

ИНСТРУКЦИЯ
(информация для специалиста)
по медицинскому применению препарата
КОКСЕРИН

Регистрационный номер:

Торговое название: Коксерин

Международное непатентованное название: циклосерин

Лекарственная форма: капсулы

Состав:

Активное вещество: циклосерин 250 мг

Вспомогательные вещества: магния оксид легкий, магния оксид тяжелый, тальк очищенный.

Состав желатиновой капсулы: метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, натрия лаурилсульфат, вода дистиллированная, краситель солнечный закат желтый, краситель азорубин, краситель бриллиантовый голубой, титана диоксид, желатин.

Описание: Твёрдые желатиновые капсулы №1, с корпусом и крышечкой бордово-коричневого цвета, содержащие порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

Фармгруппа: антибиотик.

Код АТС: J04AB01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Циклосерин, бактерицидный антибиотик широкого спектра действия, ингибирует синтез клеточной оболочки чувствительных штаммов грамположительных и грамотрицательных бактерий и *Mycobacterium tuberculosis*.

Фармакокинетика

Циклосерин быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) после приёма внутрь, создавая обнаруживаемые уровни в плазме в течение одного часа. Он свободно распределяется по жидкостям и тканям организма.

Циклосерин проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ), уровни в цереброспинальной жидкости примерно такие же, как и в плазме. У больных туберкулёзом циклосерин обнаруживался в мокроте, а также в плевральной и асцитической жидкостях, в желчи, амниотической жидкости и в крови плода, в грудном молоке, тканях лёгких и в лимфоидной ткани.

Циклосерин выводится почками путем клубочковой фильтрации. В моче обнаруживается через полчаса после приёма дозы, около 66 % выводится в неизменённом виде в течение 24 часов, 10 % - в течение следующих 48 часов. С калом выводится незначительное количество. Около 35 % метаболизируется, но метаболиты до настоящего времени не идентифицированы.

Период полувыведения циклосерина колеблется в пределах 8-12 часов.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Циклосерин применяется как для лечения туберкулёза лёгких в активной форме, так и для лечения внелёгочного туберкулёза (включая поражение почек) при условии чувствительности микроорганизмов к этому препарату и после неудачного адекватного лечения основными лекарственными препаратами (рифампицином, изониазидом, стрептомицином и этамбутолом). Циклосерин следует использовать в сочетании с другими противотуберкулезными средствами.

Циклосерин эффективен при острых инфекциях мочевыводящих путей, вызванных чувствительными штаммами грамположительных и грамотрицательных бактерий, в особенности видами *Klebsiella/Enterobacter* и *Escherichia coli*. Применять циклосерин для лечения этих инфекций следует только после того, как исчерпаны все обычные средства лечения и когда определена чувствительность микроорганизмов к данному лекарственному препарату.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Циклосерин противопоказан в следующих случаях: повышенная чувствительность к циклосерину, органические заболевания центральной нервной системы, эпилептические



принадки (в т.ч. в анамнезе), депрессия, выраженные состояния возбуждения или психозы, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 50 мл/мин), злоупотребление алкоголем и наркотиками, беременность, период лактации, острая и хроническая сердечная недостаточность, детский возраст до 3-х лет, дети с массой тела менее 25 кг.

С осторожностью: детский возраст.

Применение в период кормления грудью.

Концентрации в материнском молоке приближаются к концентрациям, обнаруживаемым в сыворотке. Решение об отмене кормления грудью или прекращения лечения препаратом необходимо принимать с учётом значения лечения препаратом для матери.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутри непосредственно перед приемом пищи (при раздражении желудочно-кишечного тракта - после еды).

Взрослые. Обычная доза составляет от 500 мг до 1 г (из расчета 12,5 мг/кг массы тела) в сутки при приеме от 2 до 3 раз в день под контролем уровня препарата в крови. Начальная доза для взрослых 250 мг на 2 приема с 12-ти часовым интервалом в течение первой недели. Суточная доза не должна превышать 1 г.

Дети. Обычная начальная доза составляет от 10 мг/кг массы тела/сутки в 1-2 приема. Суточная доза не должна превышать 750 мг.

Пожилые. Пациентам старше 60 лет, а также с массой тела менее 50 кг - по 250 мг 2 раза в сутки.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Большинство побочных эффектов, наблюдавшихся во время лечения циклосерином, было связано с нарушением функции центральной нервной системы или являлось проявлениями повышенной чувствительности к препарату.

Со стороны центральной нервной системы: судороги, бессонница или сонливость, головная боль, тремор, дизартрия, головокружение, спутанность сознания и нарушение ориентации, сопровождавшиеся потерей памяти, психозы, возможно с попытками самоубийства, изменения характера, повышенная раздражительность, агрессивность, периферические парезы, гиперрефлексия, парестезия, большие и малые приступы клонических судорог и кома.

К другим установленным побочным эффектам относятся - аллергические реакции (кожная сыпь, зуд), мегалобластная анемия и увеличение уровня аминотрансфераз печени, тошнота, изжога, диарея, в особенности у пожилых больных с ранее существовавшими заболеваниями печени, лихорадка, усиление кашля. Отмечалось обострение хронической сердечной недостаточности у больных, принимавших от 1 до 1,5 г циклосерина в сутки.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Признаки и симптомы. Острое отравление может наблюдаться, при применении больным с нарушенной функцией почек (см. разделы «Противопоказания» и «Особые указания») или если взрослый больной принял внутрь более 1 г препарата. Обычно токсические эффекты встречаются со стороны центральной нервной системы. Они могут включать головную боль, головокружение, спутанность сознания, повышенную раздражительность, парестезию, дизартрию и психозы. При употреблении высоких доз могут наблюдаться периферические парезы, судороги и кома.

Этанол может увеличивать опасность развития эпилептических припадков.

Лечение: симптоматическое, активированный уголь, противоэпилептические лекарственные средства. Для профилактики нейротоксических эффектов вводят пиридоксин в дозе 200-300 мг/сут, противосудорожные и седативные средства

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Циклосерин способствует снижению резистентности к изониазиду, стрептомицину и ПАСК.

Увеличивает скорость выведения пиридоксина гидрохлорида почками (возможно развитие периферического неврита), что требует дополнительного введения пиридоксина.

Сообщается о том, что одновременное введение этионамида потенцирует нейротоксические эффекты препарата.

Этанол и циклосерин несовместимы, в особенности при лечении высокими дозами

циклосерина. Алкоголь увеличивает возможность и опасность эпилептических припадков. Больные, получающие цикloserин и изониазид, должны находиться под наблюдением врача, так как при этих комбинациях возможно усиление токсического действия на ЦНС (головокружение, сонливость). Может потребоваться корректировка дозы.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Перед началом лечения цикloserином необходимо выделить культуры микроорганизмов и определить чувствительность штаммов к цикloserину.

Больные, получающие более 500 мг цикloserина в сутки, должны находиться под непосредственным наблюдением врача из-за возможного развития побочных эффектов со стороны центральной нервной системы.

Отравление обычно наблюдается при передозировке или нарушении клиренса почек.

При лечении пациентов со сниженной функцией почек, принимающих суточную дозу более 500 мг и у которых предположительно обнаруживаются признаки и симптомы передозировки, необходимо еженедельно контролировать функцию почек (уровень креатинина и азота мочевины в крови).

При приеме препарата следует контролировать ЭЭГ, гематологические показатели (концентрация цикloserина не должна превышать 30 мкг/мл), выделительную функцию почек и состояние функции печени.

Лечение цикloserином необходимо отменить или следует уменьшить дозу, если у больного развиваются аллергический дерматит или симптомы поражения центральной нервной системы, например, судороги, психоз, сонливость, спутанность сознания, гиперрефлексия, головная боль, тремор, головокружение, периферические парезы или дизартрия.

Противосудорожные или седативные препараты могут быть эффективными для профилактики симптомов поражения центральной нервной системы, например, судорог, состояния возбуждения или тремора.

Для профилактики побочных нейротоксических эффектов назначают психотропные препараты бензодиазепинового ряда - диазепам (5 мг) или феназепам (1 мг) на ночь; ноотропные препараты - пирацетам по 800 мг 2 раза в сутки, пиридоксин, глутаминовую кислоту 0,5 г 3 раза в сутки до еды.

В некоторых случаях применение цикloserина и других противотуберкулезных препаратов может вызвать недостаточность витамина В₁₂ и фолиевой кислоты в организме, развитие мегалобластной анемии. В случае возникновения анемии во время лечения необходимо провести соответствующее обследование и лечение больного.

Влияние на способность вождения автомобиля и использования механизмов

Не установлено.

ФОРМА ВЫПУСКА

Капсулы, 250 мг

4 капсулы в стрипы из фольги алюминиевой. По 1 стрипу вкладывают в пластиковый пакет вместе с силикагелем. По 1 пластиковому пакету со стрипом и силикагелем помещают в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

4 капсулы в стрипы из фольги алюминиевой. По 1 стрипу вкладывают в пластиковый пакет вместе с силикагелем. По 15 пластиковых пакетов со стрипом и силикагелем помещают в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

10 капсул в стрипы из фольги алюминиевой. По 1 стрипу вкладывают в пластиковый пакет вместе с силикагелем. 10 пластиковых пакетов со стрипами и силикагелем помещают в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Список Б.

В сухом месте, при температуре не выше 25°C.

Хранить в местах, недоступных для детей.

СРОК ГОДНОСТИ

2 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

"Маклеодз Фармасьютикалз Лтд.", Индия.

Атланта Аркад, Андери (Ист), Мумбай – 400059, Индия

Контактные данные для справок и рекламаций

123098, г. Москва, ул. Гамалеи, д. 19, кор.2, 1 этаж.

тел. (499)702-43-80, (499)193-71-11, (499)190-97-10

факс (495)942-52-81

e-mail: info@atcl.ru

Представитель фирмы



Раджеш Шарма

И.О. Директора Института
доклинической и клинической
экспертизы лекарственных средств



А. Н. Васильев