

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НІТРОКСОЛІН (NITROXOLINE)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить нітроксоліну 50 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль картопляний, тальк, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, цукор білий, повідон 25, титану діоксид (Е 171), желатин, магнію карбонат важкий, поліетиленгліколь 6000 (макрогол 6000), жовтий захід FCF (Е 110).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, вкриті оболонкою, від жовто-оранжевого до оранжевого кольору, верхня та нижня поверхня яких опуклі.

На розламі при розгляданні під лупою видно ядро, оточене двома суцільними шарами.

Фармакотерапевтична група. Антибактеріальні засоби для системного застосування. Інші антибактеріальні засоби. Нітроксолін.

Код АТХ J01X X07.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Нітроксолін – синтетичний уроантисептик, що діє за механізмом хелатування. Він блокує функцію ферменту, зв'язуючи іони металів у ферментах мікроорганізмів, запобігаючи таким чином зв'язуванню цих ферментів зі специфічним субстратом. Це призводить до бактеріостатичного, бактерицидного і фунгіцидного ефекту. У субінгібуючих концентраціях у сечі нітроксолін як у початковому стані, так і в глюкуронідній формі пригнічує фіксацію уropатогенної бактерії *Escherichia coli* в епітелії сечостатевого тракту.

Нітроксолін ефективний щодо широкого спектра грампозитивних, грамнегативних бактерій і грибів. Спектр його антибактеріальної та протигрибкової активності поширюється на більшість мікроорганізмів, що інфікують сечовивідні шляхи.

До мікроорганізмів, чутливих до нітроксоліну, належать *Escherichia coli*, *Ureaplasma urealyticum*, *Mycoplasma hominis*, *Candida spp.*, *Torulopsis spp.*

До мікроорганізмів, частково чутливих до нітроксоліну, належать *Proteus spp.*, *Staphylococcus spp.*

До мікроорганізмів, нечутливих до нітроксоліну, належать *Pseudomonas spp.*, *Providencia spp.*, *Klebsiella spp.*, *Enterobacter spp.*, *Serratia spp.*, анаеробні бактерії.

Також встановлена чутливість до нітроксоліну стрептококів *Corynebacterium diphtheriae*, *Enterococcus spp.*, *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*, *Neisseria gonorrhoeae* та *Haemophilus influenzae*.

Фармакокінетика.

Нітроксолін швидко та майже повністю (90 %) всмоктується з травного тракту після перорального застосування. Середня пікова концентрація у плазмі крові після разової пероральної дози 200 мг досягається через 1,5-2 години і становить 4-4,7 мг/л. Період напіввиведення із сироватки крові становить приблизно 2 години. Після застосування внутрішньо нітроксоліну досягаються високі концентрації у сечі як кон'югованого, так і некон'югованого нітроксоліну. Нітроксолін метаболізується у печінці, де він кон'югує з глюкуроною і сірчаною кислотою. Нітроксолін виводиться у вигляді глюкуроніду, в основному, з сечею (55-60 %) і меншою мірою – з жовчю. Тільки 5 % виводиться з сечею у неко́н'югованій активній формі.

Клінічні характеристики.

Показання.

Гострі, хронічні та рецидивуючі інфекції сечовивідних шляхів, спричинені грампозитивними та грамнегативними мікроорганізмами і грибами, чутливими до нітроксоліну.

Профілактика рецидивуючих інфекцій сечовивідних шляхів.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до нітроксоліну або до будь-якого компонента препарату, а також до хінолінів; тяжка печінкова та ниркова недостатність (кліренс креатиніну менше 0,33 мл/с).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Нітроксолін не слід застосовувати разом із препаратами, що містять гідроксихіноліни або їх похідні.

При одночасному застосуванні з антацидними засобами, які містять магній, всмоктування Нітроксоліну сповільнюється.

Нітроксолін знижує ефективність налідиксової кислоти.

При сумісному застосуванні з препаратами групи тетрацикліну спостерігається сумація ефектів кожного препарату.

При застосуванні з ністатином та леворином відзначається потенціювання дії.

Не слід поєднувати нітроксолін із нітрофуранами для уникнення сумації негативного нейротропного ефекту.

Особливості застосування.

З обережністю призначати препарат пацієнтам із порушеннями функції нирок через можливість кумуляції нітроксоліну. З обережністю препарат призначати пацієнтам із катарактою. При повторному та тривалому лікуванні високими дозами галогенопохідних гідроксихіноліну описані випадки розвитку периферичного неврити та неврити зорового нерва. Нітроксолін є нітропохідним хіноліну і для нього такі побічні явища не спостерігалися, однак рекомендується дотримуватися обережності при лікуванні нітроксоліном – такі пацієнти мають перебувати під ретельним наглядом лікаря. Лікування не має перевищувати 4 тижнів без додаткового медичного обстеження.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід застосовувати препарат.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Безпека та ефективність застосування препарату у період вагітності або годування груддю не встановлені, тому нітроксолін не слід призначати у ці періоди.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Немає даних про негативний вплив препарату на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі: рекомендована добова доза – 400-800 мг, розподілена на 4 прийоми. Середня добова доза становить 400 мг (по 2 таблетки 4 рази на добу до їди). При тяжких захворюваннях добову дозу можна збільшити до 800 мг (по 4 таблетки 4 рази на добу). Максимальна добова доза для дорослих становить 800 мг.

Діти віком від 3 років: рекомендована добова доза становить 200-400 мг (по 1-2 таблетки 4 рази на добу до їди).

Тривалість лікування визначає лікар залежно від характеру та перебігу захворювання. При хронічних інфекціях препарат призначати повторними курсами тривалістю 2 тижні з двотижневими перервами (курс лікування може тривати кілька місяців).

Порушення функції нирок.

Пацієнтам із помірною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну більше 0,33 мл/с) звичайну дозу слід зменшити вдвічі.

Порушення функції печінки.

При порушенні функції печінки звичайну дозу слід зменшити вдвічі.

Пацієнти літнього віку.

Корекція дози не потрібна.

Діти.

Дітям віком до 3 років не рекомендується застосування препарату у формі таблеток, вкритих оболонкою.

Передозування.

Інформація щодо передозування нітроксоліном відсутня. Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.

З боку шлунково-кишкового тракту: у поодиноких випадках можливі диспептичні явища (нудота, блювання, втрата апетиту), яких можна запобігти, застосовуючи препарат під час їди.

З боку печінки і жовчовивідних шляхів: зниження активності трансаміназ, порушення функції печінки.

З боку імунної системи: можливі шкірні висипання, свербіж, що швидко минають після припинення застосування препарату; дуже рідко – алергічні реакції з розвитком тромбоцитопенії.

З боку нервової системи: рідко – головний біль, атаксія, парестезії, полінейропатія.

З боку нирок: зменшення вмісту сечової кислоти у плазмі крові.

Оскільки нітроксолін виводиться нирками, сеча забарвлюється в інтенсивний жовтий колір.

Інші: загальна слабкість, тахікардія.

Препарат містить барвник жовтий захід FCF (E 110), який може провокувати алергічні реакції, у тому числі астму. Особливо це стосується пацієнтів із підвищеною чутливістю до ацетилсаліцилової кислоти.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістерідо 1 або по 5 блістерів у пачці з картону.

По 10 таблеток у блістерідо 80 блістерів у коробці з картону.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПрАТ «Технолог».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 20300, Черкаська обл., місто Умань, вулиця Мануїльського, будинок 8.

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

НИТРОКСОЛИН (NITROXOLINE)

Состав:

действующее вещество: 1 таблетка содержит нитроксолина 50 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал картофельный, тальк, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, сахар белый, повидон 25, титана диоксид (E 171), желатин, магния карбонат тяжелый, полиэтиленгликоль 6000 (макрогол 6000), желтый закат FCF (E 110).

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы, покрытые оболочкой, от желто-оранжевого до оранжевого цвета, верхняя и нижняя поверхности которых выпуклые. На разломе при рассматривании под лупой видно ядро, окруженное двумя сплошными слоями.

Фармакотерапевтическая группа. Антибактериальные средства для системного применения. Другие антибактериальные средства. Нитроксолин.

Код АТХ J01X X07.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Нитроксолин – синтетический уроантисептик, который действует по механизму хелатирования. Он блокирует функцию фермента, связывая ионы металлов в ферментах микроорганизмов, предотвращая таким образом связывание этих ферментов со специфичным субстратом. Это приводит к бактериостатическому, бактерицидному и фунгицидному эффекту. В субингибированных концентрациях в моче нитроксолин как в исходном состоянии, так и в глюкуронидной форме угнетает фиксацию уропатогенной бактерии *Escherichia coli* в эпителии мочевого тракта.

Нитроксолин эффективен в отношении широкого спектра грампозитивных, грамотрицательных бактерий и грибов. Спектр его антибактериальной и противогрибковой активности распространяется на большинство микроорганизмов, инфицирующих мочевыводящие пути.

К микроорганизмам, чувствительным к нитроксолину, принадлежат *Escherichia coli*, *Ureaplasma urealyticum*, *Mycoplasma hominis*, *Candida spp.*, *Torulopsis spp.*

К микроорганизмам, частично чувствительным к нитроксолину, принадлежат *Proteus spp.*, *Staphylococcus spp.*

К микроорганизмам, нечувствительным к нитроксолину, принадлежат *Pseudomonas spp.*, *Providencia spp.*, *Klebsiella spp.*, *Enterobacter spp.*, *Serratia spp.*, анаэробные бактерии.

Также установлена чувствительность к нитроксолину стрептококков, *Corynebacterium diphtheriae*, *Enterococcus spp.*, *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*, *Neisseria gonorrhoeae* и *Haemophilus influenzae*.

Фармакокинетика.

Нитроксолин быстро и почти полностью (90 %) всасывается из пищеварительного тракта после перорального применения. Средняя пиковая концентрация в плазме после разовой пероральной дозы 200 мг достигается через 1,5-2 часа и составляет 4-4,7 мг/л. Период полувыведения из сыворотки крови составляет приблизительно 2 часа. После применения внутрь нитроксолина достигаются высокие концентрации в моче как конъюгированного, так и неконъюгированного нитроксолина. Нитроксолин метаболизируется в печени, где он конъюгирует с глюкуроновой и серной кислотой. Нитроксолин выводится в виде глюкуронида, в основном, с мочой (55-60 %) и в меньшей мере – с желчью. Только 5 % выводится с мочой в неконъюгированной активной форме.

Клинические характеристики.

Показания.

Острые, хронические и рецидивирующие инфекции мочевыводящих путей, обусловленные грампозитивными и грамотрицательными микроорганизмами и грибами, чувствительными к нитроксолину.

Профилактика рецидивирующих инфекций мочевыводящих путей.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к нитроксолину или к какому-либо компоненту препарата, а также к хинолинам; тяжелая печеночная и почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 0,33 мл/с).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Нитроксолин не следует применять вместе с препаратами, содержащими гидроксихинолины или их производные.

При одновременном применении с антацидными средствами, содержащими магний, всасываемость Нитроксолина замедляется.

Нитроксилин снижает эффективность налидиксовой кислоты.

При совместном применении с препаратами группы тетрациклина наблюдается суммация эффектов каждого препарата.

При применении с нистатином и леворином отмечается потенцирование действия.

Не следует совмещать нитроксилин с нитрофуранами во избежание суммации негативного нейротропного эффекта.

Особенности применения.

С осторожностью назначают препарат пациентам с нарушениями функции почек из-за возможности кумуляции нитроксилина. С осторожностью препарат назначать пациентам с катарактой. При повторном и длительном лечении высокими дозами галогенопроизводных гидроксихинолина описаны случаи развития периферического неврита и неврита зрительного нерва. Нитроксилин является нитропроизводным хинолина и для него такие побочные явления не наблюдались, однако рекомендуется соблюдать осторожность при лечении нитроксилином – такие пациенты должны находиться под тщательным наблюдением врача. Лечение не должно превышать 4 недель без дополнительного медицинского обследования.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять препарат.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Безопасность и эффективность применения препарата в период беременности или кормления грудью не установлены, поэтому нитроксилин не следует назначать в эти периоды.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Нет данных о негативном влиянии препарата на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Взрослые: рекомендованная суточная доза – 400-800 мг, разделенная на 4 приема. Средняя суточная доза составляет 400 мг (по 2 таблетки 4 раза в сутки до еды). При тяжелых заболеваниях суточную дозу можно увеличить до 800 мг (по 4 таблетки 4 раза в сутки). Максимальная суточная доза для взрослых составляет 800 мг.

Дети с 3 лет: рекомендованная суточная доза составляет 200-400 мг (по 1-2 таблетки 4 раза в сутки до еды).

Длительность лечения определяет врач в зависимости от характера и течения заболевания. При хронических инфекциях препарат назначать повторными курсами длительностью 2 недели с двухнедельными перерывами (курс лечения может длиться несколько месяцев).

Нарушения функции почек.

Пациентам с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина более 0,33 мл/с) обычную дозу следует уменьшить вдвое.

Нарушения функции печени.

При нарушениях функции печени обычную дозу следует уменьшить вдвое.

Пациенты пожилого возраста.

Коррекция дозы не нужна.

Дети.

Детям до 3 лет не рекомендуется применение препарата в форме таблеток, покрытых оболочкой.

Передозировка.

Информация о передозировке нитроксилином отсутствует. Лечение симптоматическое.

Побочные реакции.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: в единичных случаях возможны диспептические проявления (тошнота, рвота, потеря аппетита), которые можно предотвратить, применяя препарат во время еды.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: снижение активности трансаминаз, нарушение функции печени.

Со стороны иммунной системы: возможны кожные высыпания, зуд, которые быстро проходят после прекращения применения препарата; очень редко – аллергические реакции с развитием тромбоцитопении.

Со стороны нервной системы: редко – головная боль, атаксия, парестезии, полинейропатия.

Со стороны почек: уменьшение содержания мочевой кислоты в плазме крови.

Поскольку нитроксилин выводится почками, моча окрашивается в интенсивный желтый цвет.

Другие: общая слабость, тахикардия.

Препарат содержит краситель желтый закат FCF (E 110), который может провоцировать аллергические реакции, в том числе астму. Особенно это касается пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте.

Срок годности. 4 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере; по 1 или по 5 блистеров в пачке из картона.

По 10 таблеток в блистере; по 80 блистеров в коробке из картона.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

ЧАО «Технолог».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 20300, Черкасская обл., город Умань, улица Мануильского, дом 8.