МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП - 003312 - 161115
СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПИПЕМИДОВАЯ КИСЛОТА

Регистрационный номер: _____

Торговое наименование: Пипемидовая кислота

Международное непатентованное наименование: пипемидовая кислота

Лекарственная форма: капсулы

Состав на одну капсулу

Активное вещество: пипемидовой кислоты тригидрат - 236 мг (в пересчёте на пипемидовую кислоту) - 200 мг.

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1,5 мг, магния стеарат - 3 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (примогель, натрия гликолят крахмала) - 15 мг, лактозы моногидрат (сахар молочный)* - 44,5 мг.

*Количество лактозы моногидрата может меняться в зависимости от содержания активного вещества в субстанции пипемидовой кислоты тригидрата.

Состав желатиновой капсулы:

Желатин - до 100 %; крышка: титана диоксид - 2,1 %, бриллиантовый голубой - 0,13 %, жёлтый хинолиновый - 0,19 %; корпус: титана диоксид - 2,2 %.

Описание: твёрдые желатиновые капсулы № 1 с белым корпусом и зелёной крышкой. Содержимое капсул - порошок от белого с желтоватым оттенком до светло-жёлтого цвета, допускается комкование порошка.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство - хинолон.

Код АТХ: J01MB04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Относится к группе хинолоновых препаратов и применяется при лечении инфекций мочевыводящих путей, вызываемых чувствительными к пипемидовой кислоте возбудителями.

Пипемидовая кислота подавляет бактериальную ДНК-топоизомеразу II, что приводит к дезинтеграции бактериальной ДНК. Такое действие более выражено в отношении

микроорганизмов, которые находятся в фазе пролиферации. Высокие концентрации пипемидовой кислоты ингибируют как синтез РНК, так и синтез бактериальных белков.

Препарат оказывает бактерицидное действие на большинство грамотрицательных аэробных микроорганизмов (Proteus vulgaris, Proteus mirabilis, Klebsiella pneumoniae, Pneudomonas aeruginosa, Escherichia coli, Neisseria spp. и др.).

Процент возникновения устойчивости составляет от 10 % (Escherichia coli, Staphylococcus aureus) до 62 % (Pneudomonas aeruginosa). Грамположительные микроорганизмы обладают устойчивостью к пипемидовой кислоте. Не активен в отношении анаэробов.

Пипемидовая кислота создаёт высокие концентрации в моче, активность усиливается при ощелачивании мочи.

Фармакокинетика

После перорального применения быстро всасывается, биодоступность составляет 30-60 %. После приёма внутрь в дозе 400 мг максимальная концентрация пипемидовой кислоты (3,5 мкг/мл) достигается через 70-80 минут.

Связывание с белками плазмы составляет приблизительно 30 % и зависит от концентрации пипемидовой кислоты в сыворотке крови.

Высокие концентрации пипемидовой кислоты создаются в почках, моче и жидкости предстательной железы. Пипемидовая кислота, как и другие хинолоновые соединения, проникает через плаценту и в следовых количествах в материнское молоко. Пипемидовая кислота большей частью выделяется из организма через почки в неизменной форме. В суточной моче определяется 50-85 % введённой дозы препарата. Выделение пипемидовой кислоты находится в прямой зависимости от клиренса креатинина. Период полувыведения препарата при нормальной функции почек составляет 2 часа 15 минут, а общий клиренс 6,3 мл/мин. У больных с нарушениями функций почек отмечаются несколько более высокие концентрации пипемидовой кислоты в плазме крови, чем у здоровых добровольцев. Период полувыведения из плазмы крови несколько удлинён и составляет 5,7-16 часов.

Показания к применению

Острые и хронические/инфекционно-воспалительные заболевания мочевыводящих путей, вызванные чувствительными к пипемидовой кислоте микроорганизмами, в том числе: пиелонефрит, цистит, простатит.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к пипемидовой кислоте или любому из компонентов препарата;
- тяжёлые нарушения функции печени (в т.ч. цирроз);

- тяжёлые нарушения функции почек (клиренс креатинина (КК) < 10 мл/мин;
- заболевания центральной нервной системы (эпилепсия и другие неврологические состояния с пониженным судорожным порогом);
- порфирия;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- аллергические реакции на хинолоны в анамнезе;
- беременность и период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет (период формирования и роста скелета).

С осторожностью

- пациенты с почечной недостаточностью (КК > 10 и < 30 мл/мин);
- пожилой возраст (старше 70 лет);
- нарушение мозгового кровообращения;
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата при беременности противопоказано.

Пипемидовая кислота выделяется с грудным молоком, поэтому при назначении препарата в период лактации, грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь.

Средняя суточная доза составляет 800 мг, разделённые на 2 приёма, т.е. 400 мг (2 капсулы) каждые 12 часов, утром и вечером перед едой, запивая водой.

Курс лечения составляет в среднем 10 дней. При необходимости курс лечения может быть продлён в зависимости от течения заболевания, но не более, чем до 4 недель.

Лечение цистита у женщин длится 3 дня. У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК > 10 и < 30 мл/мин) доза должна быть снижена. У пациентов пожилого возраста с нормальной функцией почек, а также пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степенью тяжести коррекции дозы не требуется.

Во время терапии больному рекомендуется обильное питьё.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, псевдомембранозный колит, гастралгия анорексия, изжога, вздутие живота или боли в животе, запор.

Со стороны нервной системы: нарушение зрения, вертиго, головная боль, возбуждение, депрессия, спутанность сознания, галлюцинации, тремор, продолжительные судороги, связанные с отеком головного мозга, расстройства сна, сенсорные нарушения.

Со стороны кожных покровов: зуд, сыпь, фотосенсибилизация с эритемой, токсический эпидермальный некролиз.

Лабораторные показатели: гемолитическая анемия (у пациентов с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы), эозинофилия, обратимая тромбоцитопения (у пациентов пожилого возраста и у пациентов с почечной недостаточностью).

Прочие: суперинфекции, острая артропатия, тендинит.

Передозировка

Не имеется сообщений о летальном исходе или возникновении угрожающих жизни побочных эффектов вследствие передозировки препарата. Специфического антидота не существует.

Симптомы: тошнота, рвота, головокружение, головная боль, спутанность сознания, тремор, судороги.

Лечение: промывание желудка после недавнего приёма (менее 4 часов), приём активированного угля, форсированный диурез, гемодиализ, при появлении побочных эффектов со стороны нервной системы (включая эпилептические судороги) назначают симптоматическую терапию (диазепам).

В случае передозировки пациент должен находиться под наблюдением врача.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Пипемидовая кислота вызывает ингибирование фермента Р450, в связи с чем при одновременном применении с пипемидовой кислотой замедляется метаболизм теофиллина и кофеина. Период полувыведения теофиллина увеличивается при одновременном применении пипемидовой кислоты, его концентрация в сыворотке крови увеличивается на 40-80 %. Необходимо контролировать концентрацию теофиллина в плазме крови во время применения пипемидовой кислоты. На фоне применения пипемидовой кислоты, как и других антибиотиков хинолонового ряда, отмечается повышение концентрации кофеина в сыворотке крови (в 2-4 раза).

Антациды и сукральфат значительно замедляют абсорбцию пипемидовой кислоты. Интервал между приёмом данных препаратов должен составлять не менее 2-3 часов. В то же время подобный эффект не наблюдался при одновременном применении циметидина и ранитидина.

Пипемидовая кислота может усиливать антикоагулянтный эффект варфарина при одновременном приеме. При одновременном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами возможно возникновение судорог.

При комбинированном приёме с аминогликозидами наблюдается синергизм в от ношении бактерицидного действия.

Особые указания

Побочные эффекты в большинстве случаев слабые и преходящие, как правило, не требующие отмены препарата. При появлении аллергических реакций к препарату необходимо прекратить его применение.

В процессе лечения следует избегать ультрафиолетового облучения в связи с высоким риском возникновения фотосенсибилизации. У пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы может развиваться гемолитическая анемия.

При длительном применении препарата следует следить за общими показателями крови, определять функции печени и почек и повторять определение чувствительности микрофлоры к препарату.

В течение курса лечения необходимо увеличить количество потребляемой жидкости (под контролем диуреза).

С осторожностью назначать пациентам старше 70 лет (из-за повышенной частоты возникновения побочных эффектов у лиц пожилого возраста) и пациентам с нарушением функции почек (КК > 10 и < 30 мл/мин) (противопоказано при олигурии и анурии, КК < 10 мл/мин), требуется коррекция дозы и регулярный мониторинг состояния пациента.

Соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам, имеющим в анамнезе нарушение мозгового кровообращения (в том числе кровоизлияние в головной мозг, спазмы сосудов головного мозга), а также судороги.

Может отмечаться ложноположительная реакция на глюкозу мочи при использовании реактива Бенедикта или раствора Феллинга. Рекомендуется использовать ферментативные реакции с глюкозооксидазой.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения пациент должен воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Капсулы 200 мг.

По 10 капсул в контурной ячейковой упаковке из плёнки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 40, 60, 80 капсул в банках полимерных.

Свободной пространство в банках при отсутствии уплотнителя пробки заполняют ватой медицинской гигроскопической.

Каждая банка или 1, 2, 4, 6, 8 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению в пачке из картона.

Условия хранения

В защищённом от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения:

ООО "ВЕЛФАРМ".

125373, Россия, г. Москва, б-р Яна Райниса, д. 43, корп. 1, пом. II, комн. 4, этаж 2

Производитель/Организация, принимающая претензии/Место производства:

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 С. Перминова