Румикоз



Код АТХ:

- J02AC02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Итраконазол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы с белым корпусом и розово-коричневой крышечкой, размер №0; содержимое капсул - сферические микрогранулы от светло-желтого до желтовато-бежевого цвета.

	1 капс.
итраконазол	100 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза, полоксамер (лутрол), крахмал пшеничный, сахароза.

Состав твердых желатиновых капсул: желатин, титана диоксид, хинолиновый желтый, железа оксид красный, железа оксид черный, желтый закатный, азорубин.

5 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
6 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический противогрибковый препарат широкого спектра действия, производное триазола. Ингибирует синтез эргостерола клеточной мембраны грибов, что обуславливает противогрибковый эффект препарата.

Итраконазол *активен в отношении* дерматофитов (Trichophyton spp., Microsporum spp., Epidermophyton floccosum), дрожжеподобных грибов и дрожжей (Cryptococcus neoformans, Pityrosporum spp., Trichosporon spp., Geotrichum spp., Candida spp., включая Candida albicans, Candida glabrata, Candida krusei), Aspergillus spp., Histoplasma spp., Paracoccidioides brasiliensis, Sporothrix schenckii, Fonsecaea spp., Cladosporium spp., Blastomyces dermatidis, Pseudallescheria boydii, Penicillium marneffei, а также в отношении других дрожжевых и плесневых грибов.

Фармакокинетика

Всасывание

При пероральном применении максимальная биодоступность итраконазола отмечается при приеме капсул сразу же после еды. C_{max} в плазме достигается в течение 3-4 ч после приема внутрь.

Распределение

При длительном приеме C_{ss} достигается в течение 1-2 недель. C_{ss} итраконазола в плазме через 3-4 ч после приема препарата составляет 0.4 мкг/мл (100 мг при приеме 1 раз/сут), 1.1 мкг/мл (200 мг при приеме 1 раз/сут) и 2 мкг/мл (200 мг при приеме 2 раза/сут).

Связывание с белками плазмы составляет 99.8% с белками плазмы.

Итраконазол хорошо проникает и распределяется в тканях и органах. Концентрация препарата в легких, почках, печени, костях, желудке, селезенке, скелетных мышцах в 2-3 раза превышает его концентрацию в плазме. Накопление итраконазола в кератиновых тканях, особенно в коже, в 4 раза превышает его накопление в плазме, а скорость выведения зависит от регенерации эпидермиса.

В отличие от концентраций в плазме, которые не поддаются обнаружению уже через 7 дней после прекращения терапии, терапевтические концентрации в коже сохраняются в течение 2-4 недель после прекращения 4-недельного курса лечения; в слизистой оболочке влагалища - в течение 2 дней после окончания 3-дневного курса лечения препаратом в дозе 200 мг/сут и 3 дней после окончания 1-дневного курса лечения препаратом в дозе 200 мг 2 раза/сут. Терапевтическая концентрация в кератине ногтей определяется через 1 неделю после начала лечения и сохраняется в течение 6 месяцев после завершения 3-месячного курса терапии. Итраконазол определяется также в секрете сальных и потовых желез.

Метаболизм

Метаболизируется в печени с образованием активных метаболитов, один из которых - гидрокси-итраконазол оказывает сравнимое с итраконазолом противогрибковое действие in vitro.

Выведение

Выведение из плазмы является двухфазным с конечным $T_{1/2}$ от 24-36 ч.

Выведение с калом составляет от 3% до 18% дозы. Выведение с мочой составляет менее 0.03%. Примерно 35% дозы выводится в виде метаболитов с мочой в течение 1 недели.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с почечной недостаточностью, а также у некоторых пациентов с нарушенным иммунитетом (например, при СПИД, после трансплантации органов или в случае нейтропении) возможно снижение биодоступности препарата.

У пациентов с циррозом печени биодоступность итраконазола снижена, $T_{1/2}$ итраконазола увеличен.

Показания к применению:

— дерматомикозы;

— грибковый кератит;

— онихомикозы, вызванные дерматофитами и/или дрожжами и плесневыми грибами;

— системные микозы: системный аспергиллез и кандидоз; криптококкоз, включая криптококковый менингит (пациентам с иммунодефицитом и пациентам с криптококкозом ЦНС Румикоз следует назначать только в случаях, если препараты первой линии лечения не применимы в данном случае или не эффективны); гистоплазмоз; споротрихоз; паракокцидиоидомикоз; бластомикоз; другие системные или тропические микозы;

— кандидоз с поражением кожи или слизистых (в т.ч. вульвовагинальный кандидоз);

— глубокие висцеральные кандидозы;

— отрубевидный лишай.

Относится к болезням:

- Вульвит

- Дерматит
- Дерматофития
- Кератит
- Лишай
- Менингит
- Микоз
- Отрубевидный лишай

Противопоказания:

— одновременное с Румикозом применение лекарственных средств, метаболизирующихся с участием изофермента CYP3A4, которые способны увеличивать интервал QT (терфенадин, астемизол, мизоластин, цизаприд, дофетилид, хинидин, пимозид, левометадон, сертиндол); ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы, метаболизирующихся с участием изофермента CYP3A4 (симвастатин, ловастатин); мидазолама и триазолама (для приема внутрь); препаратов алкалоидов спорыньи (дигидроэрготамин, эргометрин, эрготамин и метилэргометрин);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат у детей, у пациентов с тяжелой сердечной недостаточностью, с заболеваниями печени (в т.ч. сопровождающимися печеночной недостаточностью), при хронической почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь после еды.

Таблица 1.

Показание	Доза	Продолжительность лечения
Вульвовагинальный кандидоз	200 мг 2 раза/сут	1 день
	200 мг 1 раз/сут	3 дня
Отрубевидный лишай	200 мг 1 раз/сут	7 дней
Дерматомикозы гладкой кожи	200 мг 1 раз/сут	7 дней
	100 мг 1 раз/сут	15 дней
Поражения высококератинизированных областей кожного покрова, таких как кисти рук и стопы	200 мг 2 раз/сут	7 дней
	100 мг 1 раз/сут	30 дней
Оральный кандидоз	100 мг 1 раз/сут	15 дней
Грибковый кератит	200 мг 1 раз/сут	21 день Возможна коррекция длительности лечения с учетом положительной динамики клинической картины

Биодоступность итраконазола при пероральном приеме может быть снижена у некоторых пациентов с нарушенным иммунитетом, например, у больных с нейтропенией, больных СПИД или перенесших трансплантацию органов. В подобных случаях может потребоваться двукратное увеличение дозы.

Онихомикозы, вызванные дерматофитами и/или дрожжами, плесневыми грибами

Пульс-терапия

Один курс пульс-терапии заключается в ежедневном приеме Румикоза по 200 мг 2 раза/сут (по 2 капс. 2 раза/сут) в течение 1 недели (таблица 2).

Для лечения *грибковых поражений ногтевых пластинок кистей* рекомендуется 2 курса.

Для лечения *грибковых поражений ногтевых пластинок стоп* рекомендуется 3 курса.

Интервал между курсами, в течение которого не нужно принимать препарат, составляет 3 недели. Клинические результаты становятся очевидны после окончания лечения, по мере отрастания ногтей.

Таблица 2.

Локализация онихомикозов	1-я нед.	2-я, 3-я, 4-я нед.	5-я нед.	6-я, 7-я, 8-я нед.	9-я нед.
Поражение ногтевых пластинок стоп с поражением или без поражения ногтевых пластинок кистей	1-й курс	недели, свободные от приема Румикоза	2-й курс	недели, свободные от приема Румикоза	3-й курс
Поражение только ногтевых пластинок кистей	1-й курс	недели, свободные от приема Румикоза	2-й курс	-	-

Непрерывная терапия

При *поражении ногтевых пластинок стоп с поражением или без поражения ногтевых пластинок кистей* доза составляет 200 мг/сут, продолжительность лечения - 3 мес.

Выведение Румикоза из кожи и ногтевой ткани осуществляется медленнее, чем из плазмы. Таким образом, оптимальные клинические и микологические эффекты достигаются через 2-4 недели после окончания лечения при поражениях кожи и через 6-9 мес после окончания лечения заболеваний ногтей.

Системные микозы

Рекомендуемые дозы варьируют в зависимости от вида инфекции.

Таблица 3.

Показание	Доза	Средняя продолжительность	Замечания
Аспергиллез	200 мг 1 раз/сут	2-5 мес	Увеличить дозу до 200 мг 2 раза/сут в случае инвазивного или диссеминированного заболевания
Кандидоз	100-200 мг 1 раз/сут	от 3 нед. до 7 мес	
Криптококкоз (кроме менингита)	200 мг 1 раз/сут	от 2 мес до 1 года	
Криптококковый менингит	200 мг 2 раза/сут	от 2 мес до 1 года	Поддерживающая терапия
Гистоплазмоз	от 200 мг 1 раз/сут до 200 мг 2 раза/сут	8 мес	-
Бластомикоз	от 100 мг 1 раз/сут до 200 мг 2 раза/сут	6 мес	
Споротрихоз	100 мг 1 раз/сут	3 мес	-
Паракокцидиоидомикоз	100 мг 1 раз/сут	6 мес	-
Хромомикоз	100-200 мг 1 раз/сут	6 мес	-

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диспепсия, тошнота, рвота, снижение аппетита, боль в животе, диарея, запор, обратимое повышение активности печеночных ферментов, гепатит; очень редко - тяжелое токсическое поражение печени, в т.ч. случаи острой печеночной недостаточности с летальным исходом.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, периферическая невропатия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, ангионевротический отек; редко - многоформная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Дерматологические реакции: алопеция, фотосенсибилизация.

Прочие: нарушения менструального цикла, гипокалиемия, отечный синдром, застойная сердечная недостаточность и отек легких, окрашивание мочи в темный цвет, гиперкреатининемия.

Передозировка:

Данные о случаях передозировки препарата Румикоз отсутствуют.

Лечение: при случайной передозировке следует применять поддерживающие меры. В течение первого часа провести промывание желудка и, если это необходимо, назначить активированный уголь. Итраконазол не выводится из организма при гемодиализе. Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат следует назначать только в том случае, когда потенциальная польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Женщинам детородного возраста, принимающим итраконазол, необходимо использовать адекватные методы контрацепции на протяжении всего курса лечения вплоть до наступления первой менструации после его завершения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственные средства, оказывающие влияние на абсорбцию итраконазола

Препараты, уменьшающие кислотность желудочного сока, снижают абсорбцию итраконазола.

Лекарственные средства, оказывающие влияние на метаболизм итраконазола

Итраконазол в основном метаболизируется изоферментом CYP3A4. При одновременном применении с рифампицином, рифабутином, фенитоином, карбамазепином, изониазидом, являющимися мощными индукторами изофермента CYP3A4, биодоступность итраконазола и гидрокси-итраконазола значительно снижается, что приводит к существенному уменьшению эффективности препарата (одновременное применение Румикоза с данными препаратами не рекомендуется).

Мощные ингибиторы фермента CYP3A4, такие как ритонавир, индинавир, кларитромицин и эритромицин, могут увеличивать биодоступность итраконазола.

Влияние итраконазола на метаболизм других лекарственных средств

Итраконазол способен ингибировать CYP3A4-опосредованный метаболизм препаратов, что может приводить к усилению или пролонгированию их действия, в т.ч. побочных эффектов. После прекращения лечения препаратом Румикоз концентрация итраконазола в плазме снижается постепенно, в зависимости от дозы и длительности лечения. Это следует учитывать при необходимости комбинированной терапии.

Препараты, которые нельзя назначать одновременно с итраконазолом

Блокаторы кальциевых каналов, помимо возможного фармакокинетического взаимодействия, связанного с общим CYP3A4-опосредованным метаболизмом, способны оказывать отрицательный инотропный эффект, который может усиливать аналогичный эффект, проявляемый итраконазолом.

Препараты, при назначении которых необходимо следить за их концентрацией в плазме, действием, побочными эффектами

— пероральные антикоагулянты;

— ингибиторы ВИЧ-протеазы (ритонавир, индинавир, саквинавир);

— противоопухолевые препараты (алкалоиды барвинка розового, бусульфан, доцетаксел, триметрексат);

— блокаторы кальциевых каналов (дигидропиридин, верапамил), метаболизирующиеся изоферментом CYP3A4;

— иммунодепрессивные средства (циклоспорин, такролимус, сиролимус);

— ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы, метаболизирующиеся изоферментом CYP3A4;

— некоторые ГКС (будезонид, дексаметазон и метилпреднизолон);

— другие препараты: дигоксин, карбамазепин, буспирон, альфентанил, алпразолам, бротизолам, мидазолам для в/в введения, рифабутин, эбастин, ребоксетин, цилостазол, дизопирамид, элетриптан, галофантрин, репаглинид.

При необходимости одновременного применения с Румикозом может потребоваться уменьшение дозы этих препаратов.

Взаимодействия между итраконазолом и зидовудином, флувастатином не обнаружено.

Не отмечалось влияния итраконазола на метаболизм этинилэстрадиола и норэтистерона.

Исследования in vitro продемонстрировали отсутствие взаимодействия между итраконазолом и пропранололом, имипрамином, диазепамом, циметидином, индометацином, толбутамидом, сульфаметазином при связывании с белками плазмы.

Особые указания и меры предосторожности:

При исследовании в/в лекарственной формы итраконазола отмечалось преходящее бессимптомное уменьшение фракции выброса левого желудочка, нормализовавшееся до следующей инфузии препарата.

Обнаружено, что итраконазол обладает отрицательным инотропным эффектом. Сообщалось о случаях развития сердечной недостаточности, связанных с приемом Румикоза. Поэтому препарат не назначают пациентам с хронической сердечной недостаточностью или с наличием этого заболевания в анамнезе, за исключением случаев, когда ожидаемая польза терапии значительно превосходит потенциальный риск.

Блокаторы кальциевых каналов могут оказывать отрицательный инотропный эффект, который может усиливать подобный эффект итраконазола; итраконазол способен замедлять метаболизм блокаторов кальциевых каналов. При одновременном применении итраконазола и блокаторов кальциевых каналов требуется осторожность.

У пациентов с почечной недостаточностью возможно снижение биодоступности итраконазола, в таких случаях может потребоваться коррекция дозы.

При пониженной кислотности желудка абсорбция итраконазола нарушается. Пациентам, получающим антацидные препараты (например, гидроксид алюминия), рекомендуется принимать их не ранее чем через 2 ч после приема Румикоза. Пациентам с ахлоргидрией, а также больным, принимающим блокаторы гистаминовых H_2-рецепторов или ингибиторы протоновой помпы, рекомендуется принимать итраконазол с кислыми напитками.

В очень редких случаях при применении Румикоза развивалось тяжелое токсическое поражение печени, иногда с острой печеночной недостаточностью и летальным исходом. Это наблюдалось у пациентов с уже имеющимися заболеваниями печени, а также у пациентов, получавших другие лекарственные средства, обладающие гепатотоксическим действием. Несколько таких случаев возникли в первый месяц терапии, а некоторые - в первую неделю лечения. В связи с этим рекомендуется регулярно контролировать функцию печени у пациентов, получающих Румикоз.

Лечение следует прекратить при возникновении невропатии, которая может быть связана с приемом Румикоза.

Нет данных о перекрестной гиперчувствительности к итраконазолу и другим азоловым противогрибковым препаратам. Румикоз следует с осторожностью назначать пациентам с гиперчувствительностью к другим азоловым противогрибковым средствам.

У пациентов с нарушенным иммунитетом (СПИД, состояние после трансплантации органов, нейтропения) может потребоваться увеличение дозы Румикоза.

Использование в педиатрии

Румикоз не следует назначать детям, за исключением случаев, когда ожидаемая польза терапии превосходит возможный риск.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Влияния на способность к управлению автомобилем и работе с техникой не наблюдалось.

При нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью биодоступность итраконазола может быть снижена. В этом случае, возможно, будет необходима коррекция дозы.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с заболеваниями печени (в т.ч. сопровождающимися печеночной недостаточностью).

Применение в детском возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат у детей.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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