Азивок



Код АТХ:

- J01FA10

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Азитромицин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, желтовато-белого цвета с маркировкой "AZIWOK" и "WOCKHARDT" черного цвета; содержимое капсул - белый или почти белый порошок; размер капсулы №0.

	1 капс.
азитромицин	250 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, магния стеарат, натрия лаурилсульфат.
6 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибактериальное средство широкого спектра действия, азалид, действует бактериостатически. Связываясь с 50S субъединнцей рибосом, угнетает пептидтранслоказу на стадии трансляции, подавляет синтез белка, замедляет рост и размножение бактерий, в высоких концентрациях оказывает бактерицидный эффект.

Фармакодинамика

Азитромицин действует на вне- и внутриклеточных возбудителей.

Чувствительны: аэробные грамположителъные микроорганизмы - Streptococcus pneumoniae (пенициллинчувствительные), Streptococcus pyogenes, Staphylococcus aureus (метициллинчувствительные); *аэробные грамотрицательные микроорганизмы* - Haemophilus influenzae, Moraxella catarrhalis, Legionella pneumophila, Haemophilus parainfluenzae, Pasteurella multocida, Neisseria gonorrhoeae; *анаэробные микроорганизмы* - Prevotella spp., Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Porphyromonas spp.; *прочие* - Chlamydia trachomatis, Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Mycoplasma pneumoniae, Mycoplasma hominis, Borrelia burgdorferi.

Умеренно чувствительны или нечувствительны: аэробные грамположительные микроорганизмы - Streptococcus pneumoniae (умеренно чувствительные или резистентные к пенициллину).

Устойчивы: аэробные грамположительные микроорганизмы - Enterococcus faecalis, Staphylococcus spp., (метициллинустойчивые); *анаэробы* - группа Bacteroides fragilis.

Streptococcus pneumoniae, бета-гемолитические Streptococcus spp. группы A, Enterococcus faecalis и Staphylococcus aureus (включая метициллннустойчивые штаммы), резистентные к эритромицину и прочим макролидам, линкозамидам, устойчивы и к азитромицину.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция высокая, кислотоустойчив, липофилен. Биодоступность после однократного приема 0.5 г - 37% (эффект "первого прохождения" через печень), C_{max} после перорального приема 0.5 г - 0.4.мг/л, время достижения C_{max} - 2.5-2.9 ч; в тканях и клетках концентрация в 10-50 раз выше, чем в плазме крови, V_d - 31.1 л/кг.

Распределение

Легко проходит через гистогематические барьеры. Хорошо проникает в дыхательные пути, мочеполовые органы и ткани, в т.ч. предстательную железу, в кожу и мягкие ткани.

Проникает через мембраны клеток и создает высокие концентрации в них, накапливается в лизосомах (что особенно важно для эрадикации внутриклеточно расположенных возбудителей). Транспортируется также фагоцитами: полиморфно-ядерными лейкоцитами и макрофагами.

Концентрация в очагах инфекции достоверно выше (на 24-34%), чем в здоровых тканях, и коррелирует с выраженностью воспалительного отека. Сохраняется в эффективных концентрациях в течение 5-7 дней после приема последней дозы.

Связь с белками плазмы - 7-50 % (обратно пропорциональна концентрации в крови).

Метаболизм

В печени деметилируется, образуются неактивные метаболиты. В метаболизме препарата участвуют изоферменты CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7, ингибитором которых он является.

Выведение

Плазменный клиренс - 630 мл/мин. $T_{1/2}$ между 8 и 24 ч после приема - 14-20 ч, $T_{1/2}$ в интервале от 24 до 72 ч - 41 ч. 50% выводится с желчью в неизмененном виде, 6% - почками.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Прием пищи значимо изменяет фармакокинетику: C_{max} и AUC снижается на 52% и на 43% соответственно.

У пожилых мужчин (65-85 лет) фармакокинетические параметры не меняются, у женщин увеличивается C_{max} (на 30-50%).

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 (пневмония (в т.ч. вызванная атипичными возбудителями), бронхит);

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

— инфекции мочевыводящих путей (уретрит, цервицит (вызванные Chlamydia trachomatis));

— болезнь Лайма (начальная стадия - erythema migrans).

Относится к болезням:

- Бронхит
- Дерматит
- Импетиго
- Инфекции

- Инфекции мочевыводящих путей
- Отит
- Пневмония
- Рожа
- Синусит
- Тонзиллит
- Угри
- Уретрит
- Фарингит
- Цервицит

Противопоказания:

— тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность;

— одновременный прием эрготамина и дигидроэрготамина;

— период лактации;

— детский возраст (до 12 лет с массой тела менее 45 кг, для данной лекарственной формы);

— непереносимость лактозы, недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (т.к. в состав препарата входит лактоза);

— гиперчувствительность (в т.ч. к другим макроладам).

С осторожностью: умеренные нарушения функции печени и почек; аритмии (в т.ч. предрасположенность к аритмиям и удлинению интервала QT); одновременный прием с терфенадином, варфарином, дигоксином.

Способ применения и дозы:

Взрослым и детям старше 12 лет с массой тела более 45 кг: внутрь, за 1 ч до или через 2 ч после еды, 1 раз в сутки.

При *инфекциях верхних и нижних дыхательных путей, ЛОР-органов, кожи и мягких тканей* - 0.5 г/сут за 1 прием в течение 3 дней (курсовая доза - 1.5 г).

При *угрях обыкновенных* - 0.5 г/сут за 1 прием в течение 3 дней, затем по 0.5 г/сут 1 раз в неделю в течение 9 нед. Первую еженедельную капсулу следует принять через 7 дней после приема первой ежедневной капсулы (8 день от начала лечения), последующие 8 еженедельных капсул - с интервалом в 7 дней.

При *инфекциях мочевыводящих путей (уретрит или цервицит)* - однократно 1 г.

При *болезни Лайма - для лечения I стадии (erythema migrans)* - 1 г в первый день и 0.5 г ежедневно с 2 по 5 день (курсовая доза - 3 г).

Побочное действие:

Со стороны кровеносной системы: тромбоцитопения, нейтропения.

Со стороны нервной системы: головокружение/вертиго, головная боль, судороги, сонливость, парестезия, астения, бессонница, гиперактивность, агрессивность, беспокойство, нервозность.

Со стороны органов чувств: шум в ушах, обратимое нарушение слуха вплоть до глухоты (при приеме высоких доз в течение длительного времени), нарушение восприятия вкуса и запаха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения, аритмия, желудочковая тахикардия, увеличение интервала QT, двунаправленная желудочковая тахикардия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, абдоминальные боли/спазмы, метеоризм, расстройство пищеварения, анорексия, запор, изменение цвета языка, псевдомембранный колит, холестатическая желтуха, гепатит, изменение лабораторных показателей функции печени, печеночная недостаточность, некроз печени (возможно со смертельным исходом).

Аллергические реакции: зуд, кожные высыпания, ангионевротический отек, крапивница, эозинофилия, анафилактическая реакция, включая отек Квинке (в редких случаях со смертельным исходом), многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия.

Со стороны мочеполовой системы: интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

Прочие: вагинит, кандидоз, фотосенсибилизация.

Передозировка:

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

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия, гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат применяется только в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

В период лактации на время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антацидные средства не влияют на биодоступность азитромицина, но уменьшают C_{max} в крови на 30%, поэтому препарат следует принимать за 1 ч до или через 2 ч после приема этих препаратов и еды.

Азитромицин не влияет на концентрацию карбамазепина, диданозина, рифабутина и метилпреднизолона в крови при совместном применении.

При парентеральном применении азитромицин не влияет на концентрацию циметидина, эфавиренза, флуконазола, индинавира, мидазолама, триазолама, ко-тримоксазола в крови при совместном применении, однако не следует исключать возможности таких взаимодействий при назначении азитромицина для приема внутрь.

Азитромицин не влияет на фармакокинетику теофиллина, однако, при совместном приеме с другими макролидами концентрация теофиллина в плазме крови может повышаться.

При необходимости совместного применения с циклоспорином, рекомендуется контролировать содержание циклоспорина в крови. Несмотря на то, что данных о влиянии азитромицина на изменение концентрации циклоспорина в крови нет, другие представители класса макролидов способны изменять его концентрацию в плазме крови.

При совместном приеме дигоксина и азитромицина необходимо контролировать концентрацию дигоксина в крови, т.к. многие макролиды повышают всасывание дигоксина в кишечнике, увеличивая тем самым его концентрацию в плазме крови.

При необходимости совместного приема с варфарином рекомендуется проводить тщательный контроль протромбинового времени.

Было установлено, что одновременный прием терфенадина и антибиотиков класса макролидов вызывает аритмию и удлинение QT интервала. Исходя из этого, нельзя исключить вышеуказанных осложнений при совместном приеменении терфенадина и азитромицина.

Поскольку существует возможность ингибирования изофермеита CYP3A4 азитромицином в парентеральной форме при совместном применении с циклоспорином, терфенадином, алкалоидами спорыньи, цизапридом, пимозидом, хинидином, астемизолом и другими препаратами, метаболизм которых происходит с участием этого фермента, следует учитывать возможность такого взаимодействия при назначении азитромицина для приема внутрь.

При совместном приеме азитромицина и зидовудина, азитромицин не влияет на фармакокинетические параметры зидовудина в плазме крови или на выведение почками его и его глюкуронированного метаболита. Тем не менее, увеличивается концентрация акгивного метаболита - фосфорилированного зидовудина в моноядерных клетках периферических сосудов. Клиническое значение данного факта не ясно.

При одновременном приеме макролидов с эрготамином и дигидроэрготамином возможно проявление их токсического действия.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае пропуска приема одной дозы препарата, пропущенную дозу следует принять как можно раньше, а

последующие - с перерывами в 24 ч.

Так же как при проведении любой антибиотикотерапии, при лечении азитромицином, возможно присоединение суперинфекции (в т.ч. грибковой).

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

После отмены лечения реакции гиперчувствительности у некоторых пациентов могут сохраняться, что требует специфической терапии под наблюдением врача.

Влияние на способность управлять автотранспортом и механизмами

Учитывая побочные действия препарата со стороны ЦНС, необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и работе с механизмами, требующими концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек.

С осторожностью: умеренные нарушения функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

С осторожностью: умеренные нарушения функции печени.

Применение в детском возрасте

Протиовопоказан в детском возрасте (до 12 лет с массой тела менее 45 кг, для данной лекарственной формы).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 30°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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