Азитромицин Маклеодз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые.

	1 таб.
азитромицин (в форме дигидрата)	250 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат 26.48 мг, крахмал прежелатинизированный 22.50 мг, кросповидон 29.50 мг, полисорбат 80 30.00 мг, кремния диоксид 8.00 мг, целлюлоза микрокристаллическая 125.50 мг, натрия лаурилсульфат 8.00 мг, тальк 3.02 мг, магния стеарат 2.50 мг.

Пленочная оболочка:
гипромеллоза 7.00 мг, титана диоксид 1.50 мг, макрогол 400 0.98 мг.

6 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
азитромицин (в форме дигидрата)	500 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат 52.96 мг, крахмал прежелатинизированный 45.00 мг, кросповидон 59.00 мг, полисорбат 80 60.00 мг, кремния диоксид 16.00 мг, целлюлоза микрокристаллическая 250.00 мг, натрия лаурилсульфат 16.00 мг, тальк 6.09 мг, магния стеарат 5.00 мг.

Пленочная оболочка:
гипромеллоза 14.40 мг, титана диоксид 3.51 мг, макрогол 400 2.00 мг.

3 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Азитромицин подавляет синтез белка в микробной ткани, связываясь с 50S-субъединицей рибосом. Азитромицин обладает широким спектром антибактериального действия.

Активен в отношении грамположительных аэробных микроорганизмов: Streptococcus spp. (групп A, B, C, G), Streptococcus pneumoniae (пенициллин-чувствительный), Streptococcus pyogenes, Staphylococcus aureus (метициллин-чувствительный); *грамотрицательных аэробных микроорганизмов:* Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Moraxella catarrhalis, Legionella pneumophila, Neisseria gonorrhoeae, Pasteurella multocida; *некоторых анаэробных микроорганизмов:* Prevotella spp., Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Porphyriomonas spp.; а также Chlamydia trachomatis, Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Mycoplasma pneumoniae, Mycoplasma hominis, Borrelia burgdorferi.

Микроорганизмы, способные развить устойчивость к азитромицину: грамположительные аэробы (Streptococcus pneumoniae(пенициллин-устойчивый)).

Изначально устойчивые микроорганизмы: грамположительные аэробы (Enterococcus faecalis, Staphylococcus spp. (метициллин- устойчивые стафилококки проявляют очень высокую степень устойчивости к макролидам), грамположительные бактерии, устойчивые к эритромицину); анаэробы (Bacteroides fragilis).

Фармакокинетика

Всасывание

Азитромицин быстро всасывается из ЖКТ, что обусловлено его устойчивостью в кислой среде и липофильностью. После однократного приема внутрь в дозе 500 мг значение C_{max} азитромицина в плазме крови достигается через 2.5-2.96 ч и составляет 0.4 мг/л. Биодоступность составляет 37%.

Прием пищи изменяет фармакокинетику азитромицина (в зависимости, от лекарственной формы), при приеме таблеток вместе с пищей увеличивается значение $C_{max\ на}$ 31%, не изменяется AUC.

Распределение

Кажущийся V_d - 31.1 л/кг, величина связывания с белками обратно пропорциональна концентрации в крови и составляет 7-50%. Азитромицин хорошо проникает в дыхательные пути, органы и ткани урогенитального тракта (в частности, в предстательную железу), в кожу и мягкие ткани. Высокая концентрация в тканях (в 10-50 раз выше, чем в плазме крови) и длительный $T_{1/2}$ обусловлены низким связыванием азитромицина с белками крови, а также его способностью проникать в эукариотические клетки и концентрироваться в среде с низким значением pH окружающей лизосомы. Это, в свою очередь, определяет большой кажущийся V_d и высокий клиренс в плазме крови. Способность азитромицина накапливаться преимущественно в лизосомах особенно важна для элиминации внутриклеточных возбудителей. Доказано, что фагоциты доставляют азитромицин в места локализации инфекции, где он высвобождается в процессе фагоцитоза. Концентрация азитромицина в очагах инфекции достоверно выше, чем в здоровых тканях (в среднем на 24-34%) и коррелирует со степенью тяжести воспалительного отека. Несмотря на высокую концентрацию в фагоцитах, азитромицин не оказывает существенного влияния на их функцию. Азитромицин сохраняется в бактерицидных концентрациях в очаге воспаления в течение 5-7 дней после приема последней дозы, что позволяет разработать короткие (3-дневные и 5-дневные курсы лечения).

Выведение

Выведение азитромицина из плазмы крови проходит в два этапа: $T_{1/2}$ составляет 14-20 ч в интервале от 8 до 24 ч после приема препарата и 41 ч - в интервале от 24 до 78 ч, что позволяет принимать препарат 1 раз/сут. Азитромицин не метаболизируется в организме больного; не подавляет изоэнзимы системы цитохрома P450. Из организма больного выводится преимущественно кишечником и частично почками (20%).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При приеме азитромицина женщинами увеличивается значение C_{max} в плазме, но данные изменения незначительны и не требуют коррекции дозы.

У пожилых пациентов (старше 65 лет) V_d несколько выше (на 30%) по сравнению с пациентами, возраст которых менее 45 лет, что клинически не значимо и не требует изменения дозировки.

Для пациентов с умеренными нарушениями функции почек (клиренс креатинина более 40 мл/мин) коррекция дозы не требуется.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату возбудителями:

— инфекции верхних дыхательных путей и ЛОР-органов (ангина, синусит, тонзиллит, средний отит);

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

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

— инфекции урогенитального тракта (уретрит и/или цервицит);

— болезнь Лайма (борелиоз), для лечения начальной стадии (erethema migrans).

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— тяжелая печеночная недостаточность (класс С по шкале Чайлд-Пью);

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

— период лактации;

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

— одновременный прием с эрготамином и дигидроэрготамином$

— повышенная чувствительность к азитромицину, другим антибиотикам группы макролидов или ингредиентам, входящим в состав готовой лекарственной формы.

С *осторожностью* применять препарат при печеночной недостаточности (классы А и В по шкале Чайлд-Пью), при почечной недостаточности (КК более 40 мл/мин), при аритмиях или предрасположенности к аритмиям и удлинению интервала QT, при совместном назначении терфенадина, варфарина,'дигоксина, при миастении.

Способ применения и дозы:

Внутрь, не измельчая таблетку и не разжевывая, 1 раз/сут, за 1 ч до еды или через 2 ч после еды.

Взрослым при *инфекциях верхних и нижних дыхательных путей, ЛОР-органов, кожи и мягких тканей* **-** 500 мг 1 раз/сут в течение 3 дней (курсовая доза -1.5 г).

При *инфекциях, передаваемых половым путем (неосложнбнный уретрит/цервицит)* - 1 г однократно; *осложненный, длительно протекающий уретрит/цервицит, вызванный Chlamydia trachomatis* - по 1 г 3 раза с интервалом в 7 дней (1-7-14). Курсовая доза - 3 г.

При *болезни Лайма - для лечения I стадии (erythema migrans)* - 1 г в первый день и 500 мг ежедневно 1 раз/сут со 2-го по 5-й день (курсовая доза - 3 г).

Детям от 12 месяцев до 12 лет назначают препарат только в виде суспензии.

Детям назначают из расчета 10 мг/кг 1 раз/сут в течение 3 дней или в первый день - 10 мг/кг, затем 4 дня - по 5-10 мг/кг/сут в течение 3 дней (курсовая доза - 30 мг/кг).

При *лечении начальной стадии болезни Лайма (erythema migrans)* у **детей** доза - 20 мг/кг в первый день и по 10 мг/кг - со 2-го по 5-й день.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения, нейтропения, эозинофилия, лимфопения, лейкопения, гемолитическая анемия.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: иногда - головокружение/вертиго, головная боль, сонливость, судороги; редко - парестезии, астения, бессонница, гиперактивность, агрессивность, беспокойство, нервозность, обморок, миастения, слабость.

Со стороны органов чувств: редко - шум в ушах; обратимое нарушение слуха вплоть до глухоты (при приеме в высоких дозах в течение длительного времени), нарушение восприятия вкуса и запаха, нарушение четкости

зрительного восприятия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - недомогание, боль в груди, снижение АД, ощущение сердцебиения, аритмия, включая желудочковую тахикардию, увеличение интервала QT, двунаправленная желудочковая тахикардия.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тоишота, рвота, диарея, абдоминальные боли и спазмы; иногда - метеоризм, расстройства пищеварения, анорексия; редко - запор, изменение цвета языка, гастрит, панкреатит, псевдомембранозный колит, холестатическая желтуха, гепатит, фульминантный гепатит, изменение значений лабораторных показателей функции печени; гипербилирубинемия, гипергликемия; очень редко - нарушения функции печени и некроз печени (возможно со смертельным исходом).

Аллергические реакции: иногда - зуд, кожные высыпания; редко - ангионевротический отек, крапивница, фотосенсибилизация, анафилактическая реакция (в редких случаях со смертельным исходом), многоформная эритема - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - артралгия.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - интерстициальный. нефрит, острая почечная недостаточность, повышение концентрации мочевины и креатинина в плазме, крови, периферические отеки.

Прочие: редко - вагинит, кандидоз, повышенная утомляемость, конъюнктивит.

Передозировка:

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

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Азитромицин проникает через плацентарный барьер. Применение при беременности возможно только в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Категория действия на плод по FDA — B.

При необходимости применения азитромицина в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антациды (алюминий и магнийсодержащие) не влияют, на биодоступность, но снижают концентрацию азитромицина в крови на 30%, поэтому интервал между их приемом должен составлять 1 ч до или 2 ч после приема указанных препаратов.

При одновременном применении с производными, эрготамина и дигидроэрготамина возможно усиление токсического действия (вазоспазм, дизестезия) последних.

При совместном применении с антикоагулянтами непрямого действия кумаринового ряда (варфарин) и азитромицина (в. обычных дозах) пациентам необходим тщательный контроль протромбинового времени.

Необходимо соблюдать осторожность при совместном применении терфенадина и азитромицина, поскольку было установлено, что одновременный прием терфенадина и макролидов вызывает аритмию и удлинение QT интервала. Исходя из этого, нельзя исключить вышеуказанных осложнений при совместном приеме терфенадина и азитромицина.

При одновременном применении с циклоспорином необходимо контролировать концентрацию циклоспорина в крови.

При одновременном применении с дигоксином необходим контроль, концентрации дигоксина в крови (возможно повышение всасывания дигоксина в кишечнике).

При одновременном применении с нелфинавиром возможно увеличение частоты побочных реакций азитромицина (снижение слуха, повышение активности печеночных трансаминаз).

При одновременном применении с зидовудином азитромицин не влияет на фармакокинетические параметры зидовудина в плазме крови или на выведение почками его и его метаболита глюкуронида, но увеличивается концентрация активного метаболита фосфорилированного зидовудина в моноядерных клетках периферических

сосудов.
Клиническое значение данного факта не определено.

Следует учитывать возможность ингибирования изофермента CYP3A4 азитромицином при одновременном применении с циклоспорином, терфенадином, алкалоидами спорыньи, цизапридом, пимозидом, хинидином, астемизолом и другими лекарственными средствами, метаболизм которых происходит с участием этого фермента.

Азитромицин не влияет на концентрацию карбамазепина, циметидина, диданозина, эфавиренза, флуконазола, индинавира, мидазолама, теофиллина, триазолама, триметоприма/сульфаметоксазола, цетиризина, силденафила, аторвастатина, рифабутина и метилпреднизолона в крови при одновременном применении.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат не обладает особенностями действия при первом приеме или при его отмене. В случае пропуска приема дозы пропущенную дозу следует принять как можно раньше, а последующие - с интервалом в 24 ч.

Препарат следует принимать за 1 ч до или 2 ч после приема антацидных лекарственных средств.

Принимать с осторожностью пациентам с умеренной печеночной недостаточностью из-за возможности развития фульминантного гепатита и тяжелой печеночной недостаточности у таких пациентов. При наличии симптомов нарушения функции печени (быстро нарастающая астения, желтуха, потемнение мочи, склонность к кровотечениям, печеночная энцефалопатия) терапию азитромицином следует прекратить и провести исследование функционального состояния печени.

При умеренной почечной недостаточности (КК более 40 мл/мин) применение азитромицина следует проводить под контролем функции почек.

Противопоказан одновременный прием азитромицина с производными эрготамина и дигидроэрготамина из-за возможного развития эрготизма.

При применении препарата как на фоне приема, так и через 2-3 недели после прекращения лечения возможно развитие диареи, вызванной Clostridium difficile (псевдомембранозный колит). В легких случаях достаточно отмены лечения и применения ионообменных смол (колестирамин, колестипол), в тяжелых случаях показано возмещение потери жидкости, электролитов и белка, назначение ванкомицина, бацитрацина или метронидазола. Нельзя применять лекарственные средства, тормозящие перистальтику кишечника.

Поскольку возможно удлинение интервала QT у пациентов, получавших макролиды, включая азитромицин, при применении азитромицина, следует соблюдать осторожность у пациентов с известными факторами риска удлинения интервала QT: пожилой возраст, нарушение электролитного баланса (гипокалиемия, гипомагниемия), синдром врожденного удлинения интервала QT, заболевания сердца (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия); одновременный прием лекарственных средств, способных удлинять интервал QT (в т.ч. антиаритмические лекарственные средства I A и III классов, трициклические и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики, фторхинолоны).

При применении азитромицина возможно развитие миастенического, синдрома или обострение миастении.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан:

— тяжелая почечная недостаточность (КК менее 40 мл/мин).

С *осторожностью* применять препарат при почечной недостаточности (КК более 40 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан:

— тяжелая печеночная недостаточность (класс С по шкале Чайлд-Пью).

С *осторожностью* применять препарат при печеночной недостаточности (классы А и В по шкале Чайлд-Пью).

Применение в детском возрасте

Противопроказан:

— детский возраст до 12 лет и массой тела менее 45 кг.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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