Состав

действующее вещество: клиндамицин;

1 суппозиторий содержит 100 мг клиндамицина в форме клиндамицина фосфата;

вспомогательное вещество: липофильная основа*

* Жесткий жир с добавлением глицерола моноолеата.

Лекарственная форма

Суппозитории вагинальные.

Основные физико-химические свойства: суппозитории белого или почти белого цвета сигарообразной формы.

Фармакотерапевтическая группа

Противомикробные и антисептические средства, за исключением комбинации с кортикостероидами. Антибиотики. Клиндамицин. Код АТХ G01A A10.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Механизм деяния. Клиндамицин – это линкозамидный антибиотик, подавляющий синтез белков бактерий, действуя на бактериальные рибосомы. Антибиотик связывается преимущественно с рибосомальной субъединицей 50S и влияет на процесс трансляции. Хотя клиндамицин фосфат неактивен in vitro, in vivo он быстро гидролизуется, превращаясь в клиндамицин, проявляющий антибактериальную активность.

Клиндамицин, как и большинство ингибиторов синтеза белков, оказывает преимущественно бактериостатическое действие. Его эффективность связана с длительностью времени, когда концентрация действующего вещества остается выше MIC (минимальная ингибирующая концентрация) возбудителя инфекции.

Резистентность к клиндамицину чаще всего возникает из-за модификации целевого участка рибосомы обычно путем химической модификации оснований РНК или точечных мутаций в РНК или иногда в белках. Перекрестная резистентность была продемонстрирована у некоторых организмов in vitro между линкозамидами, макролидами и стрептограминами B.

Продемонстрирована перекрестная резистентность между клиндамицином и линкомицином.

Чувствительность in vitro. Клиндамицин in vitro проявляет активность против зарегистрированных штаммов микроорганизмов, ассоциированных с бактериальным вагинозом: Bacteroides spp., Gardnerella vaginalis, Mobiluncus spp., Mycoplasma hominis, Peptostreptococcus spp.

Стандартная методология для тестирования чувствительности потенциальных патогенов бактериального вагиноза – Gardnerella vaginalis и Mobiluncus spp. – не определено. Предельные значения чувствительности грамотрицательных и грамположительных анаэробов к клиндамицину были опубликованы EUCAST. Для клинических изолятов, которые в результате анализа оказались чувствительными к клиндамицину и резистентными к эритромицину, следует провести анализ на выявление индуцированной резистентности к клиндамицину с использованием D-теста. Однако граничные значения предназначены больше для определения направления системного лечения антибиотиками, чем местного.

Фармакокинетика.

Абсорбция Было оценено системное всасывание клиндамицина при интравагинальном введении 1 суппозитория фосфата клиндамицина 1 раз в сутки (эквивалентно 100 мг клиндамицина) 11 здоровым женщинам-добровольцам в течение 3 дней. Приблизительно 30% (в пределах от 6% до 70%) введенной дозы подвергалось системному всасыванию на 3-й день применения с учетом показателей площади под кривой соотношения концентрации ко времени (AUC). Как сравнение было исследовано системное всасывание при в/в введении субтерапевтической дозы 100 мг клиндамицина фосфата тем же добровольцам, которым вводили вагинальный крем, содержащий 100 мг клиндамицина фосфата. Среднее значение площади под кривой (AUC) после трехдневного применения суппозиториев было 3,2 мкг/ч/мл (в пределах от 0,42 до 11 мкг/ч/мл). Смакс достигалась на 3-й день применения суппозиториев и составляла в среднем 0,27 мкг/мл (в пределах от 0,03 до 0,67 мкг/мл) и наблюдалась примерно через 5 ч после применения (в пределах от 1 до 10 часов). Для сравнения, показатели AUC и Смакс после однократного введения в среднем составляли 11 мкг/ч/мл (в пределах от 5,1 до 26 мкг/ч/мл) и 3,7 мкг/мл (в пределах от 2,4 до 5 мкг/мл) соответственно. Среднее значение периода полувыведения после применения суппозиториев составляло 11 часов (в пределах от 4 до 35 часов) и считается, что оно ограничивается скоростью всасывания.

Результаты этого исследования показали, что системное влияние клиндамицина (на основе AUC) при применении в форме суппозиториев было в среднем в 3 раза ниже, чем после однократного введения субтерапевтической дозы, составлявшей 100 мг клиндамицина. По сравнению с аналогичной дозой клиндамицина в виде влагалищного крема системное всасывание при применении суппозитория было примерно в 7 раз выше, чем после введения влагалищного крема, при котором средние значения AUC и Смакс составляли 0,4 мкг•ч/мл (в пределах от 0,13 до 1,16 мкг/ч/мл) и 0,02 мкг/мл (в пределах от 0,01 до 0,07 мкг/мл) соответственно. Кроме того, рекомендованная суточная и общая доза клиндамицина в суппозиториях для интравагинального введения намного ниже, чем обычно применяемая во время перорального или парентерального введения клиндамицина (при применении 100 мг клиндамицина в сутки в течение 3 дней в виде суппозиториев. , составляет около 30 мг/сут по сравнению с 600–2700 мг/сут в течение 10 дней или более при пероральном или парентеральном применении). В целом системное влияние клиндамицина при применении влагалищных суппозиториев значительно ниже, чем системное влияние от терапевтической дозы после применения клиндамицина гидрохлорида перорально (ниже в 2–20 раз) или применения клиндамицина фосфата парентерально (ниже в 40–50 раз).

Показания

Бактериальный вагиноз (предыдущие названия: гемофильный вагинит, гарднереллезный вагинит, неспецифический вагинит, коринебактериальный вагинит или анаэробный вагиноз).

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу, линкомицину или вспомогательному веществу, указанному в разделе «Состав».

Ультрекс ФЛ также противопоказан пациентам, имеющим в анамнезе колит, связанный с применением антибиотиков.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Информация о одновременном применении УЛЬТРЕКС ФЛ с другими вагинальными лекарственными средствами отсутствует.

При системном применении клиндамицина фосфат обладает свойствами нейромышечного блокатора, что может усилить действие других нейромышечных блокаторов. Поэтому его следует с осторожностью применять

пациентам, принимающим такие средства (см. разделы «Передозировка» и «Фармакокинетика»).

Антагонизм (индуцированная резистентность) наблюдался in vitro между клиндамицином и эритромицином в отношении подгруппы макролидорезистентных бактериальных изолятов. Оба препарата не должны применяться одновременно с учетом потенциальной клинической значимости, за исключением случаев, когда проводились соответствующие тесты на чувствительность.

Патогенные микроорганизмы демонстрируют перекрестную резистентность к клиндамицину и линкомицину.

Антагонисты витамина К. Сообщалось о повышенных показателях исследований коагуляции (протромбиновое время/международное нормализованное соотношение) и/или кровотечение у пациентов, применявших клиндамицин в сочетании с антагонистами витамина К (например, варфарин, аценокумарол и флуиндион). Поэтому таким пациентам следует проводить мониторинг результатов исследований коагуляции.

Не рекомендуется использовать презервативы из латекса в течение лечения препаратом УЛЬТРЕКС ФЛ, выпускаемым в лекарственной форме вагинальных суппозиториев.

Особенности по применению

Перед или сразу после применения препарата УЛЬТРЕКС ФЛ может возникнуть необходимость в проведении лабораторного анализа на наличие других возбудителей инфекций, включая Trichomonas vaginalis, Candida albicans, Chlamydia trachomatis и гонококки.

Применение УЛЬТРЕКС ФЛ может привести к чрезмерному росту нечувствительных к препарату микроорганизмов, в частности дрожжей.

Во время или после применения антимикробных средств могут возникать симптомы, указывающие на псевдомембранозный колит (см. «Побочные реакции»). Случаи псевдомембранозного колита отмечались при применении почти всех антибактериальных средств, включая клиндамицин; степень тяжести может быть от легкой до угрожающей жизни. Поэтому необходимо учитывать это у пациентов, у которых развилась диарея после применения антибактериальных средств. В случаях псевдомембранозного колита средней степени тяжести улучшение состояния наблюдается после отмены препарата.

При возникновении псевдомембранозной диареи применение клиндамицина следует прекратить. Следует назначить подходящее антибактериальное лечение. Препараты, ингибирующие перистальтику, в этом случае противопоказаны.

Рекомендуется с осторожностью назначать УЛЬТРЕКС ФЛ пациенткам с воспалительными заболеваниями кишечника, такими как болезнь Крона или неспецифический язвенный колит.

Как и при любых влагалищных инфекциях, половые контакты в период применения препарата УЛЬТРЕКС ФЛ, влагалищных суппозиториев, не рекомендованы. Основание вагинальных суппозиториев может ослаблять прочность латексных презервативов и противозачаточных диафрагм (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»). Не рекомендуется применять такие средства в течение 72 часов после лечения препаратом, поскольку их противозачаточная эффективность и защитные свойства от заболеваний, передающихся половым путем, могут быть снижены.

В период применения препарата УЛЬТРЕКС ФЛ, влагалищных суппозиториев, не рекомендуется использование других изделий, предназначенных для интравагинального введения (таких как тампоны, средства для спринцевания).

Острое поражение почек

Сообщалось о редких случаях острого поражения почек, включая ОПН. Поэтому у пациентов, получающих длительную терапию клиндамицином и имеющих нарушение функции почек или принимающих сопутствующие нефротоксические препараты, следует рассмотреть вопрос о мониторинге функции почек (см. «Побочные реакции»).

Особые меры предосторожности при обращении с препаратом и его утилизации

Не используйте этот препарат, если упаковка из поливинилхлоридной пленки, содержащая вагинальные суппозитории, повреждена, открыта или негерметично упакована.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность

В исследованиях на животных была продемонстрирована репродуктивная токсичность.

Применение в течение I триместра беременности не рекомендуется, поскольку отсутствуют соответствующие хорошо контролируемые исследования

применения препарата беременным женщинам в течение этого периода.

По данным клинических исследований применение клиндамицина во лекарственной форме для вагинального применения женщинам на протяжении II триместра беременности и системное применение клиндамицина фосфата на протяжении II и III триместров не приводило к развитию врожденных аномалий.

Ультрекс ФЛ можно применять во II и III триместре беременности только в случае явной необходимости.

Кормление грудью

Неизвестно, проникает ли клиндамицин в грудное молоко после влагалищного применения. Хотя применяется в значительно более низких дозах, чем клиндамицин для системного применения, примерно 30% (в пределах от 6% до 70%) всасывается в системное кровообращение. После системного применения сообщалось об обнаружении клиндамицина в грудном молоке человека в концентрации от < 0,5 до 3,8 мкг/мл.

При системном применении клиндамицина кормящим грудью, существует риск развития нежелательного воздействия на микрофлору желудочно-кишечного тракта младенца, находящегося на грудном вскармливании. В частности, возможны диарея или кровь в кале, или сыпь. Применение лекарственного средства УЛЬТРЕКС ФЛ, суппозиториев вагинальных, кормящим грудью, можно рассматривать, если ожидаемая польза для матери превышает риски для ребенка.

Фертильность

В исследованиях на животных не было обнаружено влияния на фертильность.

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

Воздействие препарата УЛЬТРЕКС ФЛ на способность управлять транспортными средствами или работать с другими механизмами отсутствует или незначительное.

Способ приминения и дозы

По одному суппозиторию интравагинально 1 раз в сутки на ночь в течение 3 дней подряд. Суппозиторий освободить от контурной упаковки и ввести во влагалище в положении лежа на спине с согнутыми в коленях и подтянутыми к груди ногами с помощью среднего пальца руки глубже, но чтобы не вызывать

неприятные ощущения.

Применение пациентам пожилого возраста

Применение препарата УЛЬТРЕКС ФЛ в форме влагалищных суппозиториев пациенткам в возрасте от 65 лет не исследовали.

Применение пациентам с нарушением функции почек

Применение препарата УЛЬТРЕКС ФЛ в форме влагалищных суппозиториев пациенткам с нарушением функции почек не исследовали.

Следует обратить внимание на официальные рекомендации по соответствующему применению антибактериальных средств.

Дети.

Безопасность и эффективность применения УЛЬТРЕКС ФЛ, влагалищных суппозиториев, детям не установлены.

Передозировка

О случаях передозировки препаратом УЛЬТРЭКС ФЛ, выпускаемого в лекарственной форме вагинальных суппозиториев, не сообщалось.

Клиндамицин фосфат, содержащийся в препарате и применяемый вагинально, может всасываться в количестве, достаточном для развития системных эффектов.

При передозировке показано общее симптоматическое и поддерживающее лечение, если необходимо.

При случайном приеме препарата внутрь возможно возникновение эффектов, подобных тем, которые возникают при пероральном применении терапевтических доз клиндамицина.

Побочные эффекты

Безопасность применения клиндамицина в форме вагинальных суппозиториев оценивалась при клинических исследованиях с участием небеременных пациенток. Сообщалось о частоте побочных реакций: часто (³ 1/100 и < 1/10); нечасто (³ 1/1000 и < 1/100); частота неизвестна (нельзя установить из имеющихся данных).

Классы/систем органов	Частота возникновения	Побочные реакции
Инфекции и инвазии	*часто*	грибковые инфекции, инфекции, вызванные кандидами
	нечасто	бактериальные инфекции
	частота неизвесна	кандидоз (на коже)
Со стороны иммунной системы	*нечасто*	реакции гиперчувствительности
Со стороны эндокринной системы	*частота неизвесна*	гипертиреоидизм
Со стороны нервной системы	*часто*	головная боль, головокружение, дисгевзия
Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата	*нечасто*	вертиго

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата	*часто*	инфекции верхних дыхательных путей
	нечасто	носовое кровотечение
Со стороны желудочно-кишечного тракта	*часто*	боль в животе, диарея, тошнота,
	нечасто	вздутие живота, запах изо рта, метеоризм, рвота
	частота неизвесна	нарушение со стороны желудочно-кишечного тракта, псевдомембранозный колит*, диспепсия
Со стороны кожи и подкожных тканей.	*часто*	зуд (не в месте применения)
	нечасто	сыпь, эритема, крапивница
	частота неизвесна	макулопапулезная сыпь
Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани	*нечасто*	боль в спине

Со стороны почек и мочевыделительной системы	*нечасто*	пиелонефрит, дизурия
	частота неизвесна	острое поражение почек, включая ОПН (см. раздел «Особенности применения»)
Беременность, послеродовой и перинатальный период	*часто*	патологические роды
Со стороны половых органов и молочных желез	*часто*	вульвовагинит, вульвовагинальный кандидоз, вульвовагинальная боль, вульвовагинальные нарушения
	нечасто	трихомонадный вульвовагинит, вагинальные инфекции, влагалищные выделения, нарушение менструального цикла, тазовая боль
	частота неизвесна	эндометриоз
Общие расстройства и реакции в месте введения	*нечасто*	боль в месте применения, зуд (в месте применения), местный отек, боль, лихорадка

Результаты исследований	*нечасто*	результаты микробиологического исследования вне нормы

* Псевдомембранозный колит как побочное явление характерно для всего класса антибактериальных средств.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о побочных реакциях после регистрации лекарственного средства имеет большое значение. Это позволяет проводить мониторинг соотношения польза/риск при применении этого лекарственного средства. Медицинским и фармацевтическим работникам, а также пациентам или их законным представителям следует сообщать о всех случаях подозреваемых побочных реакций и отсутствии эффективности лекарственного средства через Автоматизированную информационную систему по фармаконадзора по ссылке: https://aisf.dec.gov.ua

Срок годности

2 года.

Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

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

Упаковка

По 3 суппозитория в стрипе. По 1 стрипу в пачке из картона.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

Совместное украино-испанское предприятие в форме общества с ограниченной ответственностью «Сперко Украина».

Местонахождение производителя и адрес места его деятельности.

21027, Украина, г. Винница, ул. 600-летие, 25.

Заявитель

ЗАО "Формлига" / UAB "Farmlyga".

Местонахождение заявителя.

ул. Антакально, дом. 48А-304, Вильнюс, Литовская Республика / Antakalnio g. 48A-304, Vilnius, Республика Литва.