

## [Пентакокс](#)



### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#) [Википедия](#)  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### **Фармакологические свойства:**

#### **Фармакодинамика**

Противотуберкулезный антибиотик группы рифамицина, представляет собой циклопентильный рифамицин. Ингибирует ДНК-зависимую РНК-полимеразу чувствительных штаммов *Mycobacterium tuberculosis*, но не в клетках млекопитающих. В терапевтических дозах рифапентин проявляет бактерицидную активность в отношении внутриклеточных и внеклеточных форм *Mycobacterium tuberculosis*. Рифапентин и его активный метаболит (25-дезацетилрифапентин) накапливаются в человеческих моноцитарных макрофагах с соотношением внутри-/внеклеточного содержания приблизительно 24:1 и 7:1 соответственно.

Существует перекрестная резистентность штаммов *Mycobacterium tuberculosis* между рифапентином и рифамицином. Перекрестной резистентности между рифапентином и другими противотуберкулезными средствами не наблюдалось.

#### **Фармакокинетика**

После приема внутрь в дозе 600 мг  $C_{max}$  рифапентина в плазме крови достигается через 4-6 ч. При приеме рифапентина жирной пищей AUC и  $C_{max}$  возрастали на 43% и 44% соответственно.

Связывание рифапентина с белками плазмы (преимущественно с альбуминами) составляет 97.7%.

Под влиянием эстераз метаболизируется с образованием активного метаболита 25-дезацетилрифапентина.

$T_{1/2}$  составляет  $13.19 \pm 1.38$  ч. Выводится с калом (70%) и с мочой (17%). В течение 7 дней из организма выводится 80% активного вещества.

### **Показания к применению:**

Лечение туберкулеза легких, вызванного *Mycobacterium tuberculosis* в комбинации с одним или более противотуберкулезных средств.

### **Относится к болезням:**

- [Туберкулез](#)

### **Противопоказания:**

Повышенная чувствительность к рифапентину и другим антибиотикам группы рифамицина.

## Способ применения и дозы:

Применяют только при чувствительности возбудителя к данному антибиотику.

Рифапентин предназначен для приема внутрь в дозе 600 мг 1-2 раза неделю с интервалом не менее 3 последовательных дней (72 ч) в комбинации с другими противотуберкулезными средствами (этамбуол, пипразинамид, изониазид, стрептомицин).

Лечение проводят по специальной схеме, состоящей из начальной фазы терапии, продолжительностью 2 месяца и последующей фазы, продолжительностью 4 месяца. Выбор противотуберкулезного средства для комбинации производится на основании определения чувствительности возбудителя. Показана эффективность рифапентина в комбинации с этамбуолом, пипразинамидом, изониазидом или стрептомицином.

Лечение проводят под строгим клиническим контролем.

## Побочное действие:

Перечисленные реакции наблюдались при применении рифапентина в составе комбинированной терапии.

*Со стороны мочевыделительной системы:* пиурия, протеинурия, гематурия, инфекции мочевыводящих путей, эпизоды недержания мочи, цистит, заболевания уретры, пиелонефрит.

*Со стороны обмена веществ:* гиперурикемия, гиперкалиемиия, гипогликемия, повышение содержания небелкового азота, гипергликемия, повышение содержания ЛДГ, гиперфосфатемия, уменьшение массы тела, повышение содержания остаточного азота мочевины, сахарный диабет, повышение активности ЩФ, гипофосфатемия, гиперкальциемия, гиповолемия, увеличение массы тела, порфирия.

*Со стороны системы кроветворения:* анемия, лимфопения, нейтропения, лейкоцитоз, нейтрофилия, тромбоцитоз, тромбоцитопения, полицитемия, лимфаденопатия, лимфоцитоз, гематома, гематома, пурпура, тромбоз.

*Со стороны организма в целом:* боли в спине, боли во всем теле, боли в груди, травматизм, боли в животе, лихорадка, слабость, склонность к отечности, астения, абсцессы.

*Дерматологические реакции:* сыпь, повышение потоотделения, зуд, акне, кожные заболевания, макуло-папулезная сыпь, экзема, язвенные поражения кожи, крапивница, сухость кожи, фурункулез, нарушение пигментации кожи, грибковый дерматит, заболевания ногтей, эритематозная сыпь, алопеция.

*Со стороны дыхательной системы:* кровохарканье, кашель, инфекции верхних дыхательных путей, бронхит, фарингит, одышка, плеврит, громкое дыхание, пневмоторакс, пневмония, ринит, диспноэ, плевральный выпот, пневмонит, синусит, увеличение количества мокроты, легочный фиброз, застой верхних дыхательных путей, астма, бронхоспазм, отек гортани.

*Со стороны пищеварительной системы:* анорексия, диспепсия, рвота, тошнота, запор, диарея, геморрой, повышение активности АЛТ и АСТ, гастроэнтерит, гастрит, эзофагит, хейлит, ухудшение состояния зубов, панкреатит, проктит, увеличение объема слюнных желез, тенезмы, неспецифические желудочно-кишечные нарушения, билирубинемия, гепатомегалия, желтуха, гепатотоксичность, гипербилирубинемия, порфирия, диарея, обусловленная *Clostridium difficile*.

*Инфекции:* грипп, туберкулезная инфекция, другие инфекции, опоясывающий лишай, инфицирование паразитами и простейшими.

*Со стороны ЦНС:* бессонница, сонливость, неспецифические судороги, дисфония, гипестезия, кривошея, гипорефлексия, менингит, ступор, мигрень, тревога, нарушение сознания, ступор.

*Со стороны костно-мышечной системы:* артралгия, артрит, артроз, подагра, миалгия, миозит, перелом костей, мышечная слабость, мышечный спазм.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* артериальная гипертензия, синкопе, тахикардия, пальпитация, ортостатическая гипотензия, перикардит, тромбофлебит глубоких вен, сосудистые нарушения, вазодилатация.

*Со стороны репродуктивной системы:* заболевания полового члена, вагинит, влагалищное кровотечение, лейкорея, мастит грудной железы у мужчин, заболевания предстательной железы.

*Со стороны органов чувств:* конъюнктивит, неспецифические нарушения слуха, средний отит, боли в ушах, наружный отит, перфорация барабанной перепонки, боли в глазах, глазные нарушения, потеря вкусовых ощущений.

*Злокачественные новообразования:* легочная карцинома, неспецифическая неоплазма, карцинома, липома.

*Прочие:* изменение цвета жидких сред организма.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения рифапентина при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) не проводилось.

Неизвестно, выделяется ли рифапентин с грудным молоком у человека. Следует иметь в виду, что на фоне применения препарата грудное молоко может приобретать красновато-оранжевую окраску. При необходимости применения рифапентина в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

В экспериментальных исследованиях показано, что рифапентин оказывает эмбриофетотоксическое действие у животных.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Рифапентин – индуктор изоферментов цитохрома P450, поэтому при одновременном применении с препаратами, метаболизирующимися этой ферментной системой, такими как ингибиторы протеазы, ингибиторы обратной транскриптазы, может вызывать значительное уменьшение концентрации этих препаратов в плазме крови и потерю их терапевтического эффекта.

Рифапентин способен уменьшать эффективность гормональных контрацептивов (в период лечения пациенты должны применять надежные средства негормональной контрацепции).

Рифапентин является индуктором изоферментов CYP3A4 и CYP2C8/9, поэтому при одновременном применении с лекарственными средствами, метаболизирующимися данными изоферментами, возможно усиление их метаболизма. Индукция изоферментов, вызванная рифапентином, наблюдается в течение 4 сут после приема первой дозы и возвращается к исходному уровню через 14 дней после отмены рифапентина. Кроме того, степень индукции ферментов рифапентином зависит от его дозы и частоты применения: менее выраженная активность наблюдается при пероральной дозе 600 мг с интервалом 72 ч, по сравнению с ежедневным приемом.

При одновременном применении с рифапентином может потребоваться коррекция дозы следующих лекарственных средств, метаболизирующихся при участии изоферментов CYP3A4 и CYP2C8/9: варфарин, фенитоин, хинидин, флуконазол, итраконазол, кетоконазол, галоперидол, фенобарбитал, диазепам, пропранолол, дилтиазем, нифедипин, верапамил, дигоксин, преднизон, клофибрат, гипогликемические средства производные сульфонилмочевины, этинилэстрадиол, левоноргестрел, циклоспорин, такролимус, теофиллин, метадон, силденафил, левотироксин, амитриптилин, нортриптилин.

## Особые указания и меры предосторожности:

Не следует применять в качестве еженедельной длительной терапии (в течение 4 месяцев) в комбинации с изониазидом у ВИЧ-серопозитивных пациентов с туберкулезом легких из-за более высокой степени неэффективности лечения и/или развития рецидива туберкулеза в присутствии рифампин-резистентных штаммов.

Рифапентин не изучен как часть начальной терапии (в течение 2 месяцев) у ВИЧ-серопозитивных пациентов с туберкулезом легких.

Не следует применять рифапентин в качестве монотерапии.

С осторожностью следует применять рифапентин у пациентов с кавернозным туберкулезом легких и/или наличием возбудителя в мокроте после начальной фазы терапии или при наличии двустороннего поражения легких, в связи с более высоким риском рецидива.

У ВИЧ-серопозитивных пациентов, получающих терапию рифапентином в продолжительной фазе лечения (в течение 4 месяцев), наблюдается более высокая частота рецидива туберкулеза. Фактором риска рецидива является наличие, наряду с поражением легких, внелегочного туберкулеза, низкий уровень CD4-клеток, применение противогрибковых средств производных азола и более молодой возраст пациента.

Нельзя исключить появление гипербилирубинемии вследствие конкуренции за пути выведения между рифапентином и билирубином, т.к. между рифампином и билирубином данная конкуренция наблюдается. В период лечения следует контролировать уровень билирубина в крови.

У пациентов с заболеваниями или состояниями, предрасполагающими к развитию невропатии (в т.ч. дефицит питания, ВИЧ-инфекция, почечная недостаточность, алкоголизм, а также беременность и период грудного вскармливания) во избежание развития периферической невропатии следует одновременно применять пиридоксин (витамин B<sub>6</sub>).

## **Пентакокс**

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

На фоне применения рифапентина возможно преимущественно красно-оранжевое окрашивание тканей и/или жидкостей организма (например, кожи, зубов, языка, мочи, кала, слюны, мокроты, слез, пота, спинномозговой жидкости).

Не следует применять рифапентин у пациентов с порфирией, учитывая, что рифампин вызывает обострение данного заболевания.

В случае развития на фоне лечения диарей, вызванной *Clostridium difficile* следует немедленно начать соответствующую терапию.

С осторожностью применять у пациентов пожилого возраста, учитывая возможное ухудшение функции печени, почек, сердечно-сосудистой системы, наличие сопутствующих заболеваний и одновременное применение других лекарственных средств.

Безопасность и эффективность рифапентина у пациентов моложе 12 лет не изучена.

### ***При нарушениях функции почек***

У пациентов с заболеваниями или состояниями, предрасполагающими к развитию невропатии (в т.ч. почечная недостаточность) во избежание развития периферической невропатии следует одновременно применять пиридоксин (витамин В<sub>6</sub>).

### ***Применение в пожилом возрасте***

С осторожностью применять у пациентов пожилого возраста, учитывая возможное ухудшение функции печени, почек, сердечно-сосудистой системы, наличие сопутствующих заболеваний и одновременное применение других лекарственных средств.

### ***Применение в детском возрасте***

Безопасность и эффективность рифапентина у пациентов моложе 12 лет не изучена.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Pentakoks>