Аугментин СР



Код АТХ:

- J01CR02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амоксициллин
- Клавулановая кислота

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки с модифицированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, капсуловидной формы, с гравировкой "AC 1000/62.5" на одной стороне и разделительной бороздкой - на другой.

	1 таб.
Слой, обеспечивающий немедленное высвобождение (НВ):	
амоксициллина тригидрат	654.1 мг,
что соответствует содержанию амоксициллина	562.5 мг
клавуланат калия	76.2 мг,
что соответствует содержанию клавулановой кислоты	62.5 мг
Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 136.4 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 18 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 6.3 мг, магния стеарат - 9 мг	
Слой, обеспечивающий постепенное высвобождение (ПВ):	
амоксициллин натрия	480.8 мг,
что соответствует содержанию амоксициллина	437.5 мг
Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 111.7 мг, смола ксантановая - 14 мг, лимонная кислота - 78 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 1.5 мг, магния стеарат - 14 мг	

Состав водной пленочной оболочки: гипромеллоза (6 ср) - 11.6 мг, гипромеллоза (15 ср) - 3.9 мг, титана диоксид - 15.1 мг, макрогол 3350 - 2.3 мг, макрогол 8000 - 2.3 мг.

2 шт. - блистеры (2) - упаковки объединенные с разделительной линией между ними (4) - пачки картонные.
2 шт. - блистеры (2) - упаковки объединенные с разделительной линией между ними (7) - пачки картонные.
2 шт. - блистеры (2) - упаковки объединенные с разделительной линией между ними (10) - пачки картонные.

Общая масса ядра таблетки - 1600 мг.
Общая масса таблетки, покрытой пленочной оболочкой - 1635.2 мг.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Амоксициллин — полусинтетический антибиотик широкого спектра действия, обладающий активностью против многих грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов. В то же время, амоксициллин подвержен разрушению β-лактамазами, и поэтому спектр активности амоксициллина не распространяется на микроорганизмы, которые продуцируют этот фермент.

Клавулановая кислота — ингибитор β-лактамаз, структурно родственный пенициллинам, обладает способностью инактивировать широкий спектр β-лактамаз, обнаруженных у микроорганизмов, устойчивых к пенициллинам и цефалоспоринам.

Клавулановая кислота обладает достаточной эффективностью в отношении плазмидных β-лактамаз, которые чаще всего обуславливают резистентность бактерий, и менее эффективна в отношении хромосомных β-лактамаз 1 типа, которые не ингибируются клавулановой кислотой.

Присутствие клавулановой кислоты в препарате Аугментин СР защищает амоксициллин от разрушения ферментами — β-лактамазами, что позволяет расширить антибактериальный спектр амоксициллина.

Замедленное высвобождение амоксициллина в препарате Аугментин СР позволяет сохранить чувствительность тех штаммов Streptococcus pneumoniae, у которых резистентность к амоксициллину обусловлена пенициллин-связывающими белками (пенициллин-резистентные Streptococcus pneumoniae, или PRSP).

Ниже приведена активность комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой in vitro.

Бактерии, обычно чувствительные к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой

Грамположительные аэробы: Bacillus anthracis, Enterococcus faecalis, Listeria monocytogenes, Nocardia asteroides, Streptococcus pneumoniae[1,2],Streptococcus pyogenes[1,2], Streptococcus agalactiae[1,2], Streptococcus группы Viridans[2], Streptococcus spp. (другие бета-гемолитические стрептококки)[1,2], Staphylococcus aureus (чувствительный к метициллину)[1], Staphylococcus saprophyticus (чувствительный к метициллину), Staphylococcus spp. (коагулазонегативные, чувствительные к метициллину).

Грамотрицательные аэробы: Bordetella pertussis, Haemophilus influenzae[1],Helicobacter pylori, Moraxella catarrhalis[1],Neisseria gonorrhoeae, Pasteurella multocida, Vibrio cholerae.

Прочие: Borrelia burgdorferi, Leptospira icterohaemorrhagiae, Treponema pallidum.

Грамположительные анаэробы: Clostridium spp., Peptococcus niger, Peplostreptococcus magnus, Peptostreptococcus micros, Peptostreptococcus spp.

Грамотрицательные анаэробы: Bacteroides fragilis, Bacteroides spp., Capnocytophaga spp., Eikenella corrodens, Fusobacterium nucleatum, Fusobacterium spp., Porphyromonas spp., Prevotella spp.

Бактерии, для которых вероятна приобретенная резистентность к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой

Грамотрицательные аэробы: Escherichia coli[1],Klebsiella oxytoca, Klebsiella pneumoniae[1], Klebsiella spp., Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Proteus spp., Salmonella spp., Shigella spp.

Грамположительные аэробы: Corynebacterium spp., Enterococcus faecium.

Бактерии, обладающие природной устойчивостью к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой

Грамотрицательные аэробы: Acinetobacter spp., Citrobacter freundii, Enterobacter spp., Hafnia alvei, Legionella pneumophila, Morganella morganii, Providencia spp., Pseudomonas spp., Serratia spp., Stenotrophomonas maltophilia, Yersinia enterocolitica.

Прочие: Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Chlamydia spp., Coxiella burnetti, Mycoplasma spp.

[1] — для данных видов микроорганизмов клиническая эффективность комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой была продемонстрирована в клинических исследованиях.

[2] — штаммы этих видов бактерий не продуцируют β-лактамазы. Чувствительность при монотерапии амоксициллином позволяет предполагать аналогичную чувствительность к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой.

Резистентность

Перекрестная резистентность

Амоксициллин непосредственно демонстрирует перекрестную резистентность с другими бета-лактамными антибиотиками, а также комбинацией бета-лактамных антибиотиков с ингибиторами β-лактамаз и цефалоспоринами.

Механизмы резистентности

Клавулановая кислота защищает амоксициллин от разрушающего действия β-лактамаз. Замедленное высвобождение действующих веществ препарата Аугментин СР повышает эффективность амоксициллина в отношении микроорганизмов, резистентность которых обусловлена модификацией пенициллин-связывающих белков.

Фармакокинетика

Всасывание

Оба действующие вещества препарата Аугментин СР, амоксициллин и клавулановая кислота, хорошо растворяются в водных растворах с физиологическим значением pH, быстро и полностью абсорбируются из ЖКТ после перорального приема. Всасывание действующих веществ оптимальна в случае его приема в приема пищи.

Ниже приведены фармакокинетические параметры амоксициллина и клавулановой кислоты после двукратного приема препарата Аугментин СР здоровыми добровольцами в начале приема пищи.

Среднее значение фармакокинетических параметров

Препарат	**Аугментин СР 1000/62.5 мг×2**	
	Амоксициллин	**Клавулановая кислота**
Доза (мг)	2000	125
T>МПК[1] ч (%)	5.9 (49.4)	не определено
C_{max} (мг/л)	17	2.05
T_{max} (ч)	1.5	1.03
AUC (мкг×ч/мл)	71.6	5.29
$T_{1/2}$ (ч)	1.27	1.03

T > МПК[1] ч (%) — время (в процентах от временного интервала между дозами), в течение которого концентрация препарата в крови выше минимальной подавляющей концентрации для конкретного возбудителя.

[1] - для бактерий с минимальной подавляющей концентрацией (МПК) 4 мг/л.

Аугментин СР имеет уникальный фармакологический профиль, показатель T > МПК, характерный для данного препарата, не достигается при приеме таблеток с немедленным высвобождением действующих веществ, содержащих комбинацию амоксициллина и клавулановой кислоты.

Распределение

Терапевтические концентрации амоксициллина и клавулановой кислоты создаются в различных тканях и интерстициальной жидкости (в желчном пузыре, тканях брюшной полости, коже, жировой и мышечной тканях, синовиальной и перитонеальной жидкостях, желчи, гнойном отделяемом).

Амоксициллин и клавулановая кислота обладают слабой степенью связывания с белками плазмы крови. Проведенные исследования показали, что с белками плазмы крови связывается 25% общего количества клавулановой кислоты и 18% амоксициллина.

В исследованиях на животных не было обнаружено кумуляции компонентов препарата Аугментин СР в каком-либо органе.

Амоксициллин, как и большинство пенициллинов, проникает в грудное молоко. В грудном молоке обнаружены также следовые количества клавулановой кислоты. За исключением возможности развития диареи и кандидоза слизистых оболочек полости рта, неизвестно никаких других негативных влияний амоксициллина и клавулановой кислоты на здоровье детей, вскармливаемых грудным молоком.

Исследования репродуктивной функции на животных при приеме препарата Аугментин СР показали, что амоксициллин и клавулановая кислота проникают через плацентарный барьер. Однако не было выявлено негативного влияния на плод.

Метаболизм

10-25 % от начальной дозы амоксициллина выводится почками в виде неактивного метаболита (пенициллоевой кислоты). Клавулановая кислота, подвергается интенсивному метаболизму до 2,5-дигидро-4-(2-гидроксиэтил)-5-оксо-1H-пиррол-3-карбоновой кислоты и 1-амино-4-гидрокси-бутан-2-она и выводится почками, через ЖКТ, а также с выдыхаемым воздухом в виде диоксида углерода.

Выведение

Как и другие пенициллины, амоксициллин выводится в основном почками, тогда как клавулановая кислота выводится как почечного, так и внепочечного механизмов. Исследования показали, что, в среднем, примерно 60-70% амоксициллина и около 40-65% клавулановой кислоты выводится почками в неизменном виде.

Показания к применению:

Лечение бактериальных инфекций следующих локализаций, вызванных чувствительными к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой микроорганизмами:

— инфекции дыхательных путей, например, внебольничная пневмония, обострение хронического бронхита, острый бактериальный синусит, обычно вызываемый Streptococcus pneumoniae (в т.ч. устойчивыми к пенициллину штаммами), Haemophilus influenzae*, Moraxella catarrhalis* и Streptococcus pyogenes;

— профилактика местных инфекций после хирургического вмешательства в стоматологии.

* — некоторые штаммы этих бактерий продуцируют β-лактамазы, что делает их нечувствительными к монотерапии амоксициллином.

Инфекции, вызванные чувствительными к амоксициллину микроорганизмами, можно лечить препаратом Аугментин СР, поскольку амоксициллин является одним из его действующих веществ. Препарат Аугментин СР также показан для лечения смешанных инфекций, обусловленных микроорганизмами, чувствительными к амоксициллину, а также микроорганизмами, продуцирующими β-лактамазу, чувствительными к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой.

Препарат Аугментин СР продемонстрировал эффективность в отношении штаммов Streptococcus pneumoniae, устойчивых к пенициллину (штаммы с МПК ≥2 мг/л).

Препараты, содержащие комбинацию амоксициллина с клавулановой кислотой, необходимо использовать согласно российским руководствам по антибиотикотерапии и региональным данным по чувствительности возбудителей к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой.

Чувствительность бактерий к комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой варьирует в зависимости от региона и с течением времени. Там, где это возможно, должны быть приняты во внимание локальные данные по чувствительности. В случае необходимости следует проводить сбор микробиологических образцов и анализ на бактериологическую чувствительность.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Инфекции
- Пневмония
- Синусит
- Стоматит

Противопоказания:

— предшествующие эпизоды желтухи или нарушение функции печени при применении комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой в анамнезе;

— повышенная чувствительность к амоксициллину, клавулановой кислоте, другим компонентам препарата, бета-лактамным антибиотикам (например, пенициллины, цефалоспорины) в анамнезе.

С *осторожностью:* нарушения функции печени.

Способ применения и дозы:

Принимается внутрь.

Для оптимизации всасывания препарат следует принимать в начале приема пищи.

Лечение не должно продолжаться более 14 дней без пересмотра клинической ситуации.

Таблетки имеют разделительную бороздку, позволяющую разламывать их пополам для удобства проглатывания, но не для уменьшения дозы: обе половины должны быть приняты одновременно.

Рекомендованная доза составляет 2 таб. 2 раза/сут.

Взрослые (16 лет и старше)

Инфекции дыхательных путей: 2 таб. 2 раза/сут в течение 7-10 дней, включая:

Внебольничная пневмония	2 таб. 2 раза/сут в течение 7-10 дней
Обострение хронического бронхита	2 таб. 2 раза/сут в течение 7 дней
Острый синусит бактериальной этиологии	2 таб. 2 раза/сут в течение 10 дней

Профилактика местных инфекций после хирургических стоматологических вмешательств: 2 таб. 2 раза/сут в течение 5 дней начиная через 3 ч после вмешательства.

У **детей до 16 лет** препарат не применяется.

Не требуется коррекции режима дозирования у **пожилых пациентов**.

Не требуется коррекции режима дозирования при **КК ≥ 30 мл/мин,** не рекомендуется при **КК < 30 мл/мин.** Не рекомендуется при **гемодиализе**.

При **нарушении функции печени** недостаточно данных для рекомендации режима дозирования для данной группы пациентов, поэтому препарат назначают с осторожностью при регулярном мониторинге функции печени.

Побочное действие:

Нежелательные явления, представленные ниже, перечислены в соответствии с поражением органов и систем органов и частотой встречаемости. Частота встречаемости определяется следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000).

Категории частоты были сформированы на основании клинических исследований препарата и пострегистрационного наблюдения.

Инфекции: часто - генитальный кандидоз (монилиаз), кожно-слизистый кандидоз.

Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы: редко - обратимые лейкопения (включая нейтропению), тромбоцитопения; очень редко - обратимые агранулоцитоз и гемолитическая анемия, увеличение времени кровотечения и протромбинового времени.

Со стороны иммунной системы: очень редко - ангионевротический отек, анафилактические реакции, синдром, сходный с сывороточной болезнью, аллергический васкулит.

Со стороны нервной системы: нечасто - головокружение, головная боль; очень редко - обратимые гиперактивность и судороги.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - диарея; часто - тошнота, абдоминальные боли; нечасто - рвота, расстройства пищеварения; очень редко - колиты, индуцированные приемом антибиотиков (включая псевдомембранозный колит и геморагический колит), черный "волосатый" язык.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто - умеренное повышение уровней АСТ и/или АЛТ. Данное явление наблюдалось у пациентов, получающих терапию бета-лактамными антибиотиками, однако клиническая значимость его неизвестна; очень редко - гепатит и холестатическая желтуха. Данное явление наблюдалось у пациентов, получающих терапию антибиотиками пенициллинового ряда и цефалоспоринами.

Нежелательные явления со стороны печени наблюдались, главным образом, у мужчин и пациентов пожилого возраста и могут быть связаны с длительной терапией. Перечисленные признаки и симптомы обычно встречаются в процессе или сразу по окончании терапии, однако в отдельных случаях могут не проявляться в течение нескольких недель по завершении терапии. Нежелательные реакции, как правило, обратимы. Нежелательные явления со стороны печени могут быть тяжелыми, в исключительно редких случаях были сообщения о летальных исходах. Почти во всех случаях это были пациенты с серьезной сопутствующей патологией или пациенты, получающие одновременно потенциально гепатотоксичные препараты.

Со стороны кожи и мягких тканей: нечасто - сыпь, зуд, крапивница; редко - многоформная эритема; очень редко - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, буллезный эксфолиативный дерматит, острый генерализованный экзантематозный пустулез. В случае возникновения любых аллергических реакций лечение препаратом Аугментин СР необходимо прекратить.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко - интерстициальный нефрит, кристаллурия.

Передозировка:

Симптомы: могут возникать симптомы со сторону ЖКТ и нарушения водно-электролитного баланса. Описана амоксициллиновая кристаллурия, в некоторых случаях приводящая к развитию почечной недостаточности.

Лечение: симптомы со стороны ЖКТ - симптоматическая терапия, уделяя особое внимание нормализации водно-электролитного баланса. В случае передозировки амоксициллин и клавулановая кислота могут быть удалены из кровотока путем гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В исследованиях репродуктивной функции у животных пероральное и парентеральное введение препарата Аугментин СР не вызывало тератогенных эффектов.

В единичном исследовании у женщин с преждевременным разрывом плодных оболочек было установлено, что профилактическая терапия препаратом может быть связана с повышением риска развития некротизирующего энтероколита у новорожденных. Как и все лекарственные препараты, Аугментин СР не рекомендуется применять во время беременности, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза применения для матери превышает потенциальный риск для плода.

Препарат Аугментин СР можно применять во время грудного вскармливания. За исключением возможности развития диареи или кандидоза слизистых оболочек полости рта, связанных с проникновением в грудное молоко следовых количеств действующих веществ этого препарата, никаких других неблагоприятных эффектов у младенцев, находящихся на грудном вскармливании, не наблюдалось. В случае возникновения неблагоприятных эффектов у младенцев, находящихся на грудном вскармливании, необходимо прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение препарата Аугментин СР и пробенецида не рекомендовано. Пробенецид снижает канальцевую секрецию амоксициллина, и поэтому одновременное применение препарата Аугментин СР и пробенецида может приводить к повышению и персистенции в крови концентрации амоксициллина, но не клавулановой кислоты.

Одновременное использование аллопуринола и амоксициллина может повышать риск возникновения кожных аллергических реакций. В настоящее время в литературе нет данных об одновременном применении комбинации амоксициллина с клавулановой кислотой и аллопуринола.

Пенициллины способны замедлять выведение из организма метотрексата за счет ингибирования его канальцевой секреции, поэтому одновременное применение препарата Аугментин СР и метотрексата может увеличить токсичность метотрексата.

Как и другие антибактериальные препараты, препарат Аугментин СР может оказывать влияние на кишечную микрофлору, приводя к снижению всасывания эстрогенов из ЖКТ и снижению эффективности комбинированных пероральных контрацептивов.

В литературе описываются редкие случаи увеличения международного нормализованного отношения (МНО) у пациентов при совместном применении аценокумарола или варфарина и амоксициллина.

При необходимости одновременного назначения препарата Аугментин СР с антикоагулянтами протромбиновое время или МНО должны тщательно мониторироваться при назначении или отмене препарата Аугментин СР, может потребоваться коррекция дозы антикоагулянтов для приема внутрь.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом лечения препаратом Аугментин СР необходимо собрать подробный анамнез, касающийся предшествующих реакций гиперчувствительности на пенициллины, цефалоспорины.

Описаны серьезные, а иногда летальные, реакции гиперчувствительности (анафилактические реакции) на пенициллины. Риск возникновения таких реакций наиболее высок у пациентов, имеющих в анамнезе реакции гиперчувствительности на пенициллины. В случае возникновения аллергической реакции необходимо прекратить лечение препаратом Аугментин СР и начать альтернативную терапию. При серьезных анафилактических реакциях следует незамедлительно ввести пациенту эпинефрин. Могут потребоваться также оксигенотерапия, в/в введение ГКС и обеспечение проходимости дыхательных путей, включающее интубацию.

В случае подозрения на инфекционный мононуклеоз препарат Аугментин СР не следует применять, поскольку у пациентов с этим заболеванием амоксициллин может вызывать кореподобную кожную сыпь, что затрудняет диагностику заболевания.

Длительное лечение препаратом Аугментин СР иногда приводит к чрезмерному размножению нечувствительных микроорганизмов.

С целью снижения риска развития побочных эффектов со стороны ЖКТ следует принимать препарат в начале приема пищи.

У пациентов, получавших комбинацию амоксициллина с клавулановой кислотой совместно с непрямыми (пероральными) антикоагулянтами, в редких случаях сообщалось об увеличении протромбинового времени (повышении МНО). При совместном назначении непрямых (пероральных) антикоагулянтов с комбинацией амоксициллина с клавулановой кислотой необходим мониторинг соответствующих показателей. Для поддержания необходимого эффекта пероральных антикоагулянтов может потребоваться корректировка их дозы.

Не требуется корректировки дозы препарата Аугментин СР для пациентов с клиренсом креатинина ≥30 мл/мин.

Не рекомендуется назначение препарата пациентам с клиренсом креатинина ниже 30 мл/мин.

У пациентов со сниженным диурезом в очень редких случаях сообщалось о развитии кристаллурии, преимущественно при парентеральном применении препарата. Во время приема высоких доз амоксициллина рекомендуется принимать достаточное количество жидкости и поддерживать адекватный диурез для уменьшения вероятности образования кристаллов амоксициллина.

Прием препарата Аугментин СР внутрь приводит к высокому содержанию амоксициллина в моче, что может приводить к ложноположительным результатам при определении глюкозы в моче (например, проба Бенедикта, проба Фелинга). В этом случае рекомендуется применять глюкозоксидантный метод определения концентрации глюкозы в моче.

Злоупотребление и лекарственная зависимость

Не наблюдалось лекарственной зависимости, привыкания и реакций эйфории, связанных с употреблением препарата Аугментин СР.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Поскольку препарат может вызывать головокружение, необходимо предупредить пациентов о мерах предосторожности при управлении транспортным средством или работе с движущимися механизмами.

При нарушениях функции почек

Не рекомендуется назначение препарата у пациентов с клиренсом креатинина ниже 30 мл/мин. У пациентов со сниженным диурезом в очень редких случаях сообщалось о развитии кристаллурии, преимущественно при парентеральном применении препарата. Во время приема высоких доз амоксициллина рекомендуется принимать достаточное количество жидкости и поддерживать адекватный диурез для уменьшения вероятности образования кристаллов амоксициллина.

Не требуется коррекции режима дозирования при **КК больше и равном 30 мл/мин,** не рекомендуется при **КК меньше 30 мл/мин.**

Не рекомендуется при **гемодиализе**.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью:* нарушения функции печени (требуется мониторинг функции печени).

Применение в пожилом возрасте

Не требуется коррекции режима дозирования у пожилых пациентов.

Применение в детском возрасте

У **детей до 16 лет** препарат не применяется.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не принимать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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