Инструкция по применению
Итраконазол-Акос Капсулы 100 мг 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: Биоком
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Итраконазол
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 100 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Итраконазол

Состав

1 капсула содержит: Активное вещество: итраконазол 100 мг. Вспомогательные вещества: пеллеты нейтральные (сахарные шарики), сахароза, гипромеллоза-Е (HPME-E), повидон К-30, пропиленгликоль 20 000, сополимер метил-, диметиламиноэтил- и бутилметакрилата (эудрагит Е-100). Состав оболочки: метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, желатин, краситель Понсо 4R (Е124), краситель солнечный закат желтый (Е110), титана диоксид (Е171).

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) достаточно полно. Прием итраконазола в капсулах сразу после еды увеличивает биодоступность. Прием его в виде раствора натощак приводит к более высокой скорости достижения Cmax и большей величине концентрации равновесной фазы (Css) по сравнению с приемом после еды (на 25%). Время достижения Cmax при приеме капсул - около 3-4 ч. Css при приеме 100 мг препарата 1 раз в сут – 0.4 мкг/мл; при приеме 200 мг 1 раз в сут -1.1 мкг/мл, 200 мг 2 раза в сут - 2 мкг/мл. Время достижения Cmax при приеме раствора - около 2 ч при приеме натощак и 5 ч - после еды. Время наступления Css в плазме при длительном применении - 1-2 недели. Связь с белками плазмы - 99.8%. Хорошо проникает в ткани и органы (в т.ч. в слизистую оболочку влагалища), содержится в секрете сальных и потовых желез. Концентрация итраконазола в легких, почках, печени, костях, желудке, селезенке, скелетных мышцах в 2-3 раза превышает его концентрацию в плазме; в тканях, содержащих кератин, - в 4 раза. Терапевтическая концентрация итраконазола в коже сохраняется в течение 2-4 недель после прекращения 4 недельного курса лечения. Терапевтическая концентрация в кератине ногтей достигается через 1 неделю после начала лечения и сохраняется в течение 6 месяцев после завершения 3 месячного курса лечения. Низкие концентрации определяются в сальных и потовых железах кожи. Метаболизируется в печени с образованием активных метаболитов, в т. ч. гидроксиитраконазола. Является ингибитором изоферментов CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. Выведение из плазмы — двухфазное: почками в течение 1 недели (35% в виде метаболитов, 0.03%— в неизмененном виде) и через кишечник (3-18% в неизмененном виде). T1/2 - 1-1.5 дня. Не удаляется при проведении диализа.

Показания

Микозы кожи, слизистой оболочки полости рта и глаз; онихомикозы, вызванные дерматофитами, дрожжевыми и плесневыми грибами; кандидоз с поражением кожи и слизистых, в т.ч.вульвовагинальный кандидоз; отрубевидный лишай; системные микозы, в т.ч. аспергиллез (при резистентности или плохой переносимости амфотерицина В), криптококкоз (в т.ч. криптококковый менингит), гистоплазмоз, споротрихоз, паракокцидиоидомикоз, бластомикоз.

Способ применения и дозы

Внутрь. Сразу после еды. Капсулы проглатывают целиком. Выведение препарата итраконазол из кожи и ногтевой ткани осуществляется медленнее, чем из плазмы. Таким образом, оптимальные клинические и микологические эффекты достигаются через 2-4 недели после окончания лечения при инфекциях кожи и через 6-9 месяцев после окончания лечения ногтевых инфекций. Продолжительность лечения может быть скорректирована в зависимости от клинической картины лечения: при вульвовагинальном кандидозе - 200 мг 2 раза в сутки в течение 1 дня или 200 мг 1 раз в сутки в течение 3 дней; при дерматомикозах - 200 мг 1 раз в сутки в течение 7 дней или 100 мг 1 раз в сутки в течение 15 дней; поражения высококератинизированных участков кожи (дерматофития стоп и кистей) -200 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней или 100 мг 1 раз в сутки в течение 30 дней; при отрубевидном лишае - 200 мг 1 раз сутки в течение 7 дней; при кандидозе слизистой оболочки полости рта - 100 мг 1 раз в сутки в течение 15 дней (в некоторых случаях у иммунокомпромитированных лиц биодоступность итраконазола может снижаться, что иногда требует удвоения дозы); при кератомикозах - 200 мг 1 раз в сутки в течение 21 дня (длительность лечения зависит от клинического ответа); при онихомикозе - 200 мг 1 раз в сутки в течение 3 месяцев или 200 мг 2 раза в сутки в течение 1 недели на курс; при поражении ногтей на ногах (независимо от наличия поражения ногтей на руках) проводят 3 курса с интервалом 3 недели. При поражении ногтей только на руках проводят 2 курса с интервалом 3 недели; элиминация итраконазола из кожи и ногтей медленная; оптимальный клинический ответ при дерматомикозах достигается через 2-4 месяца после завершения лечения, при онихомикозах - 6-9 месяцев; при системном аспергиллезе - 200 мг/сут в течение 2-5 месяцев; при прогрессировании и диссеминации заболевания дозу увеличивают до 200 мг 2 раза в сутки; при системном кандидозе - 100-200 мг 1 раз в сутки в течение 3 недель - 7 месяцев, при прогрессировании и диссеминации заболевания дозу увеличивают до 200 мг 2 раза в сутки; при системном криптококкозе без признаков менингита - 200 мг 1 раз в сутки в течение 2-12 месяцев. При криптококковом менингите - 200 мг 2 раза в сутки в течение 2-12 месяцев. лечение гистоплазмоза начинают с 200 мг 1 раз в сутки, поддерживающая доза - 200 мг 2 раза в сутки в течение 8 месяцев; при бластомикозе - 100 мг 1 раз в сутки, поддерживающая доза - 200 мг 2 раза в сутки в течение 6 месяцев; при споротрихозе - 100 мг 1 раз в сутки в течение 3 месяцев; при паракокцидиоидозе - 100 мг 1 раз в сутки в течение 6 месяцев; при хромомикозе -100-200 мг 1 раз в сутки в течение 6 месяцев; детям назначают, если ожидаемая польза превышает потенциальный риск.

Противопоказания

Гиперчувствительность, хроническая сердечная недостаточность, в т.ч. в анамнезе (за исключением терапии жизнеугрожающих состояний); одновременный прием субстратов изофермента CYP3A4, удлиняющих интервал QT(астемизол, бепридил, цизаприд, дофетилид, левацетилметадол, мизоластин, пимозид, хинидин, сертнидол, терфенадин); ингибиторы ГМГ-КоА редуктазы, метаболизирующиеся изоферментом CYP3A4 (ловастатин, симвестатин); одновременный пероральный прием триазолама и мидазолама, алкалоидов спорыньи (дигидроэрготамин, эргометрин, эрготамин, метилэрготамин), нисолдипина, элетриптана; беременность, период лактации.

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказан во время беременности и в период лактации.

Побочные действия

Со стороны желудочно-кишечного тракта: диспепсия (тошнота, рвота, диарея, запор, снижение аппетита), боль в животе.Со стороны гепато-билиарной системы: обратимое повышение «печеночных» ферментов, гепатит, в очень редких случаях при применении Итраконазола развивалось тяжелое токсическое поражение печени, в том числе случаи острой печеночной недостаточности с летальным исходом.Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, периферическая нейропатия.Со стороны иммунной системы: анафилактические, анафипактоидные и аллергические реакции.Со стороны кожных покровов: в очень редких случаях - мультиформная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона) кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, ангионевротический отек, алопеция, светочувствительность. Прочие: нарушения менструального цикла, гипокалиемия, отечный синдром, хроническая сердечная недостаточность и отек легких.

Передозировка

Данные отсутствуют. При случайной передозировке следует применять поддерживающие меры. В течение первого часа провести промывание желудка и, если это необходимо, назначить активированный уголь. Итраконазол не выводится при гемодиализе. Какого-либо специфического антидота не существует.

Взаимодействие с другими препаратами

1. Лекарственные средства, оказывающие влияние на абсорбцию итраконазола Лекарственные средства, уменьшающие кислотность желудка, снижают абсорбцию итраконазола, что связано с растворимостью оболочек капсул.2. Лекарственные средства, оказывающие влияние на метаболизм итраконазола. Итраконазол в

основном метаболизируется изоферментом CYP3A4. Было изучено взаимодействие итраконазола с рифампицином, рифабутином и фенитоином, являющимися мощными индукторами изофермента CYP3A4. Исследованием было установлено, что в этих случаях бнодоступность итраконазола и пирокснитраконазола значительно снижается, что приводит к существенному уменьшению эффективности препарата. Одновременное применение итраконазола с данными препаратами, являющимися потенциальными индукторами микросомальных ферментов печени, не рекомендуется. Исследования взаимодействия с другими индукторами микросомальных ферментов печени, такими как карбамазепин, фенобарбитал и изониазид, не проводились, однако, аналогичные результаты можно предположить. Мощные ингибиторы изофермента CYP3A4, такие как ритонавир, индинавир, кларитромицин и эритромицин, могут увеличивать биодоступность итраконазола.3. Влияние итраконазола на метаболизм других лекарственных средств. Итраконазол может ингибировать метаболизм препаратов, расщепляемых изоферментом CYP3A4. Результатом этого может быть усиление или пролонгирование их действия, в том числе и побочных эффектов. Перед началом приема сопутствующих лекарственных препаратов, необходимо проконсультироваться с лечащим врачом по поводу путей метаболизма данного препарата, указанных в инструкции по медицинскому применению. После прекращения лечения концентрации итраконазола в плазмеснижаются постепенно в зависимости от дозы и длительности. Это необходимо принимать во внимание при обсуждении мигрирующего эффекта итраконазола на сопутствующие лекарственные средства.Примерами таких лекарств являются: Препараты, которые нельзя назначать одновременно с итраконазолом:— терфенадин, астемизол, мизоластин, цизаприд, дофетилид, хинидин, пимозид, левацетилметадол, сертиндол - совместное применение данных лекарственных средств с итраконазолом может вызывать повышение концентрации этих веществ в плазме и увеличивать риск удлинения интервала QT и в редких случаях - возникновение мерцательной аритмии желудочков (torsade des pointes);— метаболизируемые изоферментом CYP3A4 ингибиторы редуктазы ГМГ- КоА такие, как симвастатин и ловастатин;— мидазолам для приема внутрь и триазолам;— алкалоиды спорыньи такие как дигидроэрготамин, эргометрин, эрготамин и метилэргометрин;— блокаторы «медленных» кальциевых каналов - в дополнение к возможному фармакокинетическому взаимодействию, связанному с общим путем метаболизма с участием изофермента CYP3A4, блокаторы «медленных» кальциевых каналов могут оказывать отрицательный инотропный эффект, который усиливается при одновременном приеме с итраконазолом. Препараты, при назначении которых необходимо следить за их концентрациями в плазме, действием, побочными эффектами. В случае одновременного назначения с итраконазолом дозу этих препаратов, если необходимо, следует уменьшать.— непрямые антикоагулянты;— ингибиторы ВИЧ-протеазы, такие как ритонавир,

индинавир, саквинавир;— некоторые противоопухолевые препараты, такие как алкалоиды барвинка розового, бусульфан, доцетаксел, триметрексат;— метаболизируемые изоферментом CYP3A4 блокаторы «медленных» кальциевых каналов, такие как верапамил и производные дигидропиридина;— некоторые иммуносупрессивные средства: циклоспорин, такролимус, сиролимус (также известный как рапамицин);— некоторые метаболизируемые изоферментом CYP3A4 ингибиторы редуктазы ГМГ- КоА такие, как аторвастатин;— некоторые глюкокортикостероиды, такие как будесонид, дексаметазон и метилпреднизолон;— другие препараты: дигоксин, карбамазепин, буспирон алфентанил, алпразолам, бротшолам, мидазолам для внутривенного введения, рифабутин, эбастин, ребоксетин, цилостазол, дизолирамнд, элетрнптан, галофатрин, репаглинид.Взаимодействия между итраконазолом и зидовудином и флувастатином не обнаружено. Не отмечалось влияния итраконазола на метаболизм этинилэстрадиола и норэтистерона.4. Влияние на связь белками плазмы.Исследования in vitro продемонстрировали отсутствие взаимодействия между итраконазолом и такими препаратами, как имипрамин, пропранолол, диазепам, циметидин, индометацин, толбутамид и сульфаметазин при связывании с белками плазмы.

Особые указания

— Женщинам детородного возраста, принимающим Итраконазол, необходимо использовать надежные методы контрацепции на протяжении всего курса лечения вплоть до наступления первой менструации после его завершения.— Обнаружено, что итраконазол обладает отрицательным инотропным эффектом. При одновременном приеме итраконазола и блокаторов кальциевых каналов, которые могут оказывать тот же эффект, необходимо соблюдать осторожность. Сообщалось о случаях хронической сердечной недостаточности, связанных с приемом Итраконазола. Итраконазол не следует принимать пациентам с хронической сердечной недостаточностью или с наличием этого заболевания в анамнезе за исключением случаев, когда возможная польза значительно превосходит потенциальный риск. При индивидуальной оценке соотношения пользы и риска следует принимать во внимание такие факторы как серьезность показаний, режим дозирования и индивидуальные факторы риска возникновения хронической сердечной недостаточности. Факторы риска включают в себя наличие заболеваний сердце, таких как ишемическая болезнь сердца или поражения клапанов; серьезные заболевания легких, такие как обструктивные поражения легких; почечная недостаточность или другие заболевания, сопровождающиеся отеками. Таких пациентов необходимо проинформировать о признаках и симптомах застойной сердечной недостаточности. Лечение должно проводиться с осторожностью, при этом необходимо мониторировать больного на

предмет возникновения симптомов застойной сердечной недостаточности. При их появлении прием Итраконазола необходимо прекратить.— При пониженной кислотности желудка: при этом состоянии абсорбция итраконазола из капсул нарушается. Пациентам, принимающим антацидные препараты (например, алюминия гидроксид), рекомендуется их использовать не ранее, чем через 2 ч после приема капсул Итраконазола. Пациентам с ахлоргидрией или применяющим блокаторы Н1 гистаминовых рецепторов и ингибиторы протонной помпы, рекомендуется принимать капсулы Итраконазола с напитками, содержащими колу.— В очень редких случаях при применении Итраконазола развивалось тяжелое токсическое поражение печени, включая случаи острой печеночной недостаточности с летальным исходом. В большинстве случаев это отмечалось у пациентов, уже имевших заболевания печени, у пациентов, с другими тяжелыми заболеваниями, получавших терапию итраконазолом по системным показаниям, а также у пациентов, получавших другие лекарственные средства, обладающие гепатотоксичекским действием. У некоторых пациентов не выявлялись очевидные факторы риска в отношении поражения печени. Несколько таких случаев возникли в первый месяц терапии, а некоторые - в первую неделю лечения. В связи с этим рекомендуется регулярно контролировать функцию печени у пациентов, получающих терапию итраконазолом. Пациентов следует предупредить о необходимости немедленно связаться со своим врачом в случае возникновения симптомов, предполагающих возникновение гепатита, а именно: анорексин, тошноты, рвоты, слабости, боли в животе и потемнения мочи. В случае появлении таких симптомов необходимо немедленно прекратить терапию и провести исследование функции печени. Пациентам с повышенной концентрацией «печеночных» ферментов или заболеванием печени в активной фазе, или при перенесенном токсическом поражении печени при приеме других препаратов не следует назначать лечение Итраконазолом за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза оправдывает риск поражения печени. В этих случаях необходимо во время лечения контролировать концентрация «печеночных» ферментов.— Нарушения функции печени: итраконазол метаболизируется преимущественно в печени. Поскольку у пациентов с нарушениями функции печени полный период полувыведения итраконазола несколько увеличен, рекомендуется осуществлять контроль концентрации итраконазола в плазме и при необходимости корректировать дозу препарата.— Нарушения функции почек: Поскольку у пациентов с почечной недостаточностью полный период полувыведения итраконазола несколько увеличен, рекомендуется осуществлять контроль концентрации итраконазола в плазме и при необходимости корректировать дозу препарата.— Пациенты с иммунодефицитом: биодоступность итраконазала при пероральным приеме может быть снижена у некоторых пациентов с нарушенным иммунитетом, например, у больных с нейтропенией, больных СПИДом или перенесших операцию по трансплантации

органов.— Пациенты с системными грибковыми инфекциями, представляющими угрозу жизни: вследствие фармакокинетических характеристик Итраконазол в виде капсул не рекомендуется для начала лечения системных микозов, представляющих угрозу для жизни пациентов.— Больные СПИДом.— Лечащий врач должен оценить необходимость назначения поддерживающей терапии больным СПИДом, ранее получавшим лечение по поводу системных грибковых инфекций, например, споротрихоза, бластомикоза, гистоплазмоза или криптококкоза (как менингеального, так и неменингеального), у которых существует риск рецидива.— Клинические данные о применении капсул Итраконазол в педиатрической практике ограничены. Капсулы Итраконазол не следует назначать детям, за исключением случаев, когда ожидаемая польза превышает возможный риск.— Лечение следует прекратить при возникновении периферической нейропатии, которая может быть связана с приемом капсул Итраконазола.— Нет данных о перекрестной гиперчувствительности к итраконазолу и другим азоловым противогрибковым препаратам.Воздействие на способность водить автомобиль и работать с техникой. Итраконазол может вызвать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут повлиять на способность управлять транспортными средствами и другой техникой, требующей повышенного внимания при работе.

Условия хранения

В сухом месте