

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Фосфомицин-ЛекТ

Регистрационный номер

Торговое наименование: Фосфомицин-ЛекТ

Международное непатентованное или группировочное наименование: фосфомицин

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для приема внутрь

Состав:

1 пакет содержит:

действующее вещество: фосфомицина триметамол 5,631 г (3,0 г фосфомицина);

вспомогательные вещества: сахароза – 2,213 г, ароматизатор апельсиновый – 0,140 г, натрия сахаринат – 0,016 г.

Описание

Порошок белого или почти белого цвета с цитрусовым запахом. Допускается наличие единичных гранул.

При растворении в 50 мл воды образуется практически бесцветный со слабым молочным оттенком раствор.

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик

Код АТХ: J01XX01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Фосфомицин [моно (2-аммоний-2-гидроксиметил-1,3-пропандиол)(2R-цис)-(3-метилоксиранил) фосфонат] – антибактериальное средство широкого спектра действия, производное фосфоновой кислоты, предназначенное для лечения инфекций мочевыводящих путей.

Механизм действия связан с подавлением первого этапа синтеза клеточной стенки бактерий. Являясь структурным аналогом фосфоэнолпирувата, конкурентно необратимо ингибирует фермент УДФ-N-ацетилглюкозаамиенолпирувилтрансферазу, который катализирует реакцию образования УДФ-M-ацетил-3-O-(1-карбоксивинил)-D-глюкозамина из фосфоэнолпирувата и УДФ-N-ацетил-D-глюкозамина. Также фосфомицин способен снижать адгезию бактерий со слизистыми оболочками мочевого пузыря, которая может играть роль предрасполагающего фактора для рецидивирующих инфекций. Механизм действия фосфомицина объясняет отсутствие перекрестной



резистентности с другими антибиотиками и взаимное усиление действия с антибиотиками других классов, например, с бета-лактамами антибиотиками. Фосфомицин активен в отношении широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, обычно выделяемых при инфекциях мочевыводящих путей, таких как *Escherichia coli*, *Citrobacter spp.*, *Klebsiella spp.*, *Proteus spp.*, *Serratia spp.*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Enterococcus faecalis*. Возникновение резистентности в лабораторных условиях объясняется мутацией генов *gIpT* и *uhp*, которые контролируют транспорт L-альфа-глицерофосфатов и глюкозофосфатов, соответственно.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь фосфомицин хорошо всасывается из кишечника и достигает биодоступности порядка 50%. Максимальная концентрация в плазме наблюдается через 2-2,5 часа после перорального приема и составляет 22-32 мг/л. Период полувыведения из плазмы равен 4 часам. Прием с пищей замедляет всасывание, не влияя на концентрацию в моче.

Распределение

Фосфомицин распределяется в почках, стенках мочевого пузыря, простате и семенных железах. Постоянная концентрация фосфомицина в моче, превышающая Минимальную Бактериостатическую концентрацию (МБСК), достигается через 24-48 часов после перорального приема. Фосфомицин не связывается белками плазмы, не метаболизируется и преодолевает плацентарный барьер. После однократной инъекции фосфомицин выделяется в грудное молоко в малых количествах.

Выведение

Фосфомицин выводится в неизменном виде, в основном, почками путем клубочковой фильтрации (40-50% принятой дозы обнаруживается в моче), причем период полувыведения составляет около 4 часов, и в меньшей степени – кишечником (18-28% дозы). Возникновение второй пиковой концентрации в сыворотке через 6 и 10 часов после приема фосфомицина позволяет предположить, что фосфомицин подвержен кишечнo-печеночной рециркуляции. Фармакокинетические свойства фосфомицина не зависят от возраста и беременности. Фосфомицин кумулируется у пациентов с почечной недостаточностью; между фармакокинетическими параметрами фосфомицина и скоростью клубочковой фильтрации установлена линейная зависимость.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к фосфомицину микроорганизмами:

- острый бактериальный цистит, острые приступы рецидивирующего бактериального цистита;
- бактериальный неспецифический уретрит;
- бессимптомная массивная бактериурия у беременных;
- послеоперационные инфекции мочевыводящих путей.

Профилактика инфекций при хирургическом вмешательстве на мочевыводящих путях и при трансуретральных диагностических исследованиях.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к фосфомицину, другим компонентам препарата;
- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина < 10 мл/мин);
- детский возраст до 12 лет;
- гемодиализ;
- дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

При беременности применяют только в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Фосфомицин в очень малых концентрациях проникает в грудное молоко.

При назначении препарата в период лактации необходимо прекратить грудное вскармливание на время терапии.

Способ применения и дозы

Внутрь.

Порошок растворяют в 1/2 стакана воды (50-75 мл) или другого напитка, перемешивают до полного растворения, принимают сразу же после растворения.

Фосфомицин применяют 1 раз в сутки внутрь натощак за 1 час до или через 2-3 часа после еды, предпочтительно перед сном, предварительно опорожнив мочевой пузырь.

Взрослым и детям от 12 до 18 лет:

По 1 пакету (3 г) 1 раз в день однократно.

С целью профилактики инфицирования мочевыводящих путей при хирургическом вмешательстве, трансуретральных диагностических процедурах фосфомицин принимают 2 раза по 3 г: за 3 часа до вмешательства и через 24 часа после вмешательства.

В более тяжёлых случаях (пожилые пациенты, рецидивирующие инфекции) принимают ещё 1 пакет через 24 часа.

Особые группы пациентов

Пациенты с заболеваниями почек

У пациентов с легкой или средней степенью тяжести почечной недостаточности коррекции дозы не требуется. У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью или находящихся на гемодиализе применение препарата противопоказано.

Пациенты с заболеваниями печени

У пациентов с печеночной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

Побочное действие

Наиболее распространенными нежелательными реакциями на однократный прием фосфомицина являются нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта, чаще всего диарея. Эти реакции являются кратковременными, проходят спонтанно.

Далее в таблице приведены неблагоприятные побочные реакции, которые были зарегистрированы при использовании фосфомицина в ходе клинических исследований или пострегистрационного наблюдения.

Частота реакции указана следующим образом: очень часто ($>1/10$), часто ($>1/100$ до $<1/10$), нечасто ($>1/1000$, до $<1/100$), редко (от $>1/10000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$) и неизвестно (частотность не может быть оценена на основе имеющихся данных).

В каждой группе нежелательные реакции представлены в порядке убывания тяжести.

Системно-органный класс	Нежелательные реакции			
	<i>нечасто</i>	<i>редко</i>	<i>очень редко</i>	<i>неизвестно</i>
Инфекционные и паразитарные заболевания	вульвовагинит	суперинфекция		
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы		апластическая анемия		эозинофилия, тромбоцитоз (петехии)
Нарушения со стороны иммунной системы				анафилактические реакции, в том числе анафилактический шок, ангионевротический отек, гиперчувствительность
Нарушения со стороны обмена веществ и питания				снижение аппетита

<i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i>		сыпь, крапивница, зуд		
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	головная боль, головокружение	парестезии		
<i>Нарушения со стороны сердца</i>			тахикардия	
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>				снижение артериального давления, петехии
<i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения</i>				астма, бронхоспазм, одышка
<i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта</i>	диарея, тошнота, диспепсия	абдоминальные боли, рвота		антибиотик-ассоциированный колит
<i>Общие расстройства и нарушения в месте введения</i>		усталость		
<i>Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей</i>				кратковременное повышение активности щелочной фосфатазы и «печеночных» трансаминаз

Передозировка

Симптомы

Данные в отношении передозировки фосфомицина для приема внутрь ограничены. У пациентов, принявших чрезмерную дозу фосфомицина, наблюдались следующие реакции: нарушения функции вестибулярного аппарата, нарушения слуха, «металлический» привкус во рту, а также общее снижение восприятия вкуса.

Лечение

Лечение при передозировке симптоматическое и поддерживающее. В случае передозировки рекомендуется приём жидкости внутрь с целью увеличения диуреза.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При совместном применении с фосфомицином, метоклопрамид снижает концентрацию фосфомицина в сыворотке крови и моче.

Одновременное применение антацидов или солей кальция приводит к уменьшению концентрации фосфомицина в плазме крови и моче.

Другие препараты, которые увеличивают двигательную активность желудочно-кишечного тракта, могут вызывать аналогичный эффект.

Возможны специфические проблемы, связанные с изменением международного нормализованного отношения (МНО). У пациентов, получающих антибиотики, были зарегистрированы многочисленные случаи повышенной активности антагонистов витамина К. К факторам риска относятся тяжелая инфекция или воспаление, возраст и плохое общее состояние здоровья. В этих условиях трудно определить, является ли изменение в МНО следствием инфекционного заболевания или его лечения. Тем не менее, определённые классы антибиотиков чаще упоминаются в этой связи, а именно: фторхинолоны, макролиды, циклины, ко-тримоксазол и некоторые цефалоспорины.

Особые указания

Во время лечения фосфомицином могут возникнуть реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию и анафилактический шок, представляющие опасность для жизни. Если такая реакция возникает, необходимо исключить повторный прием фосфомицина и провести адекватное лечение.

Антибиотик-ассоциированная диарея была отмечена при использовании практически всех антибактериальных средств, в том числе фосфомицина. Ее тяжесть может варьироваться от легкой диареи до смертельного колита. Диарея, в особенности тяжелая, непрекращающаяся и/или с кровью, во время или после лечения фосфомицином (в том числе, в течение нескольких недель после лечения), может быть симптомом заболевания, вызванного *Clostridium difficile* (псевдомембранозный колит). Этот диагноз важно учитывать при лечении пациентов во время или после приема фосфомицина. При предполагаемом или подтвержденном диагнозе псевдомембранозного колита соответствующее лечение должно быть начато незамедлительно. Препараты, подавляющие перистальтику кишечника, в данной клинической ситуации противопоказаны.

Почечная недостаточность: концентрация фосфомицина в моче сохраняется в течение 48 часов после приема обычной дозы, если клиренс креатинина выше 10 мл/мин. Фосфомицин противопоказан пациентам, проходящим гемодиализ.

Пациентам с сахарным диабетом и тем, кому нужно соблюдать диету, следует учитывать, что в 1 пакете Фосфомицин-ЛекТ с дозировкой 3 г содержится 2,213 г сахарозы, что соответствует 0,22 хлебным единицам.

Фосфомицин-ЛекТ не должен применяться у пациентов с непереносимостью фруктозы, синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции или дефицитом сахаразы-изомальтазы.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Специальных исследований не проводилось, но пациентов следует информировать о том, что применение фосфомицина может вызвать головокружение.

При появлении головокружения следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для приема внутрь, 3 г.

По 8 г препарата помещают в пакет из 4-х слойной ламинированной фольги (бумага-полиэтилен-алюминий-полиэтилен). 1 или 2 пакета вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/ Организация, принимающая претензии от потребителей

ОАО «Тюменский химико-фармацевтический завод»

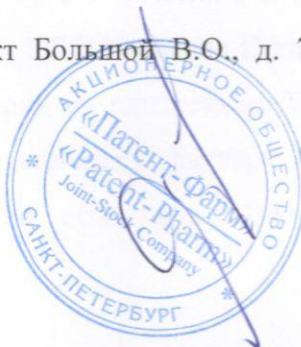
625005, г. Тюмень, ул. Береговая, 24, тел./факс: (3452) 46-14-86

Владелец регистрационного удостоверения

АО «Патент-Фарм», Россия

199106, г. Санкт-Петербург, пр-кт Большой В.О., д. 75, литер Б, пом. 208, тел./факс: (812) 380-14-14

Генеральный директор
АО «Патент-Фарм»



Я. В. Жарков

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 005995-181219

СОГЛАСОВАНО

Прошито, пронумеровано, прошнуровано

4 / 000001

ист. 22

Генеральный директор АО «Патент-Фарм»
Жарков Я.В.

подпись

