рецидивирующий вагинальный кандидоз при отсутствии эффекта от проведения местной терапии.

Системные грибковые инфекции:

— паракокцидиоидоз;

— гистоплазмоз;

— кокцидиоидоз;

— бластомикоз.

Относится к болезням:

- Вагинит
- Дерматит
- Дерматофития
- Инфекции
- Кандидоз кожи
- Лишай
- Разноцветный лишай
- Фолликулит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к кетоконазолу или другим компонентам препарата;

— острые или хронические заболевания печени;

— период лактации;

— детский возраст до 3-х лет;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Одновременный прием с терфенадином, астемизолом, мизоластином, цизапридом, дофетилидом, хинидином, пимозидом, бепридилом, дизопирамидом, галофантрином, левацетилметадолом, домперидоном и сертиндолом; триазоламом и мидазоламом для перорального применения; метаболизируемыми через CYP3A4 ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы (симвастатин, ловастатин); алкалоидами спорыньи (дигидроэрготамин, эргометрин/эрготамин, метилэргометрин); нисолдипином, эплереноном, иринотеканом, эверолимусом.

С осторожностью: печеночная недостаточность, ахлоргидрия, гипохлоргидрия, недостаточность коры надпочечников и гипофиза, одновременный прием потенциально гепатотоксичных лекарственных средств, алкоголизм, беременность, возраст старше 50 лет (женщины).

Способ применения и дозы:

Микозорал следует принимать внутрь, для улучшения всасывания препарата - во время еды.

Взрослые

По 1 таблетке (200 мг) 1 раз/сут. Если при приеме указанной дозы улучшение состояния не наступает, следует увеличить дозу до 2 таблеток (400 мг) 1 раз/сут.

Вагинальный кандидоз - 2 таблетки (400 мг) 1 раз/сут.

Дети старше 3-х лет

— с массой тела от 15 до 30 кг – 1/2 таблетки (100 мг) 1 раз/сут;

— с массой тела более 30 кг - дозы, указанные для взрослых.

Средняя продолжительность лечения.

— вагинальный кандидоз - 7 дней;

— дерматофития - около 4 недель;

— разноцветный лишай-10 дней;

— хронический кандидоз кожи и слизистых оболочек (в т.ч. полости рта, глотки и пищевода) - 2-3 недели;

— грибковые поражения волосистой части головы - 1-2 месяца;

— паракокцидиоидоз, гистоплазмоз, кокцидиоидоз, бластомикоз - обычно продолжительность лечения - 6 месяцев.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, боль в животе, диарея, токсический гепатит (повышение активности «печеночных» трансаминаз или щелочной фосфатазы, гиперкреатининемия).

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, сонливость, парестезии, обратимое повышение внутричерепного давления.

Со стороны органов чувств: фотофобия.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, гемолитическая анемия.

Аллергические реакции: крапивница, кожная сыпь, лихорадка, очень редко - анафилактический шок, анафилактоидные и анафилактические реакции, ангионевротический отек.

Со стороны мочеполовой системы: снижение либидо у мужчин, олигоспермия, импотенция, нарушения менструального цикла.

Прочие: алопеция, гинекомастия (обратимая), временное снижение концентрации тестостерона в плазме крови (нормализуется менее чем через 24 ч после приема).

Передозировка:

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, симптоматическая терапия, контроль состояния пациента. Не существует специфического антидота.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Микозорал не следует назначать беременным, за исключением случаев, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Поскольку кетоконазол проникает в грудное молоко, грудное вскармливание при приеме препарата рекомендуется прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственные средства, оказывающие влияние на метаболизм кетоконазола.

— индукторы микросомального окисления, такие как рифампицин, рифабутин, карбамазепин, изониазид, невирапин и фенитоин значительно снижают биодоступность кетоконазола. Применение кетоконазола с такими препаратами не рекомендуется;

— ритонавир повышает биодоступность кетоконазола, вследствие этого при совместном приеме необходимо уменьшить дозу кетоконазола.

Влияние кетоконазола на метаболизм других лекарственных препаратов.

Кетоконазол может усиливать или пролонгировать действие лекарственных препаратов, метаболизирующихся с участием цитохрома Р450, особенно из группы CYP3A.

Нельзя назначать при проведении курса лечения кетоконазолом:

— терфенадин, астемизол, мизоластин, цизаприд, дофетилид, хинидин, пимозид, бепридил, дизопирамид, галофантрин, левометадил, домперидон и сертиндол. Увеличивается риск возникновения тяжелой желудочковой тахикардии, в т.ч. типа «пируэт»;

— мидазолам и триазолам (пероральные формы), метаболизируемые изоферментом CYP3A4 ингибиторы редуктазы ГМГ-КоА, такие как симвастатин и ловастатин, алкалоиды спорыньи (дигидроэрготамин, эргометрин, эрготамин, метилэргометрин), нисолдипин, эплеренон, иринотекан, эверолимус. Усиливаются эффекты, в том числе побочные, этих препаратов.

Препараты, при назначении которых необходимо следить за их концентрацией в плазме крови, выраженностью терапевтических эффектов и побочным действием (их дозировка при совместном приеме с кетоконазолом при необходимости должна быть уменьшена):

— пероральные антикоагулянты;

— ингибиторы ВИЧ-протеазы, такие как индинавир, саквинавир;

— некоторые противоопухолевые препараты, такие как алкалоиды Барвинка розового, бусульфан, доцетаксел, эрлотиниб, иматиниб;

— метаболизируемые изоферментом CYP3A4 блокаторы «медленных» кальциевых каналов дигидропиридинового ряда и, возможно, верапамил;

— некоторые иммуносупрессивные средства: циклоспорин, такролимус, сиролимус;

— силденафил, толтеродин;

— некоторые ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы, например, аторвастатин;

— некоторые глюкокортикостероиды, такие как будесонид, флютиказон, дексаметазон и метилпреднизолон;

— другие препараты: дигоксин, карбамазепин, буспирон, алфентанил, алпразолам, бротизолам, рифабутин, триметрексат, эбастин, ребоксетин, кветиапин, солифенацин, цилостазол, элетриптан, фентанил, репаглинид.

Этанол и другие гепатотоксические лекарственные средства увеличивают риск развития повреждений печеночной паренхимы. При совместном употреблении этанола возможно возникновение дисульфирамоподобных реакций.

Ослабляет эффект амфотерицина В.

Снижает стимулирующее действие кортикотропина на надпочечники.

Повышает риск развития кровотечения «прорыва» при одномоментном использовании пероральных контрацептивов с низким содержанием гормонов.

Усиливает токсичность фенитоина.

Антацидные и антихолинергические лекарственные средства, блокаторы Н2-гистаминовых рецепторов и другие лекарственные средства, снижающие кислотность желудочного сока, уменьшают всасывание кетоконазола.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом лечения необходимо оценить функцию печени для исключения острых или хронических ее заболеваний, во время лечения необходимо часто и регулярно контролировать функцию печени у всех пациентов для того, чтобы не пропустить первые признаки гепатотоксичности. Суммарно получаемая доза кетоконазола (на курс лечения) является фактором риска тяжелой гепатотоксичности.

У женщин старше 50 лет, при наличии заболеваний печени в анамнезе, при лекарственной непереносимости, приеме гепатотоксических лекарственных средств, а также, если длительность лечения препаратом превышает 2 недели, необходимо контролировать функцию печени до начала лечения, через 2 недели лечения и затем ежемесячно, так как у этих категорий пациентов риск токсического действия препарата на печень увеличивается.

Очень важно ознакомить пациентов, которым необходимо длительное лечение препаратом, с симптомами заболевания печени (повышенная утомляемость, упадок сил, повышение температуры тела, потемнение мочи, обесцвечивание кала, желтуха).

В случае появления симптомов гепатита или если функциональные печеночные тесты подтверждают заболевание печени, лечение должно быть немедленно прекращено. Если лечение кожных поражений проводилось глюкокортикостероидами, то кетоконазол назначают не ранее чем через 2 недели после их отмены.

Пациентам, принимающим антацидные препараты (например, гидроксид алюминия), следует принимать их не ранее, чем через 2 ч после приема препарата.

У больных с ахлоргидрией или гипохлоргидрией из-за непредсказуемого снижения степени всасывания кетоконазол может оказаться малоэффективным при пероральном приеме. Употребление кислых напитков повышает всасывание кетоконазола.

При применении в дозе 400 мг и более наблюдается снижение «кортизолового ответа» при стимуляции надпочечников адренокортикотропным гормоном (АКТГ), поэтому в период лечения необходимо контролировать функцию надпочечников у пациентов с надпочечниковой недостаточностью, а также у пациентов, подвергающихся значительным стрессовым воздействиям (в т.ч. обширные хирургические вмешательства).

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при острых или хронических заболеваниях печени.

С осторожностью: печеночная недостаточность.

У женщин старше 50 лет, при наличии заболеваний печени в анамнезе, при лекарственной непереносимости, приеме гепатотоксических лекарственных средств, а также, если длительность лечения препаратом превышает 2 недели, необходимо контролировать функцию печени до начала лечения, через 2 недели лечения и затем ежемесячно, так как у этих категорий пациентов риск токсического действия препарата на печень увеличивается.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: возраст старше 50 лет (женщины).

Применение в детском возрасте

Применяется у детей с 3-х лет по показаниям.

Условия хранения:

Препарат хранить в недоступном для детей, сухом и защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С.

Не применять по истечении срока годности.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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