Теризидон Нео

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы твердые желатиновые, размер №0, с корпусом черного цвета и крышечкой фиолетового цвета; содержимое капсул - гранулы от белого до светло-желтого цвета.

	1 капс.
теризидон	250 мг
пиридоксина гидрохлорид	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 72 мг, кросповидон - 9 мг, повидон К30 - 14 мг, тальк - 5 мг, магния сульфат - 5 мг.

Состав желатиновой капсулы: крышечка: титана диоксид - 1.7871%, метилпарагидроксибензоат - 0.8%, пропилпарагидроксибензоат - 0.2%, бриллиантовый голубой - 0.0049%, кармуазин - 0.0799%, вода - 14-15%, натрия лаурилсульфат - следы, желатин - до 100%; корпус: метилпарагидроксибензоат - 0.8%, пропилпарагидроксибензоат - 0.2%, бриллиантовый голубой - 0.716%, краситель Понсо 4R - 0.718%, краситель солнечный закат желтый - 0.292%, вода - 14-15%, натрия лаурилсульфат - следы, желатин - до 100%.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Теризидон - антибиотик широкого спектра действия, является производным D-циклосерина. Теризидон конкурентно блокирует ферменты, которые встраивают аланин в аланил-аланин дипептид - основной компонент стенки микобактерии. Не обладает перекрестной устойчивостью к другим противотуберкулезным препаратам. Теризидон обладает антибактериальной активностью по отношению к микобактериям туберкулеза и бактериям, вызывающим инфекции мочевыводящих путей, включая штаммы бактерий, которые становятся резистентными к другим антибиотикам. МИК теризидона для чувствительных штаммов - 4-250 мг/л, в т.ч. для микобактерий туберкулеза составляет 10-40 мг/л, для стафилококков - 8-32 мг/л, для грамотрицательных бактерий, имеющих клиническое значение - 50-250 мг/л.

Теризидон *активен в отношении:* Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium bovis, Mycobacterium avium, а также Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis. К теризидону чувствительны также Enterococcus faecalis, Escherichia coli, Citrobacter, Enterobacter, Morganella morganii, Klebsiella pneumoniae, Pseudomonas aeruginosa.

Пиридоксина гидрохлорид действует как коэнзим, участвуя в биохимических реакциях, включая метаболизм аминокислот и гликогена, в синтезе нуклеиновых кислот, гемоглобина, сфингомиелина и других сфинголипидов, в

синтезе медиатора серотонина, допамина, норэфедрина и ГАМК. Пиридоксин обладает антинейротоксическим действием. Применение пиридоксина уменьшает побочные эффекты со стороны ЦНС.

Фармакокинетика

Теризидон

Всасывается из ЖКТ быстро и почти полностью - на 70-90%. Прием пищи не влияет на скорость всасывания. После приема внутрь теризидона в дозе 250 мг C_{max} в плазме крови составляет около 6.5 мкг/мл, T_{max} - 2-4 ч. Широко распределяется в тканях и жидкостях организма, например в легких, желчи, проникает в асцитическую, плевральную и синовиальную жидкости, лимфу, слюну. Очень хорошо проникает в цереброспинальную жидкость (концентрация в цереброспинальной жидкости достигает 80-100% концентрации в сыворотке крови), более высокая концентрация отмечается у пациентов с воспалением мозговых оболочек. При приеме внутрь теризидона в дозе 250 мг высокие концентрации препарата обнаруживаются в крови и моче, что позволяет использовать его для лечения инфекций мочевыводяших путей, в т.ч. хронических форм.

Выделение почками происходит медленно и равномерно, $T_{1/2}$ - 24 ч. Замедленная экскреция препарата почками приводит к тому, что уровень концентрации теризидона в моче сохраняется в течение 12 ч, 60-70% препарата выводится в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации. Небольшое количество выводится кишечником. Значение константы элиминации составляет - 0.0262 $ч^{-1}$. Незначительное количество теризидона метаболизируется, что является причиной низкого/слабого токсического влияния на почки. При почечной недостаточности $T_{1/2}$ удлиняется до 72 ч.

Пиридоксина гидрохлорид

Всасывается быстро на всем протяжении тонкого кишечника, большее количество абсорбируется в тощей кишке. Метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов (пиридоксальфосфата и пиридоксаминофосфата). Пиридоксальфосфат на 90% связывается с белками плазмы. Хорошо проникает во все ткани; накапливается преимущественно в печени, меньше - в мышцах и ЦНС. Проникает через плацентарный барьер, секретируется с грудным молоком. $T_{1/2}$ составляет 15-20 дней. Выводится почками, а также посредством гемодиализа.

Показания к применению:

Туберкулез различных форм и локализаций в составе комплексной терапии лекарственноустойчивых форм туберкулеза.

Относится к болезням:

- Туберкулез

Противопоказания:

Органические заболевания ЦНС, атеросклероз головного мозга; эпилепсия, эпилептические припадки (в т.ч. в анамнезе); психические нарушения (тревожность, психозы, депрессия, в т.ч. в анамнезе); тяжелая почечная недостаточность (концентрация креатинина более 2 мг/дл); алкоголизм; детский и подростковый возраст до 14 лет; беременность, период лактации; непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции; повышенная чувствительность к теризидону или циклосерину, пиридоксину, а также к любому другому компоненту препарата.

С осторожностью: пожилой возраст, ИБС, нарушения функции печени, нарушение функции почек (КК менее 30 мл/мин), хроническая сердечная недостаточность, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Взрослым и детям старше 14 лет и массой тела менее 60 кг назначают по 300 мг 2 раза/сут (600 мг/сут); с **массой тела 60-80 кг** - по 300 мг 3 раза/сут (900 мг/сут); **взрослым с массой тела более 80 кг** - по 600 мг 2 раза/сут (1200 мг/сут).

При **нарушении функции почек (КК менее 30 мл/мин)** дозу препарата и кратность приема уменьшают: по 250 мг 1 раз/сут ежедневно или по 500 мг 3 раза в неделю (например, понедельник, среда, пятница). При **концентрации креатинина более 2 мг/дл** прием препарата противопоказан.

Продолжительность курса лечения составляет 3-4 мес.

Препарат не обладает особенностями действия при первом приеме или при его отмене.

Не следует преждевременно прекращать или временно прерывать начатый курс лечения или принимать препарат нерегулярно.

При пропуске приема одной дозы необходимо принять следующую дозу препарата в установленное время, не следует принимать удвоенную дозу.

Побочное действие:

Для оценки частоты возникновения нежелательных реакций использованы следующие градации: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000, в т.ч. сообщения о единичных случаях).

Со стороны нервной системы: редко - головная боль, головокружение, повышенная возбудимость, тремор, бессонница, чувство опьянения; очень редко - судороги (в т.ч. эпилептические), дизартрия, психические расстройства, такие как мании или депрессии.

Со стороны пищеварительной системы: редко - боль в животе, метеоризм и диарея.

Прочие: очень редко - аллергические реакции, кожная сыпь.

За счет *наличия в составе пиридоксина гидрохлорида* (дополнительно): гиперсекреция соляной кислоты, онемение и появление чувства сдавливания в конечностях (симптом "чулок" и "перчаток"), снижение лактации.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата во время беременности противопоказано.

Концентрации теризидона в грудном молоке приближаются к таковым в плазме крови. В случае применения препарата в период лактации необходимо прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Теризидон

Этанол повышает риск развития побочных реакций, в т.ч. эпилептических припадков.

При одновременном применении с *этионамидом* повышается риск возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС (особенно судорог).

При одновременном применении с *фентоином* возможно увеличение концентрации фенитоина в плазме крови.

Одновременное применение с *изониазидом* повышает частоту возникновения головокружения, сонливости.

При одновременном применении с *циклосерином* возможна передозировка препарата.

Пиридоксин

Усиливает действие *диуретиков*.

Ослабляет фармакологические эффекты *леводопы*.

Изониазид, пеницилламин, циклосерин и эстрогенсодержащие пероральные контрацептивные препараты ослабляют эффект пиридоксина.

Препарат сочетается с *сердечными гликозидами* (пиридоксин способствует повышению сократительных белков в миокарде), *глутаминовой кислотой и калия и магния аспарагинатом*.

Особые указания и меры предосторожности:

Теризидон может вызвать дефицит цианокобаламина и/или фолиевой кислоты, в этих случаях необходимо провести соответствующее обследование и лечение пациента. Рекомендуется принимать совместно с глутаминовой кислотой в дозе 500 мг 3 раза/сут.

При лечении препаратом следует ежемесячно контролировать анализы крови и мочи, показатели функции печени (активность АЛТ, АСТ, концентрацию билирубина в плазме крови).

Необходимо следить за состоянием пациента: медицинский персонал, наблюдающий за больными в стационаре, так же как и члены семьи амбулаторных пациентов, принимающих теризидон, должны быть информированы о возможности развития нежелательных реакций со стороны нервной системы и проинструктированы о необходимости немедленно информировать лечащего врача при появлении депрессии или изменений в поведении пациента.

При тяжелых поражениях печени пиридоксин в больших дозах может вызвать ухудшение ее функции.

При определении уробилиногена с помощью реагента Эрлиха пиридоксин может искажать результаты.

Применение препарата на фоне приема алкоголя сопряжено с повышенной частотой побочных эффектов, вплоть до развития судорог, поэтому во время терапии препаратом необходимо избегать употребления алкоголя.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

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