МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

КАНАМИЦИН

Торговое название препарата: Канамицин

Международное непатентованное название: канамицин

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для внутримышечного и внутриполостного введения

Состав на один флакон: канамицина дисульфата (в пересчете на канамицин) - 0,5 г, 1,0 г.

Описание: Порошок белого цвета

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик-аминогликозид

Код АТХ [J01GB04]

Фармакодинамика

Антибиотик широкого спектра действия из группы аминогликозидов. В низких концентрациях оказывает бактериостатическое действие (за счет нарушения синтеза белка в микробных клетках), в высоких - бактерицидное (повреждает цитоплазматические мембраны микробной клетки). Проникает в микробную клетку, связывается со специфичными белками-рецепторами на 30S субъединице рибосом. Нарушает образование комплекса транспортной и матричной РНК (30S субъединицей рибосомы) и останавливает синтез протеинов.

Эффективен в отношении большинства грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, а также кислотоустойчивых бактерий: Mycobacterium tuberculosis (в т.ч. устойчивых к стрептомицину, парааминосалициловой кислоте (ПАСК), изониазиду и др. противотуберкулезным препаратам, кроме виомицина), Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Proteus spp., Enterobacter spp., Klebsiella pneumoniae, Neisseria gonorrhoeae et meningitidis, Staphylococcus spp.

Штаммы этих микроорганизмов, устойчивые к тетрациклину, эритромицину, хлорамфениколу, бензилпенициллину, стрептомицину и др., в большинстве случаев сохраняют чувствительность к канамицину.

Не действует на Pseudomonas aeruginosa, Streptococcus spp., Bacteroides spp. и др. анаэробные бактерии, дрожжевые грибы, вирусы и простейшие.

Фармакокинетика

Максимальная концентрация канамицина дисульфата в плазме крови при внутримышечном введении достигается через 0,5-1,5 ч и составляет 22 мкг/мл при дозе препарата 7,5 мг/кг.

Проникает в плевральную полость, лимфатическую, синовиальную и перитонеальную жидкости, сыворотку крови, бронхиальный секрет и желчь. Время достижения максимальной концентрации в желчи – 6 ч. Высокие концентрации обнаруживаются в моче; низкие концентрации - в желчи, грудном молоке, водянистой влаге, бронхиальном секрете, мокроте и спинномозговой жидкости. Хорошо проникает во все ткани организма, где накапливается внутриклеточно; высокие концентрации отмечаются в органах с хорошим кровоснабжением: легкие, печень, миокард, селезенка, и особенно в почках, где накапливается в корковом слое, более низкие концентрации – в мышцах, жировой ткани и костях.

В норме канамицин не проникает через гематоэнцефалический барьер, однако при воспалении мозговых оболочек концентрация препарата в спинномозговой жидкости достигает 30-60 % от таковой в плазме. У новорожденных создаются более высокие концентрации в спинномозговой жидкости, чем у взрослых; проходит через плаценту (обнаруживается в крови плода и амниотической жидкости).

Объем распределения у взрослых – 0,26 л/кг, у детей – 0,2-0,4 л/кг, у новорожденных в возрасте менее 1 нед и массой тела менее 1,5 кг – до 0,68 л/кг, в возрасте менее 1 нед и массой тела более 1,5 кг – до 0,58 л/кг, у больных муковисцидозом – 0,3-0,39 л/кг

Не метаболизируется. Период полувыведения у взрослых составляет 2-4 ч, у новорожденных – 5-8 ч, у детей более старшего возраста – 2,5-4 ч. Конечный период полувыведения – более 100 ч (высвобождение из внутриклеточных депо).

Выводится почками путем клубочковой фильтрации преимущественно в неизмененном виде (70-95 % обнаруживается в моче через 24 ч). Период полувыведения у взрослых при нарушении функции почек варьирует в зависимости от степени нарушения функции до 100 ч, у больных с муковисцидозом – 1-2 ч, у больных с ожогами и гипертермией период полувыведения может быть короче по сравнению со средними показателями вследствие повышенного клиренса.

Выводится при гемодиализе (50 % за 4-6 ч), перитонеальный диализ - менее эффективен (25 % за 48-72 ч).

Показания к применению

Инфекционные заболевания, вызванные чувствительными к канамицину микроорганизмами.

Тяжелые гнойно-септические заболевания: сепсис, менингит, перитонит, септический эндокардит.

Инфекционно-воспалительные заболевания органов дыхания: пневмония, эмпиема плевры, абсцесс легкого.

Инфекции почек и мочевыводящих путей: пиелонефрит, цистит, уретрит.

Гнойные осложнения в послеоперационном периоде, инфицированные ожоги и другие заболевания, вызванные преимущественно грамотрицательными микроорганизмами (Escherichia coli, Enterobacter aerogenes, Serratia, Salmonella spp., Klebsiella pneumoniae, Proteus spp., Shigella spp.), устойчивыми к другим антибиотикам, или ассоциациями грамположительных и грамотрицательных возбудителей.

Туберкулез легких и туберкулезные поражения других органов (в составе комплексной терапии), вызванные микобактериями туберкулеза, устойчивыми к противотуберкулезным препаратам I и II ряда и другим противотуберкулезным препаратам, кроме флоримицина.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к канамицину (в т.ч. к др. аминогликозидам в анамнезе), тяжелая хроническая почечная недостаточность с азотемией и уремией, неврит VIII пары черепных нервов, беременность.

С осторожностью

Миастения, паркинсонизм, ботулизм (аминогликозиды могут вызвать нарушение нервно-мышечной передачи, что приводит к дальнейшему ослаблению скелетной мускулатуры), почечная недостаточность, пожилой возраст, недоношенные дети, период новорожденности (до 1 мес), период грудного вскармливания.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение при беременности противопоказано.

В период грудного вскармливания следует с осторожностью применять препарат, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для ребенка.

Способ применения и дозы

Внутримышечно.

Перед введением содержимое флакона 0,5 г или 1,0 г растворяют соответственно в 2 или 4 мл воды для инъекций или 0,25-0,5 % раствора прокаина (Новокаина).

Для лечения инфекций нетуберкулезной этиологии разовая доза при внутримышечном введении для взрослых составляет 0,5 г, суточная – 1-1,5 г (по 0,5 г каждые 8-12 ч). Максимальная суточная доза – 2 г (по 1 г через 12 часов).

Продолжительность лечения – обычно 5-7 дней в зависимости от тяжести и особенности течения процесса.

Детям первого месяца жизни и недоношенным – только по «жизненным» показаниям вводят в суточной дозе 15 мг/кг.

Детям в возрасте от 1 мес. до 1 года вводят в средней суточной дозе 0,1 г, от 1 до 5 лет – 0,3 г, старше 5 лет – 0,3-0,5 г. Максимальная суточная доза составляет 15 мг/кг. Суточная доза делится на 2-3 введения. Продолжительность лечения – обычно 5-7 дней в зависимости от тяжести и особенности течения процесса.

При почечной недостаточности схема введения корректируется путем уменьшения доз или увеличения интервалов между введениями.

Для расчета интервалов между инъекциями с учетом степени поражения функции почек может быть рекомендована следующая формула: интервал между введениями в часах равен содержанию креатинина в плазме крови (мг/100 мл) х 9.

Расчет доз:

Первоначальная доза рассчитывается с учетом массы тела (доза в мг = масса тела х 7)

$$\text{Последующие дозы} = \frac{\text{Первоначальная доза}}{\text{Содержание креатинина в сыворотке крови (мг/100 мл) при кратности введения 2-3 раза в сутки}}$$

В дни гемодиализа после его проведения дополнительно вводят разовую дозу препарата.

При лечении туберкулеза (в составе комплексной терапии) вводят взрослым 1 раз в сутки в дозе 1 г или по 0,5 г 2 раза в день, детям – по 15 мг/кг/сут, но не более 0,5-0,75 г 6 дней в неделю с перерывом на 7 день. Число циклов и общая продолжительность лечения определяется стадией и особенностями течения заболевания и составляет 1 месяц.

Во избежание передозировки препарата рекомендуется периодически контролировать концентрацию антибиотика в крови больного.

Внутриполостно.

При перитоните: в брюшную полость для промываний вводят по 10-50 мл 0,25 % водного раствора; внутрибрюшинно – по 500 мг (в виде 2,5 % водного раствора); при проведении перитонеального диализа растворяют 1-2 г в 500 мл диализирующей жидкости.

При эмпиеме плевры: в плевральную полость для промываний вводят по 10-50 мл 0,25 % водного раствора.

В полость абсцесса для промываний вводят по 10-50 мл 0,25 % водного раствора.

Суточная доза при внутриполостном введении не должна превышать суточную дозу для внутримышечного введения.

Продолжительность внутриполостного введения определяется особенностями течения заболевания.

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, диарея, нарушение функции печени (повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия).

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

Со стороны нервной системы: головная боль, сонливость, слабость, нейротоксическое действие (подергивание мышц, ощущение онемения, покалывания, парестезии, эпилептические припадки), возможно нарушение нейромышечной передачи (остановка дыхания).

Со стороны органов чувств: ототоксичность (звон или ощущение закладывания в ушах, снижение слуха вплоть до необратимой глухоты), токсическое действие на вестибулярный аппарат (дискоординация движений, головокружение, тошнота, рвота).

Со стороны мочевыделительной системы: нефротоксичность - нарушение функции почек (увеличение или уменьшение частоты мочеиспускания, жажда, цилиндрурия, микрогематурия, альбуминурия).

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, гиперемия кожи, лихорадка, отек Квинке.

Передозировка

Симптомы: токсические реакции (потеря слуха, атаксия, головокружение, расстройства мочеиспускания, жажда, снижение аппетита, тошнота, рвота, звон или ощущение закладывания в ушах, нарушение дыхания).

Лечение: для снятия блокады нервно-мышечной передачи и ее последствий - гемодиализ или перитонеальный диализ, ингибиторы холинэстеразы, соли кальция, искусственная вентиляция легких, др. симптоматическая и поддерживающая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Фармацевтически несовместим со стрептомицином, гентамицином, пенициллинами, гепарином, цефалоспоринами, капреомицином, амфотерицином В, эритромицином, нитрофурантоином, виомицином.

Налидиксовая кислота, полимиксин, цисплатин и ванкомицин увеличивают риск развития ото- и нефротоксичности.

Бета-лактамные антибиотики (цефалоспорины, пенициллины) у больных с тяжелой хронической почечной недостаточностью снижают эффект аминогликозидов.

Диуретики (особенно фуросемид), цефалоспорины, пенициллины, сульфаниламиды и нестероидные противовоспалительные препараты, конкурируя за активную секрецию в

канальцах нефрона, блокируют элиминацию аминогликозидов, повышают их концентрацию в сыворотке крови, усиливая нефро- и нейротоксичность.

Парентеральное введение индометацина увеличивает риск развития токсического действия канамицина (увеличение периода полувыведения и снижение клиренса).

Снижает эффект антимиастенических лекарственных средств. Усиливает миорелаксирующее действие недеполяризующих миорелаксантов, общих анестетиков и полимиксинов.

Метоксифлуран, полимиксины для парентерального введения и другие лекарственные средства, блокирующие нервно-мышечную передачу (галогенизированные углеводороды в качестве препаратов для ингаляционной анестезии, наркотические анальгетики, переливание больших количеств крови с цитратными консервантами), увеличивают риск возникновения нефротоксического действия и остановки дыхания (в результате усиления нервно-мышечной блокады).

Циклопропан увеличивает риск развития апноэ при внутрибрюшинном введении канамицина.

Особые указания

В период лечения необходимо не реже 1 раза в неделю контролировать функцию почек, улиткового нерва и вестибулярного аппарата.

Вероятность развития нефротоксичности выше у больных с нарушением функции почек, а также при применении высоких доз или в течение длительного времени (у этой категории больных может потребоваться ежедневный контроль функции почек).

При неудовлетворительных аудиометрических тестах дозу препарата снижают или прекращают лечение.

Аминогликозиды проникают в грудное молоко в небольших количествах (поскольку они плохо всасываются из желудочно-кишечного тракта, связанных с ними осложнений у грудных детей зарегистрировано не было).

Пациентам с инфекционно-воспалительными заболеваниями мочевыводящих путей рекомендуется принимать повышенное количество жидкости.

При отсутствии положительной клинической динамики следует помнить о возможности развития резистентных микроорганизмов. В подобных случаях необходимо отменить лечение и начать проведение соответствующей терапии.

Влияние на управление транспортными средствами и механизмами.

Необходимо соблюдать осторожность при выполнении работ, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторной реакции.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для внутримышечного и внутриполостного введения 0,5 г, 1 г.

По 0,5 г и 1 г активного вещества во флаконы вместимостью 10 мл.

1, 5 или 10 флаконов с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

50 флаконов помещают в коробку из картона с равным количеством инструкций по применению для поставки в стационары.

Условия хранения

В сухом месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

4 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии

Открытое акционерное общество "Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий "Синтез" (ОАО "Синтез").

640008, Россия, г. Курган, проспект Конституции, 7

Тел./факс: (3522) 48-16-89

E-mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: http://www.kurgansintez.ru

Представитель фирмы



В.И. Петухов