

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ОРНІДАЗОЛ-АСТРАФАРМ (ORNIDAZOLE-ASTRAPHARM)

Склад:

діюча речовина: ornidazole;

1 капсула містить орнідазолу у перерахуванні на 100 % речовину 500 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, магнію стеарат;

склад оболонки капсули: желатин, титану діоксид (E 171), індиго кармін-блакитний 2 (E 132), азорубін (E 122).

Лікарська форма. Капсули.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули № 0 циліндричної форми з напівсферичними кінцями, корпус – білого кольору, кришечка – синього кольору. Вміст капсул – кристалічний порошок блідо-жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, що застосовуються у разі амебіазу та інших протозойних інфекцій. Похідні нітроїмідазолу. Орнідазол. Код АТХ P01A B03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Орнідазол – протипротозойний та антибактеріальний засіб, похідне 5-нітроїмідазолу. Активний щодо *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica*, *Giardiasis lamiasis (Giardia intestinalis)*, а також деяких анаеробних бактерій, таких як *Bacteroides*, *Clostridium spp.*, *Fusobacterium spp.* та анаеробних коків.

За механізмом дії орнідазол – ДНК-тропний препарат із вибірковою активністю щодо мікроорганізмів, які мають ферментні системи, здатні відновлювати нітрогрупу і каталізувати взаємодію білків групи феридоксинів з нітросполуками. Після проникнення препарату в мікробну клітину механізм його дії зумовлений відновленням нітрогрупи під впливом нітроредуктаз мікроорганізму та активністю уже відновленого нітроїмідазолу. Продукти відновлення утворюють комплекси з ДНК, спричиняючи її деградацію, порушують процеси реплікації і транскрипції ДНК. Крім того, продукти метаболізму препарату мають цитотоксичні властивості і порушують процеси клітинного дихання мікроорганізмів.

Фармакокінетика.

Всмоктування: після перорального застосування орнідазол швидко всмоктується у травний тракт. У середньому всмоктування становить 90 %. Максимальна концентрація у плазмі крові досягається у межах 3 годин.

-

-

Розподіл: зв'язування орнідазолу з білками плазми крові становить приблизно 13 %. Діюча речовина проникає у спинномозкову рідину, інші рідини організму та у тканини.

Концентрація орнідазолу у плазмі крові знаходиться у діапазоні 6-36 мг/л, тобто на рівні, який вважається оптимальним для різних показань щодо застосування препарату. Після багаторазового застосування у дозах 500 мг та 1000 мг здоровим добровольцям через кожні 12 годин коефіцієнт кумуляції становить 1,5-2,5.

Метаболізм: орнідазол метаболізується у печінці з утворенням в основному 2-гідроксиметил та α -гідроксиметилметаболітів. Обидва метаболіти менш активні щодо *Trichomonas vaginalis* та анаеробних бактерій, ніж незмінений орнідазол.

Виведення: період напіввиведення становить приблизно 13 годин. Після одноразового застосування 85 % дози виводиться протягом перших 5 днів, головним чином у вигляді метаболітів. Близько 4 % прийнятої дози виводиться нирками у незміненому вигляді.

Особливості фармакокінетики при порушеннях функції органів та систем.

Печінка: період напіввиведення діючої речовини при цирозі печінки збільшується до 22 годин, кліренс зменшується (з 35 до 51 мл/хв) порівняно з таким у здорових добровольців.

Нирки: фармакокінетика орнідазолу не змінюється при порушеннях функції нирок, тому дозу прийому змінювати не потрібно.

Орнідазол виводиться під час гемодіалізу. Перед початком проведення гемодіалізу необхідно застосувати додатково 500 мг орнідазолу, якщо добова доза становить 2 г на добу, або додатково 250 мг орнідазолу, якщо добова доза становить 1 г на добу.

Діти (у тому числі новонароджені): фармакокінетика орнідазолу у дітей (у тому числі новонароджених) подібна до фармакокінетики у дорослих.

Клінічні характеристики.

Показання.

Трихомоніаз (сечостатеві інфекції у жінок і чоловіків, спричинені *Trichomonas vaginalis*).

Амебіаз (усі кишкові інфекції, спричинені *Entamoeba histolytica*, у тому числі амебна дизентерія, всі позакишкові форми амебіазу, особливо амебний абсцес печінки).

Лямбліоз.

Протипоказання.

Гіперчутливість до орнідазолу чи інших компонентів препарату або до інших похідних нітромідазолу. Ураження центральної нервової системи (епілепсія, ураження головного мозку, розсіяний склероз); патологічні ураження крові або інші гематологічні аномалії.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Не слід вживати алкоголь протягом курсу лікування протягом не менше ніж 3 дні після припинення прийому препарату.

Орнідазол посилює дію пероральних антикоагулянтів кумаринового ряду, що вимагає відповідної корекції їх дозування.

Сумісне застосування фенобарбіталу та інших індукторів ферментів зменшує період циркуляції орнідазолу в сироватці крові, тоді як інгібітори ферментів (наприклад циметидин) підвищують його.

Орнідазол пролонгує міорелаксуючу дію векуронію броміду.

Особливості застосування.

При застосуванні високих доз препарату і в разі продовження лікування протягом більше 10 днів рекомендується проводити клінічний і лабораторний моніторинг.

У пацієнтів з наявністю в анамнезі порушень з боку крові рекомендується контроль рівня лейкоцитів, особливо при проведенні повторних курсів лікування.

Посилення порушень з боку центральної або периферичної нервової систем можуть спостерігатися у період проведення лікування. У разі периферичної нейропатії, порушень координації рухів (атаксії), запаморочення або затьмарення свідомості слід припинити прийом препарату.

Можливе загострення кандидомікозу, яке потребуватиме відповідного лікування.

У разі проведення гемодіалізу необхідно врахувати зменшення періоду напіввиведення і призначати додаткові дози препарату до або після гемодіалізу.

Концентрацію солей літію та електролітів, а також рівня креатиніну необхідно контролювати

при застосуванні терапії літєм.

Ефект інших лікарських засобів може бути посилений або ослаблений під час лікування препаратом.

З обережністю застосовувати пацієнтам з порушенням функції печінки.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

В експерименті орнідазол не проявляє тератогенного або токсичного впливу на плід. Оскільки контрольованих досліджень на вагітних не проводили, призначати препарат на ранніх термінах вагітності або у період годування груддю можна тільки при наявності абсолютних показань, коли можливі переваги при застосуванні препарату для матері перевищують потенційний ризик для плода/дитини.

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

При застосуванні орнідазолу можливі такі прояви як сонливість, ригідність, запаморочення, тремор, судоми, послаблення координації, тимчасова втрата свідомості. Можливість таких проявів необхідно враховувати для пацієнтів, які керують автотранспортом або працюють з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Орнідазол завжди слід приймати внутрішньо після прийому їжі.

Пацієнти з нирковою недостатністю: корекція дози не потрібна пацієнтам з порушенням функції нирок.

Пацієнти з печінковою недостатністю: інтервал прийому має бути вдвічі більший для пацієнтів з тяжкою печінковою недостатністю.

Пацієнти літнього віку: клінічні дані відсутні щодо застосування пацієнтам літнього віку.

Трихомоніаз: капсули 500 мг застосовують у схемах одноразової або 5-денної терапії.

Прийом орнідазолу може призвести до таких реакцій як почервоніння, оніміння, жар, нудота та блювання, а також можлива артеріальна гіпотензія та шум у вухах. Щонайменше протягом 3 днів після прийому препарату не слід вживати алкоголь.

Таблиця 1

| | |
|--------------------------|--|
| Тривалість лікування | Добова доза (капсула, масою 500 мг) |
| Разова терапевтична доза | 3 капсули приймають ввечері |
| 5-денна терапія | 1 капсула вранці, 1 капсула ввечері |

Щоб усунути можливість повторного зараження, статевий партнер повинен пройти такий самий курс лікування.

Одноразова добова доза для дітей становить 25 мг/кг.

Амебіаз

Можливі схеми лікування:

- 3-денний курс лікування хворих з амебною дизентерією;
- 5-10-денний курс лікування при всіх формах амебіазу.

Таблиця 2

Рекомендована схема дозування препарату

| Тривалість лікування | Добова доза | |
|----------------------------|---|--|
| | Дорослі і діти з масою тіла понад 35 кг (капсула 500 мг) | Діти з масою тіла до 35 кг |
| 3-денний курс лікування | 3 капсули на 1 прийом ввечері. При масі тіла понад 60 кг: 4 капсули (2 капсули вранці і 2 капсули ввечері) | 40 мг/кг маси тіла разова доза 35 кг – 3 капсули на 1 прийом 25 кг – 2 капсули на 1 прийом 13 кг – 1 капсула на 1 прийом |
| 5-10-денний курс лікування | 2 капсули (1 капсула вранці і 1 капсула ввечері) | 25 мг/кг маси тіла разова доза 35 кг – 2 капсули на 1 прийом 20 кг – 1 капсула на 1 прийом |

Лямбліоз

Таблиця 3

Рекомендована схема дозування препарату

| | | |
|---------------------------|--|----------------------------|
| Тривалість лікування | Добова доза | |
| | Дорослі та діти з масою тіла понад 35 кг | Діти з масою тіла до 35 кг |
| 1-2-денний курс лікування | 3 капсули за 1 прийом ввечері | 40 мг/кг разова доза |

Діти.

Препарат застосовують дітям відповідно до рекомендацій щодо дозування, вказаних у розділі «Спосіб застосування та дози».

Передозування.

У разі передозування можливі симптоми, що згадувалися у розділі «Побічні реакції», але у більш вираженій формі.

Лікування симптоматичне. Специфічний антидот невідомий. У разі судом рекомендовано внутрішньовенне введення діазепаму.

Побічні реакції.

Інфекції та інвазії: загострення кандидомікозу.

З боку системи крові: прояви впливу на кістковий мозок, лейкопенія, нейтропенія.

З боку нервової системи: сонливість, головний біль, запаморочення, тремор, ригідність, порушення координації, атаксія, судоми, підвищена втомлюваність, просторова дезорієнтація, тимчасова втрата свідомості, сплутаність свідомості, збудження та периферична нейропатія.

З боку травного тракту: порушення смаку, металевий присмак у роті, обкладений язик, нудота, блювання, діарея, біль в епігастральній ділянці, сухість у роті, втрата апетиту.

З боку гепатобіліарної системи: невідомі – жовтяниця, порушення біохімічного показника функції печінки, підвищення рівня печінкових ферментів; гепатотоксичність.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, включаючи анафілактичний шок, ангіоневротичний набряк.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: шкірні висипання, кропив'янка, гіперемія шкіри, свербіж.

Загальні розлади: підвищення температури тіла; озноб; загальна слабкість; задишка; потемніння кольору сечі; серцево-судинні розлади, у т.ч. зниження артеріального тиску.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 капсул у блістері; по 1 блістеру в коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ТОВ «АСТРАФАРМ».

Місцезнаходження виробника та адреса провадження його діяльності.

Україна, 08132, Києво-Святошинський р-н, м. Вишневе, вул. Київська, 6.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ОРНИДАЗОЛ-АСТРАФАРМ

(ORNIDAZOLE-ASTRAFARM)

Состав:

действующее вещество: ornidazole;

1 капсула содержит орнидазола в перерасчете на 100 % вещество 500 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, магния стеарат;

состав оболочки капсулы: желатин, титана диоксид (Е 171), индигокармин-голубой 2 (Е 132), азорубин (Е 122).

Лекарственная форма. Капсулы.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы № 0 цилиндрической формы с полусферическими концами, корпус – белого цвета, крышечка – синего цвета. Содержимое капсул – кристаллический порошок бледно-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа.

Средства, применяемые в случае амебиаза и других протозойных инфекций. Производные нитроимидазола. Орнидазол. Код АТХ Р01А В03.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Орнидазол – противопротозойное и антибактериальное средство, производное 5-нитроимидазола. Активный в отношении *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica*, *Giardiasis lamliasis* (*Giardia intestinalis*), а также некоторых анаэробных бактерий, таких как *Bacteroides*, *Clostridium spp.*, *Fusobacterium spp.* и анаэробных кокков.

По механизму действия орнидазол – ДНК-тропный препарат с избирательной активностью относительно микроорганизмов, имеющих ферментные системы, способных восстанавливать нитрогруппу и катализировать взаимодействие белков группы феридоксинов с нитросоединениями. После проникновения препарата в микробную клетку механизм его действия обусловлен восстановлением нитрогруппы под влиянием нитроредуктаз микроорганизма и активностью уже восстановленного нитроимидазола. Продукты восстановления образуют комплексы из ДНК, вызывая ее деградацию, нарушают процессы репликации и транскрипции ДНК. Кроме того, продукты метаболизма препарата имеют цитотоксические свойства и нарушают процессы клеточного дыхания микроорганизмов.

Фармакокинетика.

Всасывание: после перорального применения орнидазол быстро всасывается пищеварительный тракт. В среднем всасывание составляет 90 %. Максимальная концентрация в плазме крови достигается в пределах 3 часов.

Распределение: связывание орнидазола с белками плазмы крови составляет приблизительно 13 %. Действующее вещество проникает в спинномозговую жидкость, другие вещества организма и в ткани.

Концентрация орнидазола в плазме крови находится в диапазоне 6-36 мг/л, то есть на уровне,

который считается оптимальным для разных показаний относительно применения препарата. После многократного применения в дозах 500 мг и 1000 мг здоровым добровольцам через каждые 12 часов коэффициент кумуляции равен 1,5-2,5.

Метаболизм: орнидазол метаболизируется в печени с образованием в основном 2-гидроксиметил и α -гидроксиметилметаболитов. Оба метаболита менее активные относительно *Trichomonas vaginalis* и анаэробных бактерий, чем неизмененный орнидазол.

Выведение: период полувыведения составляет приблизительно 13 часов. После однократного применения 85 % дозы выводится в течение первых 5 дней, главным образом в виде метаболитов. Около 4 % принятой дозы выводится почками в неизмененном виде.

Особенности фармакокинетики при нарушениях функции органов и систем.

Печень: период полувыведения действующего вещества при циррозе печени увеличивается до 22 часов, клиренс уменьшается (с 35 до 51 мл/мин) по сравнению с таковым у здоровых добровольцев.

Почки: фармакокинетика орнидазола не изменяется при нарушениях функции почек, поэтому дозу приема изменять не нужно.

Орнидазол выводится во время гемодиализа. Перед началом проведения гемодиализа необходимо применить дополнительно 500 мг орнидазола, если суточная доза составляет 2 г в сутки, или дополнительно 250 мг орнидазола, если суточная доза составляет 1 г в сутки.

Дети (в том числе новорожденные): фармакокинетика орнидазола у детей (в том числе новорожденных) подобная к фармакокинетике у взрослых.

Клинические характеристики.

Показания.

Трихомониаз (мочеполовые инфекции у женщин и мужчин, вызванные *Trichomonas vaginalis*).

Амебиаз (все кишечные инфекции, вызванные *Entamoeba histolytica*, в том числе амебная дизентерия, все внекишечные формы амебиаза, особенно амебный абсцесс печени).

Лямблиоз.

Противопоказания.

Гиперчувствительность к орнидазолу или другим компонентам препарата или к другим производным нитромидазола. Поражения центральной нервной системы (эпилепсия, поражение головного мозга, рассеянный склероз); патологические поражения крови или другие гематологические аномалии.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Не следует употреблять алкоголь на протяжении курса лечения в течение не меньше чем 3 дня после прекращения приема препарата.

Орнидазол усиливает действие пероральных антикоагулянтов кумаринового ряда, что требует соответствующей коррекции их дозирования.

Совместное применение фенобарбитала и других индукторов ферментов уменьшает период циркуляции орнидазола в сыворотке крови, тогда как ингибиторы ферментов (например циметидин) повышают его.

Орнидазол пролонгирует миорелаксирующее действие векурония бромида.

Особенности применения.

При применении высоких доз препарата и в случае продолжения лечения в течение больше 10 дней рекомендуется проводить клинический и лабораторный мониторинг.

У пациентов с наличием в анамнезе нарушений со стороны крови рекомендуется контроль уровня лейкоцитов, особенно при проведении повторных курсов лечения.

Усиление нарушений со стороны центральной или периферической нервной систем может наблюдаться в период проведения лечения. В случае периферической нейропатии, нарушений координации движения (атаксии), головокружения или помутнения сознания следует прекратить прием препарата.

Возможно обострение кандидомикоза, что может потребовать соответственного лечения.

В случае проведения гемодиализа необходимо учитывать уменьшение периода полувыведения и назначать дополнительные дозы препарата до или после гемодиализа.

Концентрацию солей лития и электролитов, а также уровня креатинина необходимо контролировать при применении терапии литием.

Эффект других лекарственных средств может быть усиленный или ослабленный во время лечения препаратом.

С осторожностью применять пациентам с нарушением функции печени.

Применение в период беременности или кормления грудью.

В эксперименте орнидазол не проявил тератогенного или токсического влияния на плод. Поскольку контролируемых исследований на беременных не проводили, назначать препарат на ранних сроках беременности или в период кормления грудью можно только при наличии абсолютных показаний, когда возможные преимущества при применении препарата для матери превышают потенциальный риск для плода/ребенка.

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

При применении орнидазола возможны такие проявления как сонливость, ригидность, головокружение, тремор, судороги, ослабление координации, временная потеря сознания. Возможность таких проявлений необходимо учитывать для пациентов, управляющих автотранспортом или работающих с другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Орнидазол всегда следует принимать внутрь после приема пищи.

Пациенты с почечной недостаточностью: коррекция дозы не нужна пациентам с нарушением функции почек.

Пациенты с печеночной недостаточностью: интервал приема должен быть вдвое больше для пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью.

Пациенты пожилого возраста: клинические данные отсутствуют относительно применения пациентам пожилого возраста.

Трихомониаз: капсулы 500 мг применяют в схемах однократной или 5-дневной терапии.

Прием орнидазола может привести к таким реакциям как покраснение, онемение, жар, тошнота и рвота, а также возможная артериальная гипотензия и шум в ушах. Минимум в течение 3 дней после приема препарата не следует употреблять алкоголь.

Таблица 1

| | |
|------------------------------|--|
| Продолжительность лечения | Суточная доза (капсула, массой 500 мг) |
| Разовая терапевтическая доза | 3 капсулы принимают вечером |
| 5-дневная терапия | 1 капсула утром, 1 капсула вечером |

Чтобы избежать возможности повторного заражения, половой партнер должен пройти такой же курс лечения.

Однократная суточная доза для детей составляет 25 мг/кг.

Амебиаз

Возможные схемы лечения:

- 3-дневный курс лечения больных с амебной дизентерией;
- 5-10-дневный курс лечения при всех формах амебиаза.

Таблица 2

Рекомендованная схема дозирования препарата

| Продолжительность лечения | Суточная доза | |
|---------------------------|---|---|
| | Взрослые и дети с массой тела свыше 35 кг (капсула 500 мг) | Дети с массой тела до 35 кг |
| 3-дневный курс лечения | 3 капсулы за один прием вечером. При массе тела свыше 60 кг: 4 капсулы (2 капсулы утром и 2 капсулы вечером) | 40 мг/кг массы тела разовая доза 35 кг – 3 капсулы за один прием 25 кг – 2 капсулы за один прием 13 кг – 1 капсула за один прием |
| 5-10-дневный курс лечения | 2 капсулы (1 капсула утром и 1 капсула вечером) | 25 мг/кг массы тела разовая доза 35 кг – 2 капсулы за один прием 20 кг – 1 капсула за один прием |

Лямблиоз

Таблица 3

Рекомендованная схема дозирования препарата

| Продолжительность лечения | Суточная доза | |
|---------------------------|---|-----------------------------|
| | Взрослые и дети с массой тела свыше 35 кг | Дети с массой тела до 35 кг |
| 1-2-дневный курс лечения | 3 капсулы за один прием вечером | 40 мг/кг разовая доза |

Дети.

Препарат применяют детям в соответствии с рекомендациями относительно доз, указанных в разделе «Способ применения и дозы».

Передозировка.

В случае передозировки возможны симптомы, упомянутые в разделе «Побочные реакции», но в более выраженной форме.

Лечение симптоматическое. Специфический антидот неизвестен. В случае судорог рекомендуется внутривенное введение диазепама.

Побочные реакции.

Инфекции и инвазии: обострение кандидомикоза.

Со стороны системы крови: проявления влияния на костный мозг, лейкопения, нейтропения.

Со стороны нервной системы: сонливость, головная боль, головокружение, тремор, ригидность, нарушение координации, атаксия, судороги, повышенная утомляемость, пространственная дезориентация, временная потеря сознания, спутанность сознания, возбуждение и периферическая нейропатия.

Со стороны пищеварительного тракта: нарушение вкуса, металлический привкус во рту, обложенный язык, тошнота, рвота, диарея, боль в эпигастральной области, сухость во рту, потеря аппетита.

Со стороны гепатобилиарной системы: неизвестные - желтуха, нарушение биохимического показателя функции печени, повышение уровня печеночных ферментов; гепатотоксичность.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая анафилактический шок, ангионевротический отек.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: кожные высыпания, крапивница, гиперемия кожи, зуд.

Общие расстройства: повышение температуры тела; озноб; общая слабость; одышка; потемнение цвета мочи; сердечно-сосудистые расстройства, в т. ч. снижение артериального давления.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 капсул в блистере; по 1 блистеру в коробке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

ООО «АСТРАФАРМ».

Местонахождение производителя и адрес проведения его деятельности.

Украина, 08132, Киево-Святошинский р-н, г. Вишневое, ул. Киевская, 6.