Ванкорус



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ванкомицин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий в виде порошка от белого до белого с розовым или светло-коричневым оттенком цвета.

	1 фл.
ванкомицин (в форме гидрохлорида)	500 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 0.02 г.

Флаконы вместимостью 10 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы вместимостью 10 мл (50) - коробки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий в виде порошка от белого до белого с розовым или светло-коричневым оттенком цвета.

	1 фл.
ванкомицин (в форме гидрохлорида)	1 г

Вспомогательные вещества: маннитол - 0.04 г.

Флаконы вместимостью 20 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы вместимостью 20 мл (50) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик - гликопептид. Продуцируется Amycolatopsis orientalis.

Действует бактерицидно на большинство чувствительных к нему микроорганизмов (на Enterococcus spp. - бактериостатически). Блокирует синтез клеточной стенки бактерий в участке, отличном от того, на который действуют пенициллины и цефалоспорины (не конкурирует с ними за участки связывания), прочно связываясь с D-аланил-D-аланиновой частью предшественника клеточной стенки, что приводит к лизису бактериальной клетки.

Активен в отношении грамположительных микроорганизмов, включая: Staphylococcus aureus и Staphylococcus epidermidis (включая гетерогенные метициллин-устойчивые штаммы), Streptococcus spp., Enterococcus spp. (в т.ч. Enterococcus faecalis), Clostridium spp. (в т.ч. Clostridium difficile).

К ванкомицину in vitro *чувствительны* Listeria monocytogenes, Lactobacillus spp., Actinomyces spp., Bacillus spp.

Оптимальное действие – при pH 8, при снижении pH до 6 эффект ванкомицина резко уменьшается.

Активно действует только на микроорганизмы, находящиеся в стадии размножения.

Устойчивы к ванкомицину почти все грамотрицательные бактерии, Mycobacterium spp., грибы, вирусы, простейшие.

Не имеет перекрестной резистентности с антибиотиками других групп.

При применении внутрь не оказывает системного действия, действует местно на чувствительную микрофлору в ЖКТ (Staphylococcus aureus, Clostridium difficile).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

C_{max} после в/в инфузии 500 мг – 49 мкг/мл через 30 мин и 20 мкг/мл через 1-2 ч; после в/в инфузии 1 г – 63 мкг/мл через 60 мин и 23-30 мкг/мл через 1-2 ч.

Связывание с белками плазмы – 55%.

Широко распределяется в большинстве тканей и жидкостей организма. Терапевтические концентрации определяются в асцитической, синовиальной, плевральной, перикардиальной и перитонеальной жидкостях, в моче, ткани ушка предсердия. Не проникает через неповрежденный ГЭБ (при менингите обнаруживается в ликворе в терапевтических концентрациях).

Ванкомицин проникает через плаценту. Выделяется с грудным молоком.

При многократном введении возможна кумуляция.

При приеме внутрь плохо абсорбируется и обычно не проникает в системный кровоток. Определяемые плазменные концентрации ванкомицина могут отмечаться в отдельных случаях при многократном приеме внутрь у пациентов с острым псевдомембранозным колитом, вызванным Clostridium difficile.

Метаболизм

Ванкомицин практически не метаболизируется в организме.

Выведение

$T_{1/2}$ при нормальной функции почек: взрослые – около 6 ч (4-11 ч), новорожденные – 6-10 ч, грудные дети – 4 ч, дети более старшего возраста – 2-3 ч.

75-90% препарата выводится почками путем пассивной фильтрации в первые 24 ч.

В небольших и умеренных количествах ванкомицин может выводиться с желчью. В незначительных количествах выводится при гемодиализе или перитонеальном диализе.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ при хронической почечной недостаточности (олигурия или анурия) у взрослых – 6-10 дней.

У пациентов с одной почкой выводится медленно и механизм выведения неизвестен.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к ванкомицину микроорганизмами:

— эндокардит;

— сепсис;

— менингит;

— инфекции нижних дыхательных путей (пневмония, абсцесс легкого);

— инфекции костей и суставов (в т.ч. остеомиелит);

— инфекции кожи и мягких тканей.

В виде раствора для приема внутрь:

— псевдомембранозный колит, вызванный Clostridium difficile;

— энтероколит, вызванный Staphylococcus aureus.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Инфекции
- Колит
- Менингит
- Остеомиелит
- Пневмония
- Сепсис
- Эндокардит
- Энтерит

Противопоказания:

— неврит слухового нерва;

— I триместр беременности;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к ванкомицину.

С *осторожностью* следует применять препарат пациентам с ослабленным слухом, почечной недостаточностью ввиду возможного развития ототоксических и нефротоксических эффектов, пациентам с аллергией на тейкопланин (возможность перекрестной аллергии), беременность (II и III триместр).

Способ применения и дозы:

Ванкомицин вводят в виде медленной в/в инфузии со скоростью не более 10 мг/мин в течение не менее 60 мин.

Препарат нельзя вводить в/м или в/в струйно.

Концентрация приготовленного раствора ванкомицина не должна превышать 5 мг/мл.

Взрослым – по 0.5 г (7.5 мг/кг) каждые 6 ч либо по 1 г (15 мг/кг) каждые 12 ч.

Детям: новорожденным детям до 7 дней жизни – начальная доза 15 мг/кг массы тела, затем - 10 мг/кг каждые 12 ч; начиная **со 2-й недели жизни** – по 10 мг/кг каждые 8 ч; **детям от 1 мес и старше** – по 10 мг/кг каждые 6 ч.

Больным с нарушением выделительной функции почек требуется коррекция режима дозирования с учетом значений клиренса креатинина (КК).

Коррекция может осуществляться путем увеличения интервалов между введениями, либо путем уменьшения разовой дозы препарата:

Коррекция путем увеличения интервалов между введениями

КК (мл/мин)	Доза ванкомицина	Интервал между введениями
более 80	1 г	12 ч
80-50	1 г	1-3 сут
50-10	1 г	3-7 сут
менее 10	1 г	7-14 сут

Коррекция разовой дозы

КК (мл/мин)	Доза ванкомицина (мг/сут)
100	1545
90	1390
80	1235
70	1080
60	925
50	770
40	620
30	465
20	310
10	155

Эту таблицу нельзя применять для определения дозы препарата при анурии. Таким больным следует назначать начальную дозу 15 мг/кг массы тела для быстрого создания терапевтических концентраций препарата в сыворотке. Доза, необходимая для поддержания стабильной концентрации препарата, составляет 1.9 мг/кг/сут.

Больным с выраженной почечной недостаточностью целесообразно вводить поддерживающие дозы 250-1000 мг 1 раз в несколько дней.

При **анурии** рекомендуется доза 1 г каждые 7-14 дней.

Когда известна только концентрация креатинина в сыворотке крови, для вычисления клиренса креатинина можно использовать представленную ниже формулу:

Для мужчин:

КК = масса тела (кг) × (140 – возраст (лет))/72 × концентрация креатинина в сыворотке крови (мг/дл).

Для женщин: полученный результат умножается на 0.85.

Приготовление раствора для в/в введения

Раствор для инъекций готовят непосредственно перед введением препарата. Для этого во флакон с сухим, стерильным препаратом дозировкой 0.5 г добавляют 10 мл, дозировкой 1 г – 20 мл стерильной воды для инъекций (концентрация раствора составляет 50 мг/мл).

Приготовленные растворы ванкомицина перед введением подлежат дальнейшему разведению до концентрации не более 5 мг/мл. Требуемую дозу разведенного вышеуказанным образом ванкомицина следует вводить путем в/в инфузий в течение не менее 60 мин. В качестве растворителей можно использовать 5% раствор декстрозы (глюкозы) для инъекций или 0.9% раствор натрия хлорида для инъекций: для 0.5 г – 100 мл и для 1 г – 200 мл.

Перед инъекцией приготовленный раствор для парентерального введения следует проверять визуально, если это возможно, на наличие механических примесей и изменение цвета.

Растворы, приготовленные на основе 5% раствора декстрозы (глюкозы) или 0.9% раствора натрия хлорида, могут храниться в холодильнике (2-8°C) в течение 14 дней без значительной потери активности.

Приготовление раствора для приема внутрь и его применение

Для *лечения псевдомембранозного колита, вызванного Clostridium difficile, вследствие применения антибиотиков, а также для лечения стафилококкового энтероколита* препарат Ванкорус назначают внутрь.

Суточная доза для **взрослых** – 0.5-2 г, разделенная на 3-4 приема.

Суточная доза для **детей** – 40 мг/кг, разделенная на 3-4 приема.

Максимальная суточная доза для взрослых и детей – 2 г.

Соответствующую разовую дозу растворяют в 30 мл воды и дают больному ее выпить или вводят через зонд. Для улучшения вкуса раствора к нему можно добавлять обычные пищевые сиропы. Продолжительность лечения - 7-10 дней.

Побочное действие:

Постинфузионные реакции (вследствие быстрого введения): анафилактоидные реакции (снижение АД, остановка сердца, бронхоспазм, диспноэ, кожная сыпь, зуд); синдром "красного человека", связанный с высвобождением гистамина (озноб, лихорадка, учащенное сердцебиение, гиперемия верхней половины туловища и лица, спазм мышц грудной клетки и спины).

Со стороны мочевыделительной системы: нефротоксичность (вплоть до развития почечной недостаточности) чаще

при комбинации с аминогликозидами или при назначении более 3 недель в высоких концентрациях, проявляющаяся повышением концентрации креатинина и азота мочевины в крови; интерстициальный нефрит.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, псевдомембранозный колит.

Со стороны органов чувств: ототоксичность – снижение слуха, вертиго, звон в ушах.

Со стороны органов кроветворения: обратимая нейтропения, преходящая тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: лихорадка, озноб, эозинофилия, сыпь (включая эксфолиативный дерматит), злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), васкулит.

Местные реакции (при нарушении правил инфузии): боль и некроз тканей в местах инъекций, флебит.

Передозировка:

Симптомы: усиление выраженности побочных явлений со стороны мочевыделительной системы и органов чувств.

Лечение: проводят симптоматическую терапию. Рекомендуется введение жидкости и контроль плазменных концентраций ванкомицина. Для быстрого удаления избытка ванкомицина из организма гемофильтрация является более эффективной, чем гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности (II и III триместр) препарат назначают только в том случае, если предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода и только пожизненным показаниям.

Ванкомицин выделяется с грудным молоком. На период лечения препаратом следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном в/в введении ванкомицина и местных анестетиков могут появиться эритематозные высыпания и гиперемия кожных покровов лица, у взрослых – нарушение внутрисердечной проводимости.

При одновременном и/или последовательном системном или местном применении других потенциально ототоксичных и/или нефротоксичных препаратов (аминогликозиды, амфотерицин В, аминосалициловая кислота или другие салицилаты, капреомицин, кармустин, циклоспорин, "петлевые" диуретики, в т.ч. этакриновая кислота, полимиксин В, цисплатин) требуется проведение тщательного контроля возможного развития данных симптомов.

Колестирамин снижает активность ванкомицина при его приеме внутрь.

Антигистаминные средства, меклозин, фенотиазины, тиоксантены могут маскировать симптомы ототоксического действия ванкомицина (шум в ушах, вертиго).

Фармацевтическое взаимодействие

Раствор ванкомицина имеет низкий pH, что может вызвать физическую или химическую нестабильность при смешивании с другими растворами. Следует избегать смешивания с щелочными растворами.

Растворы ванкомицина и бета-лактамных антибиотиков являются физически несовместимыми при смешивании.

Вероятность преципитации возрастает с увеличением концентрации ванкомицина. Необходимо адекватно промыть в/в систему между применениями данных антибиотиков. Кроме того, рекомендуется снизить концентрацию ванкомицина до 5 мг/мл и менее.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат предназначен к применению только в условиях стационара.

При применении препарата у грудных детей и недоношенных новорожденных следует регулярно контролировать концентрацию ванкомицина в плазме крови.

Препарат следует вводить инфузионно медленно (не менее 60 мин). Быстрое введение (например, в течение

нескольких минут) ванкомицина может сопровождаться выраженным снижением АД и в редких случаях - остановкой сердца.

Частота возникновения и тяжесть тромбофлебитов может быть уменьшена за счет правильного разведения исходного раствора и чередования мест введения препарата.

При длительном применении ванкомицина необходимо проведение аудиограммы, контролировать картину периферической крови, функцию почек (общий анализ мочи, показатели креатинина и азота мочевины крови).

Желательно определять концентрации ванкомицина в сыворотке крови при почечной недостаточности у пациентов старше 60 лет, поскольку высокие, сохраняющиеся длительное время концентрации ванкомицина в крови могут увеличивать опасность проявления токсического действия препарата (максимальные концентрации не должны превышать 40 мкг/мл, а минимальные - 10 мкг/мл, концентрации свыше 80 мкг/мл считаются токсичными). Для больных с почечной недостаточностью дозы ванкомицина должны подбираться индивидуально.

При нарушениях функции почек

Больным с нарушением выделительной функции почек требуется коррекция режима дозирования с учетом значений клиренса креатинина (КК).

Коррекция может осуществляться путем увеличения интервалов между введениями, либо путем уменьшения разовой дозы препарата:

Коррекция путем увеличения интервалов между введениями

КК (мл/мин)	Доза ванкомицина	Интервал между введениями
более 80	1 г	12 ч
80-50	1 г	1-3 сут
50-10	1 г	3-7 сут
менее 10	1 г	7-14 сут

Коррекция разовой дозы

КК (мл/мин)	Доза ванкомицина (мг/сут)
100	1545
90	1390
80	1235
70	1080
60	925
50	770
40	620
30	465
20	310
10	155

Эту таблицу нельзя применять для определения дозы препарата при анурии. Таким больным следует назначать начальную дозу 15 мг/кг массы тела для быстрого создания терапевтических концентраций препарата в сыворотке. Доза, необходимая для поддержания стабильной концентрации препарата, составляет 1.9 мг/кг/сут.

Больным с выраженной почечной недостаточностью целесообразно вводить поддерживающие дозы 250-1000 мг 1 раз в несколько дней.

При **анурии** рекомендуется доза 1 г каждые 7-14 дней.

Когда известна только концентрация креатинина в сыворотке крови, для вычисления клиренса креатинина можно использовать представленную ниже формулу:

Для мужчин:

КК = масса тела (кг) x (140 – возраст (лет)) ,
72 x конценрация креатинина в сыворотке крови (мг/дл).

Для женщин: полученный результат умножается на 0.85.

Применение в пожилом возрасте

Желательно определять концентрации ванкомицина в сыворотке крови при почечной недостаточности у пациентов старше 60 лет, поскольку высокие, сохраняющиеся длительное время концентрации препарата в крови могут увеличивать опасность проявления токсического действия препарата (максимальные концентрации не должны превышать 40 мкг/мл, а минимальные - 10 мкг/мл, концентрации свыше 80 мкг/мл считаются токсичными). Для больных с почечной недостаточностью дозы ванкомицина должны подбираться индивидуально.

Применение в детском возрасте

При применении препарата у грудных детей и недоношенных новорожденных следует регулярно контролировать концентрацию ванкомицина в плазме крови.

Условия хранения:

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

Растворы, приготовленные на основе 5% раствора декстрозы (глюкозы) или 0.9% раствора натрия хлорида, могут храниться в холодильнике (2-8°C) в течение 14 дней без значительной потери активности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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