Амоксициллин Ватхэм



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы полусинтетических пенициллинов широкого спектра действия. Представляет собой 4-гидроксильный аналог ампициллина. Оказывает бактерицидное действие. Активен в отношении аэробных грамположительных бактерий: Staphylococcus spp. (за исключением штаммов, продуцирующих пенициллиназу), Streptococcus spp; аэробных грамотрицательных бактерий: Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Klebsiella spp.

К амоксициллину устойчивы микроорганизмы, продуцирующие пенициллиназу.

В комбинации с метронидазолом проявляет активность в отношении Helicobacter pylori. Полагают, что амоксициллин ингибирует развитие резистентности Helicobacter pylori к метронидазолу.

Между амоксициллином и ампициллином существует перекрестная резистентность.

Спектр антибактериального действия расширяется при одновременном применении амоксициллина и ингибитора бета-лактамаз клавулановой кислоты. В этой комбинации повышается активность амоксициллина в отношении Bacteroides spp., Legionella spp., Nocardia spp., Pseudomonas (Burkholderia) pseudomallei. Однако Pseudomonas aeruginosa, Serratia marcescens и множество других грамотрицательных бактерий остаются резистентными.

Фармакокинетика

При приеме внутрь амоксициллин быстро и полностью абсорбируется из ЖКТ, не разрушается в кислой среде желудка. C_{max} амоксициллина в плазме крови достигается через 1-2 ч. При увеличении дозы в 2 раза концентрация также увеличивается в 2 раза. В присутствии пищи в желудке не уменьшает общую абсорбцию. При в/в, в/м введении и приеме внутрь в крови достигаются сходные концентрации амоксициллина.

Связывание амоксициллина с белками плазмы составляет около 20%.

Широко распределяется в тканях и жидкостях организма. Сообщается о высоких концентрациях амоксициллина в печени.

$T_{1/2}$ из плазмы составляет 1-1.5 ч. Около 60% дозы, принятой внутрь, выводится в неизмененном виде с мочой путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; при дозе 250 мг концентрация амоксициллина в моче составляет более 300 мкг/мл. Некоторое количество амоксициллина определяется в кале.

У новорожденных и лиц пожилого возраста $T_{1/2}$ может быть более длительным.

При почечной недостаточности $T_{1/2}$ может составлять 7-20 ч.

В небольших количествах амоксициллин проникает через ГЭБ при воспалении мягкой мозговой оболочки.

Амоксициллин удаляется путем гемодиализа.

Показания к применению:

Для применения в виде монотерапии и в комбинации с клавулановой кислотой: инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными микроорганизмами, в т.ч. бронхит, пневмония, ангина, пиелонефрит, уретрит, инфекции ЖКТ, гинекологические инфекции, инфекционные заболевания кожи и мягких тканей, листериоз, лептоспироз, гонорея.

Для применения в комбинации с метронидазолом: хронический гастрит в фазе обострения, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, ассоциированные с Helicobacter pylori.

Относится к болезням:

- Ангина
- Бронхит
- Гастрит
- Гонорея
- Инфекции
- Лептоспироз
- Листериоз
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Уретрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

Инфекционный мононуклеоз, лимфолейкоз, тяжелые инфекции ЖКТ, сопровождающиеся диареей или рвотой, респираторные вирусные инфекции, аллергический диатез, бронхиальная астма, сенная лихорадка, повышенная чувствительность к пенициллинам и/или цефалоспоринам.

Для применения в комбинации с метронидазолом: заболевания нервной системы; нарушения кроветворения, лимфолейкоз, инфекционный мононуклеоз; повышенная чувствительность к производным нитроимидазола.

Для применения в комбинации с клавулановой кислотой: указания в анамнезе на нарушения функции печени и желтуху, связанные с приемом амоксициллина в комбинации с клавулановой кислотой.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Для приема внутрь разовая доза для взрослых и детей старше 10 лет (с массой тела более 40 кг) составляет 250-500 мг, при тяжелом течении заболевания - до 1 г. Для детей в возрасте 5-10 лет разовая доза составляет 250 мг; в возрасте от 2 до 5 лет - 125 мг; для детей в возрасте до 2 лет суточная доза составляет 20 мг/кг. Для взрослых и детей интервал между приемами 8 ч. При лечении острой неосложненной гонореи - 3 г однократно (в комбинации с пробенецидом). У пациентов с нарушением функции почек при КК 10-40 мл/мин интервал между приемами следует увеличить до 12 ч; при КК меньше 10 мл/мин интервал между приемами должен составлять 24 ч.

При парентеральном применении взрослым в/м - по 1 г 2 раза/сут, в/в (при нормальной функции почек) - 2-12 г/сут. Детям в/м - 50 мг/кг/сут, разовая доза - 500 мг, частота введения - 2 раза/сут; в/в - 100-200 мг/кг/сут. Пациентам с нарушением функции почек, дозу и интервал между введениями необходимо корректировать в соответствии со значениями КК.

Побочное действие:

Аллергические реакции: крапивница, эритема, отек Квинке, ринит, конъюнктивит; редко - лихорадка, боли в суставах, эозинофилия; в единичных случаях - анафилактический шок.

Эффекты, связанные с химиотерапевтическим действием: возможно развитие суперинфекций (особенно у пациентов с хроническими заболеваниями или пониженной резистентностью организма).

При длительном применении в высоких дозах: головокружение, атаксия, спутанность сознания, депрессия,

периферические невропатии, судороги.

Преимущественно при применении в комбинации с метронидазолом: тошнота, рвота, анорексия, диарея, запор, боли в эпигастрии, глоссит, стоматит; редко - гепатит, псевдомембранозный колит, аллергические реакции (крапивница, ангионевротический отек), интерстициальный нефрит, нарушения гемопоэза.

Преимущественно при применении в комбинации с клавулановой кислотой: холестатическая желтуха, гепатит; редко - многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, эксфолиативный дерматит.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Амоксициллин проникает через плацентарный барьер, в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

При необходимости применения амоксициллина при беременности следует тщательно взвесить ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода.

С осторожностью применять амоксициллин в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амоксицилин может уменьшать эффективность контрацептивов для приема внутрь.

При одновременном применении амоксициллина с бактерицидными антибиотиками (в т.ч. аминогликозидами, цефалоспоринами, циклосерином, ванкомицином, рифампицином) проявляется синергизм; с бактериостатическими антибиотками (в т.ч. макролидами, хлорамфениколом, линкозамидами, тетрациклинами, сульфаниламидами) - антагонизм.

Амоксициллин усиливает действие непрямых антикоагулянтов подавляя кишечную микрофлору, снижает синтез витамина К и протромбиновый индекс.

Амоксициллин уменьшает действие лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется ПАБК.

Пробенецид, диуретики, аллопуринол, фенилбутазон, НПВС уменьшают канальцевую секрецию амоксициллина, что может сопровождаться увеличением его концентрации в плазме крови.

Антациды, глюкозамин, слабительные средства, аминогликозиды замедляют и уменьшают, а аскорбиновая кислота повышает абсорбцию амоксициллина.

При комбинированном применении амоксициллина и клавулановой кислоты фармакокинетика обоих компонентов не меняется.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов, склонных к аллергическим реакциям.

Амоксициллин в комбинации с метронидазолом не рекомендуют применять у пациентов моложе 18 лет; не следует применять при заболеваниях печени.

На фоне комбинированной терапии с метронидазолом не рекомендуется употреблять алкоголь.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушением функции почек, дозу и интервал между введениями необходимо корректировать в соответствии со значениями КК.

При нарушениях функции печени

Амоксициллин в комбинации с метронидазолом не следует применять при заболеваниях печени.

Применение в детском возрасте

Применение у детей возможно согласно режиму дозирования.

Амоксициллин в комбинации с метронидазолом не рекомендуют применять у пациентов моложе 18 лет.

Источник: http://drugs.thead.ru/Amoksicillin_Vathem