Азитромицин Экомед (таблетки)



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
азитромицин (в форме дигидрата)	250 мг

Вспомогательные вещества: лактулоза - 300 мг, кальция фосфата дигидрат - 59.8 мг, крахмал кукурузный - 24 мг, гипромеллоза - 5 мг, натрия лаурилсульфат - 1.2 мг, кроскармеллоза натрия - 20 мг, магния стеарат - 6 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до 700 мг.

Состав оболочки: (гипромеллоза - 9.49 мг, титана диоксид - 5.2 мг, макрогол 4000 - 4.16 мг, тальк - 1.12 мг, краситель тропеолин-О - 0.03 мг) - до 720 мг.

6 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
азитромицин (в форме дигидрата)	500 мг

Вспомогательные вещества: лактулоза - 600 мг, кальция фосфата дигидрат - 119.6 мг, крахмал кукурузный - 48 мг, гипромеллоза - 10 мг, натрия лаурилсульфат - 2.4 мг, кроскармеллоза натрия - 40 мг, магния стеарат - 12 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до 1400 мг.

Состав оболочки: (гипромеллоза - 18.98 мг, титана диоксид - 10.4 мг, макрогол 4000 - 8.32 мг, тальк - 2.24 мг, краситель тропеолин-О - 0.06 мг) - до 1440 мг.

3 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Азитромицин - бактериостатический антибиотик широкого спектра действия из группы макролидов-азалидов. Обладает широким спектром антимикробного действия. Механизм действия азитромицина связан с подавлением синтеза белка микробной клетки. Связываясь с 50S-субъединицей рибосомы, угнетает пептидтранслоказу на стадии трансляции и подавляет синтез белка, замедляя рост и размножение бактерий. В высоких концентрациях оказывает бактерицидное действие.

Обладает активностью в отношении ряда грамположительных, грамотрицательных, анаэробов, внутриклеточных и

других микроорганизмов. Микроорганизмы могут изначально быть устойчивыми к действию антибиотика или приобретать устойчивость к нему.

Микроорганизмы	**МИК, мг/л**	
	Чувствительные	**Устойчивые**
Staphylococcus	<1	>2
Streptococcus A, B, C, G	<0,25	>0,5
Streptococcus pneumonia	<0,25	>0,5
Haemophilus influenza	<0,12	>4
Moraxella catarrhalis	<0,5	>0,5
Neisseria gonorrhoeae	<0,25	>0,5

В большинстве случаев чувствительные микроорганизмы:

1. *Грамположительные аэробы:*

Staphylococcus aureus метициллин-чувствительный
Streptococcus pneumoniae пенициллин-чувствительный
Streptococcus pyogenes

2. *Грамотрицательные аэробы:*

Haemophilus influenzae
Haemophilus parainfluenzae
Legionella pneumophila
Moraxella catarrhalis
Pasteurella multocida
Neisseria gonorrhoeae

3. *Анаэробы:*

Clostridium perfringens
Fusobacterium spp.
Prevotella spp.
Porphyromonas spp.

4. *Другие микроорганизмы:*

Chlamydia trachomatis
Chlamydia pneumoniae
Chlamydia psittaci
Mycoplasma pneumoniae
Mycoplasma hominis
Borrelia burgdorferi

Микроорганизмы, способные развивать устойчивость к азитромицину

Streptococcus pneumoniae пенициллин-устойчивый

Изначально устойчивые микроорганизмы

Грамположительные аэробы:

Enterococcus faecalis
Staphylococci (метициллин-устойчивые стафилококки проявляют очень высокую степень устойчивости к макролидам)Грамположительные бактерии, устойчивые к эритромицину

Анаэробы

Bacteroides fragilis

Фармакокинетика

После приема внутрь азитромицин хорошо всасывается и быстро распределяется в организме. Биодоступность после однократного приема 500 мг - 37% (эффект "первого прохождения"), максимальная концентрация (0.4 мг/л) в крови создается через 2-3 ч, кажущийся объем распределения - 31.1 л/кг, связывание с белками плазмы обратно пропорционально концентрации в крови и оставляет 7-50%.

Проникает через мембраны клеток (эффективен при инфекциях, вызванных внутриклеточными возбудителями).

Транспортируется фагоцитами к месту инфекции, где высвобождается в присутствии бактерий. Легко проходит гистогематические барьеры и поступает в ткани. Концентрация в тканях в 10-50 раз выше, чем в плазме, а очаге инфекции - на 24-34% больше, чем в здоровых тканях.

У азитромицина очень долгий $T_{1/2}$ - 35-50 ч. $T_{1/2}$ из тканей значительно больше. Терапевтическая концентрация азитромицина сохраняется до 5-7 дней после приема последней дозы.

Азитромицин выводится, в основном, в неизменном виде - 50% кишечником, 6% почками. В печени деметилируется, теряя активность.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

— инфекции верхних отделов дыхательных путей и ЛОР-органов: фарингит, тонзиллит, синусит, средний отит;

— инфекции нижних отделов дыхательных путей: острый бронхит, обострение хронического бронхита, пневмония, в т.ч. вызванная атипичными возбудителями;

— инфекции кожи и мягких тканей: угри обыкновенные средней тяжести, рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы;

— начальная стадия болезни Лайма (боррелиоз) - мигрирующая эритема (erythema migrans);

— инфекции мочеполовых путей, вызванные Chlamydia trachomatis (уретрит, цервицит).

Относится к болезням:

- Бронхит
- Дерматит
- Импетиго
- Инфекции
- Отит
- Пневмония
- Рожа
- Синусит
- Тонзиллит
- Угри
- Уретрит
- Фарингит
- Цервицит
- Эритема

Противопоказания:

— гиперчувствительность к антибиотикам группы макролидов,

— гиперчувствительность к другим компонентам препарата;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— тяжелая почечная недостаточность (КК ниже 40 мл/мин);

— детский возраст до 12 лет с массой тела менее 45 кг;

— грудное вскармливание;

— одновременный прием с эрготамином и дигидроэрготамином.

С осторожностью

— миастения;

— нарушения функции печени легкой и средней степени тяжести;

— нарушения функции почек легкой и средней степени тяжести (КК более 40 мл/мин);

— у пациентов с наличием проаритмогенных факторов (особенно у пожилых пациентов): с врожденным или приобретенным удлинением интервала QT, у пациентов, получающих терапию антиаритмическими препаратами классов IA (хинидин, прокаинамид), III (дофетилид, амиодарон и соталол), цизапридом, терфенадином, антипсихотическими препаратами (пимозид), антидепрессантами (циталопрам), фторхинолонами (моксифлоксацин и левофлоксацин), с нарушениями водно-электролитного баланса, особенно в случае гипокалиемии или
гипомагниемии, с клинически значимой брадикардией, аритмией сердца или тяжелой сердечной недостаточностью;

— одновременное применение терфенадина, варфарина, дигоксина, циклоспорина.

Способ применения и дозы:

Азитромицин Экомед принимают внутрь, не разжевывая, 1 раз/сут, независимо от приема пищи. Препарат принимается, по крайней мере, за 1 ч до или через 2 ч после еды.

Взрослым (включая пожилых людей) и детям старше 12 лет с массой тела свыше 45 кг

При *инфекциях верхних и нижних отделов дыхательных путей, ЛОР-органов, кожи и мягких тканей:* по 0.5 г/сут в течение 3 дней (курсовая доза – 1.5 г).

При *угрях обыкновенных средней степени тяжести:* по 0.5 г/сут в течение 3 дней, затем по 0.5 г 1 раз в неделю в течение 9 недель. Первую еженедельную таблетку следует принять через 7 дней после приема первой ежедневной таблетки (8-й день от начала лечения), последующие 8 еженедельных таблеток - с интервалом в 7 дней. Курсовая доза 6.0 г.

При *мигрирующей эритеме:* 1 раз/сут в течение 5 дней, 1-й день 1.0 г, затем со 2-го по 5-й день по 0.5 г. Курсовая доза 3.0 г.

При *инфекциях мочеполовых путей, вызванных Chlamydia trachomatis (уретрит, цервицит):* 1.0 г однократно.

При применении у пациентов с **нарушениями функции почек легкой степени тяжести** коррекция дозы не требуется.

При применении у пациентов с **нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести**, у пожилых пациентов коррекция дозы не требуется.

Пожилые пациенты: коррекция дозы не требуется. Следует соблюдать осторожность у пожилых пациентов с постоянными проаритмогенными факторами в связи с высоким риском развития аритмий, в т.ч. аритмии типа "пируэт".

Побочное действие:

Частота побочных эффектов классифицирована в соответствии с рекомендациями ВОЗ: очень часто - не менее 10%; часто - не менее 1%, но менее 10%; нечасто - не менее 0.1%, но менее 1%; редко - не менее 0.01%, но менее 0.1%; очень редко - менее 0.01%; неизвестная частота - не может быть оценена исходя из имеющихся данных.

Инфекционные заболевания: нечасто - кандидоз, в т.ч. слизистой оболочки полости рта и гениталий, пневмония, фарингит, гастроэнтерит, респираторные заболевания, ринит; неизвестная частота - псевдомембранозный колит.

Со стороны крови и лимфатической системы: нечасто - лейкопения, нейтропения, эозинофилия; очень редко - тромбоцитопения, гемолитическая анемия.

Со стороны обмена веществ и питания: нечасто - анорексия.

Аллергические реакции: нечасто - ангионевротический отек, реакция гиперчувствительности; неизвестная частота - анафилактическая реакция.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, нарушение вкусовых ощущений, парестезии, сонливость, бессонница, нервозность; редко - ажитация; неизвестная частота - гипестезия, тревога, агрессия, обморок, судороги, психомоторная гиперактивность, потеря обоняния, извращение обоняния, потеря вкусовых ощущений, миастения, бред, галлюцинации.

Со стороны органа зрения: нечасто - нарушение зрения.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - расстройство слуха, вертиго; неизвестная частота - нарушение слуха, в т.ч. глухота и/или шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, приливы крови к лицу; неизвестная частота - понижение АД, увеличение интервала QT на ЭКГ, аритмия типа "пируэт", желудочковая тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, носовое кровотечение.

Со стороны ЖКТ: очень часто - диарея; часто - тошнота, рвота, боль в животе; нечасто - метеоризм, диспепсия, запор, гастрит, дисфагия, вздутие живота, сухость слизистой оболочки полости рта, отрыжка, язвы слизистой оболочки полости рта, повышение секреции слюнных желез; очень редко - изменение цвета языка, панкреатит.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто - гепатит; редко - нарушение функции печени, холестатическая желтуха; неизвестная частота - печеночная недостаточность (в редких случаях с летальным исходом, в основном на фоне тяжелого нарушения функции печени); некроз печени, фульминантный гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь, зуд, крапивница, дерматит, сухость кожи, потливость; редко - реакция фотосенсибилизации; неизвестная частота - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, многоформная эритема.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - остеоартрит, миалгия, боль в спине, боль в шее; неизвестная частота - артралгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто - дизурия, боль в области почек; неизвестная частота - интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

Со стороны половых органов и молочной железы: нечасто - метроррагии, нарушение функции яичек.

Прочие: нечасто - астения, недомогание, ощущение усталости, отек лица, боль в груди, лихорадка, периферические отеки.

Лабораторные данные: часто - снижение количества лимфоцитов, повышение количества эозинофилов, повышение количества базофилов, повышение количества моноцитов, повышение количества нейтрофилов, снижение концентрации бикарбонатов в плазме крови; нечасто - повышение активности АСТ, АЛТ, повышение концентрации билирубина в плазме крови, повышение концентрации мочевины в плазме крови, повышение концентрации креатинина в плазме крови, изменение содержания калия в плазме крови, повышение активности ЩФ в плазме крови, повышение содержания хлора в плазме крови, повышение концентрации глюкозы в крови, увеличение количества тромбоцитов, повышение гематокрита, повышение концентрации бикарбонатов в плазме крови, изменение содержания натрия в плазме крови.

Передозировка:

Симптомы: временная потеря слуха, тошнота, рвота, диарея.

Лечение симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Азитромицин при беременности рекомендуется назначать только в случаях, когда ожидаемая польза от его приема для матери превышает потенциальный риск для плода.

Во время лечения азитромицином грудное вскармливание приостанавливают.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антацидные препараты

Антацидные препараты не влияют на биодоступность азитромицина, но уменьшают максимальную концентрацию в крови на 30%, поэтому препарат следует принимать, по крайнее мере, за 1 ч до или через 2 ч после приема этих препаратов и еды.

Цетиризин

Одновременное применение в течение 5 дней у здоровых добровольцев азитромицина с цетиризином (20 мг) не привело к фармакокинетическому взаимодействию и существенному изменению интервала QT.

Диданозин (дидезоксиинозин)

Одновременное применение азитромицина (1200 мг/сут) и диданозина (400 мг/сут) у 6 ВИЧ-инфицированных пациентов не выявило изменения фармакокинетических показаний диданозина по сравнению с группой плацебо.

Дигоксин (субстраты Р-гликопротеина)

Одновременное применение макролидных антибиотиков, в т.ч. азитромицина, с субстратами Р-гликопротеина, такими как дигоксин, приводит к повышению концентрации субстрата Р-гликопротеина в сыворотке крови. Таким образом, при одновременном применении азитромицина и дигоксина необходимо учитывать возможность повышения концентрации дигоксина в сыворотке крови.

Зидовудин

Одновременное применение азитромицина (одноразовый прием 1000 мг и многократный прием 1200 или 600 мг) оказывает незначительное влияние на фармакокинетику, в т.ч. выведение почками зидовудина или его глюкуронидного метаболита. Однако применение азитромицина вызывало увеличение концентрации фосфорилированного зидовудина, клинически активного метаболита в мононуклеарах периферической крови. Клиническое значение этого факта неясно.

Азитромицин слабо взаимодействует с изоферментами системы цитохрома P450.

Не выявлено, что азитромицин участвует в фармакокинетических взаимодействиях аналогично эритромицину и другим макролидам. Азитромицин не является ингибитором и индуктором изоферментов цитохрома P450.

Алкалоиды спорыньи

Учитывая теоретическую возможность возникновения эрготизма, одновременное применение азитромицина с производными алкалоидов спорыньи не рекомендуется.

Были проведены фармакокинетические исследования одновременного применения азитромицина и препаратов, метаболизм которых происходит с участием изоферментов системы цитохрома P450.

Аторвастатин

Одновременное применение аторвастатина (10 мг ежедневно) и азитромицина (500 мг ежедневно) не вызывало изменения концентраций аторвастатина в плазме крови (на основе анализа ингибирования ГМГ-КоА-редуктазы). Однако в пострегистрационном периоде были получены отдельные сообщения о случаях рабдомиолиза у пациентов, получающих одновременно азитромицин и статины.

Карбамазепии

В фармакокинетических исследованиях с участием здоровых добровольцев не выявлено существенное влияние на концентрацию карбамазепина и его активного метаболита в плазме крови у пациентов, получавших одновременно азитромицин.

Циметидин

В фармакокинетических исследованиях влияния разовой дозы циметидина на фармакокинетику азитромицина не выявлены изменения фармакокинетики азитромицина, при условии применения циметидина за 2 ч до азитромицина.

Антикоагулянты непрямого действия (производные кумарина)

В фармакокинетических исследованиях азитромицин не влиял на антикоагулянтный эффект однократной дозы 15 мг варфарина, принимаемого здоровыми добровольцами. Сообщалось о потенцировании антикоагулянтного эффекта после одновременного применения азитромицина и антикоагулянтов непрямого действия (производные кумарина). Несмотря на то что причинная связь не установлена, следует учитывать необходимость проведения частого мониторинга ПВ при применении азитромицина у пациентов, которые получают пероральные антикоагулянты непрямого действия (производные кумарина).

Циклоспорин

В фармакокинетическом исследовании с участием здоровых добровольцев, которые в течение 3 дней принимали внутрь азитромицин (500 мг/сут однократно), а затем циклоспорин (10 мг/кг/сут однократно), было выявлено достоверное повышение C_{max} в плазме крови и AUC_{0-5} циклоспорина. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении этих препаратов. В случае необходимости одновременного применения этих препаратов необходимо проводить мониторинг концентрации циклоспорина в плазме крови и соответственно корректировать дозу.

Эфавиренз

Одновременное применение азитромицина (600 мг/сут однократно) и эфавиренза (400 мг/сут) ежедневно в течение 7 дней не вызывало какое-либо клинически значимое фармакокинетическое взаимодействие.

Флуконазол

Одновременное применение азитромицина (1200 мг однократно) не меняло фармакокинетику флуконазола (800 мг однократно). Общая экспозиция и $T_{1/2}$ азитромицина не изменялись при одновременном применении флуконазола, однако при этом наблюдали снижение C_{max} азитромицина (на 18%), что не имело клиническое значение.

Индинавир

Одновременное применение азитромицина (1200 мг однократно) не оказывало статистически достоверное влияние на фармакокинетику индинавира (по 800 мг 3 раза/сут в течение 5 дней).

Метилпреднизолон

Азитромицин не оказывает существенное влияние на фармакокинетику метилпреднизолона.

Нелфинавир

Одновременное применение азитромицина (1200 мг) и нелфинавира (по 750 мг 3 раза/сут) вызывает повышение C_{ss} азитромицина в сыворотке крови. Клинически значимые побочные эффекты не наблюдались, и коррекция дозы азитромицина при его одновременном применении с нелфинавиром не требуется.

Рифабутин

Одновременное применение азитромицина и рифабутина не влияет на концентрацию каждого из препаратов в сыворотке крови. При одновременном применении азитромицина и рифабутина иногда наблюдалась нейтропения. Несмотря на то, что нейтропения ассоциировалась с применением рифабутина, причинно-следственная связь между применением комбинации азитромицина и рифабутина и нейтропенией не установлена.

Силденафил

При применении у здоровых добровольцев не получены доказательства влияния азитромицина (500 мг/сут ежедневно в течение 3 дней) на AUC и C_{max} силденафила или его основного циркулирующего метаболита.

Терфенадин

В фармакокинетических исследованиях не были получены доказательства взаимодействия между азитромицином и терфенадином. Сообщалось о единичных случаях, когда возможность такого взаимодействия нельзя было исключить полностью, однако не было ни одного конкретного доказательства, что такое взаимодействие имело место. Было установлено, что одновременное применение терфенадина и макролидов может вызвать аритмию и удлинение интервала QT.

Теофиллин

Не выявлено взаимодействие между азитромицином и теофиллином.

Триазолам/мидазолам

Значительные изменения фармакокинетических показателей при одновременном применении азитромицина с триазоламом или мидазоламом в терапевтических дозах не выявлены.

Триметоприм/сульфаметоксазол

Одновременное применение триметоприма/сульфаметоксазола с азитромицином не выявило существенное влияние на C_{max}, общую экспозицию или экскрецию почками триметоприма или сульфаметоксазола. Концентрации азитромицина в сыворотке крови соответствовали выявляемым в других исследованиях.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае пропуска приема одной дозы - пропущенную дозу следует принять как можно раньше, а последующие - с перерывами в 24 ч.

Препарат следует принимать, по крайней мере, за 1 ч до или через 2 ч после приема антацидных препаратов.

Препарат следует применять с осторожностью пациентам с нарушением функции печени легкой и средней степени тяжести из-за возможности развития фульминантного гепатита и печеночной недостаточности тяжелой степени.

При наличии симптомов нарушения функции печени, таких как быстро нарастающая астения, желтуха, потемнение мочи, склонность к кровотечениям, печеночная энцефалопатия терапию препаратом следует прекратить и провести исследование функционального состояния печени.

При нарушении функции почек легкой и средней степени тяжести (КК более 40 мл/мин) терапию азитромицином следует проводить с осторожностью под контролем состояния функции почек.

Как и применение других антибактериальных препаратов, при терапии азитромицином следует регулярно обследовать пациентов на наличие невосприимчивых микроорганизмов и признаки развития суперинфекций, в т.ч. числе грибковых.

Препарат не следует применять более длительными курсами, чем указано в инструкции, т.к. фармакокинетические свойства азитромицина позволяют рекомендовать короткий и простой режим дозирования.

Нет данных о возможном взаимодействии между азитромицином и производными эрготамина и дигидроэрготамина, но из-за развития эрготизма при одновременном применении макролидов с производными эрготамина и дигидроэрготамина данная комбинация не рекомендована.

При длительном приеме азитромицина возможно развитие псевдомембранозного колита, вызванного Clostridium difficile, как в виде легкой диареи, так и тяжелого колита. При развитии антибиотик-ассоциированной диареи на фоне приема препарата, а также через 2 мес после окончания терапии следует исключить клостридиальный псевдомембранозный колит.

При лечении макролидами, в т.ч. азитромицином, наблюдалось удлинение сердечной реполяризации и интервала QT, повышающих риск развития сердечных аритмий, в т.ч. аритмии типа "пируэт".

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с наличием проаритмогенных факторов (особенно у пожилых пациентов): с врожденным или приобретенным удлинением интервала QT, у пациентов, принимающих антиаритмические препараты классов IA (хинидин, прокаинамид), III (дофетилид, амиодарон и соталол), цизапридом, терфенадином, антипсихотическими препаратами (пимозид), антидепрессантами (циталопрам), фторхинолонами (моксифлоксацин и левофлоксацин), с нарушениями водно-электролитного баланса, особенно в случае гипокалиемии или гипомагниемии, с клинически значимой брадикардией, аритмией сердца или тяжелой сердечной недостаточностью.

Применение азитромицина может спровоцировать развитие миастенического синдрома или вызвать обострение миастении.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При развитии нежелательных эффектов со стороны нервной системы и органов зрения следует соблюдать осторожность при выполнении действий, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте. Не использовать после истечения срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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