Экозитрин



Код АТХ:

- J01FA09

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кларитромицин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

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

	1 таб.
кларитромицин	250 мг

Вспомогательные вещества: лактулоза - 300 мг, повидон-К25 - 9.1 мг, магния стеарат - 6.5 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 4.33 мг, тальк - 13 мг, полакрилин калия - до 650 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 9.52 мг, тальк - 1.14 мг, титана диоксид - 5.171 мг, макрогол-4000 - 4.14 мг, краситель азорубин - 0.029 мг.

4 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
4 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
5 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
5 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
4 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
5 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
7 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
14 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
4 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
5 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
7 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
10 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
14 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, капсуловидные, двояковыпуклые; на поперечном

разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или почти белого цвета.

	1 таб.
кларитромицин	500 мг

Вспомогательные вещества: лактулоза - 600 мг, повидон-К25 - 18.2 мг, магния стеарат - 13 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 8.66 мг, тальк - 26 мг, полакрилин калия - до 1300 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 14.28 мг, тальк - 1.71 мг, титана диоксид - 7.756 мг, макрогол-4000 - 6.21 мг, краситель азорубин - 0.044 мг.

4 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
4 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
5 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
5 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
4 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
5 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
7 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
14 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
4 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
5 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
7 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
10 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
14 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — антибактериальное широкого спектра.

Фармакодинамика

Полусинтетический макролидный антибиотик широкого спектра действия. Нарушает синтез белка микроорганизмов (связывается с 50S субъединицей мембраны рибосом микробной клетки). Действует на вне- и внутриклеточно расположенных возбудителей.

Активность кларитромицина в отношении большинства следующих микроорганизмов доказана *in vitro* и в клинической практике: аэробные грамположительные микроорганизмы — *Staphylococcus aureus, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes;* аэробные грамотрицательные микроорганизмы — *Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Moraxella catarrhalis, Legionella pneumophila*; другие микроорганизмы — *Mycoplasma pneumoniae, Chlamydia pneumoniae;* микобактерии — *Mycobacterium avium complex (MAC)* — комплекс, включающий: *Mycobacterium avium* и *Mycobacterium intracellulare; Helicobacter pylori*.

Бета-лактамазы не влияют на активность кларитромицина.

Активность кларитромицина *in vitro:* аэробные грамположительные микроорганизмы — *Listeria monocytogenes, Streptococcus agalactiae, Streptococci* групп *C,F,G*, *Streptococci* группы *viridans;* аэробные грамотрицательные микроорганизмы — *Neisseria gonorrhoeae, Bordetella pertussis, Pasteurella multocida;* анаэробные грамположительные микроорганизмы — *Clostridium perfringens, Peptococcus niger, Propionibacterium acnes;* анаэробные грамотрицательные микроорганизмы — *Bacteroides melaninogenicus;* спирохеты — *Borrelia burgdorferi, Treponema pallidum;* микобактерии — *Mycobacterium leprae, Mycobacterium chelonae*, кампилобактерии — *Campylobacter jejuni.*

Микробиологически активный метаболит кларитромицина — 14-гидроксикларитромицин вдвое более активен, чем исходное соединение по отношению к *Haemophilus influenzae.* Кларитромицин и его метаболит в сочетании могут оказывать как аддитивное, так и синергическое действие на *Haemophilus influenzae in vitro* и *in vivo*, в зависимости от штамма бактерии.

Большинство штаммов стафилококков, устойчивых к метициллину и оксациллину, резистентны к кларитромицину.

Возможно развитие перекрестной резистентности к кларитромицину и другим антибиотикам группы макролидов, а также линкомицину и клиндамицину.

Лактулоза, входящая в состав Экозитрина® в качестве бифидогенного фактора, является синтетическим дисахаридом, молекула которого состоит из остатков галактозы и фруктозы. Лактулоза в желудке и верхних отделах кишечника не всасывается и не гидролизуется. Высвобождающаяся из таблеток Экозитрина® лактулоза в качестве

субстрата ферментируется нормальной микрофлорой толстого кишечника, стимулируя рост бифидобактерий и лактобацилл. В результате гидролиза лактулозы в толстом кишечнике образуются органические кислоты — молочная, уксусная и муравьиная, подавляющие рост патогенных микроорганизмов и уменьшающие вследствие этого продукцию азотсодержащих токсических веществ.

Таким образом, лактулоза в составе Экозитрина® оказывает протективное действие на нормальную микрофлору кишечника, уменьшает явления интоксикации и нивелирует риск развития побочных эффектов, связанных с дисбиозами.

Показания к применению:

Взрослым:

— фарингит;

— тонзиллит;

— острый гайморит;

— обострение хронического бронхита;

— внебольничная пневмония;

— неосложненные инфекции кожи и подкожной клетчатки;

— диссеминированная инфекция, вызванная Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellulare.

— в комбинации с амоксициллином и омепразолом/лансопразолом в виде тройной терапии при инфекциях, вызванных Helicobacter pylori, включая язвенную болезнь двенадцатиперстной кишки.

Детям:

— фарингит;

— тонзиллит;

— внебольничная пневмония;

— острый гайморит;

— острый средний отит;

— неосложненные инфекции кожи и подкожной клетчатки;

— диссеминированная инфекция, вызванная Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellulare.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Гайморит
- Инфекции
- Отит
- Пневмония
- Тонзиллит
- Фарингит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к кларитромицину, другим антибиотикам группы макролидов, другим компонентам препарата;

— тяжелая печеночная недостаточность, протекающая одновременно с почечной недостаточностью;

— порфирия;

— гипокалиемия;

— одновременный прием цизаприда, астемизола, пимозида, терфенадина, эрготамина и других алкалоидов спорыньи;

— одновременное применение с ловастатином и симвастатином, с мидазоламом для перорального приема, с колхицином у пациентов с нарушенной функцией почек или печени, принимающих ингибиторы Р-гликопротеина или мощные ингибиторы изофермента CYP3A4;

— наличие у пациентов удлинения интервала QT в анамнезе, желудочковой аритмии или желудочковой тахикардии типа "пируэт";

— холестатическая желтуха/гепатит, возникшие при применении кларитромицина (в анамнезе);

— детский возраст до 12 лет (для данной лекарственной формы);

— период лактации (грудного вскармливания);

— непереносимость лактозы или недостаточность лактазы, а также глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью:

— почечная недостаточность средней и тяжелой степени;

— печеночная недостаточность средней и тяжелой степени;

— миастения gravis;

— одновременное применение с лекарственными препаратами, индуцирующими и метаболизирующимися изоферментом CYP3A4, бензодиазепинами (алпразолам, триазолам, мидазолам для в/в применения), антиаритмическими препаратами класса IA и III, блокаторами медленных кальциевых каналов, которые метаболизируются изоферментом CYP3A4;

— ИБС;

— тяжелая сердечная недостаточность;

— гипомагниемия;

выраженная брадикардия.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Таблетки следует проглатывать, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Взрослым и детям старше 12 лет и с массой тела более 33 кг:

при *фарингите и тонзиллите, вызванным Streptococcus pyogenes* - по 250 мг каждые 12 ч в течение 10 дней;

при *остром гайморите* - по 500 мг каждые 12 ч в течение 14 дней;

при *обострении хронического бронхита, вызванного Haemophilus influenzae* - по 500 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней; *вызванного Haemophilus parainfluenzae* - по 500 мг каждые 12 ч в течение 7 дней; *вызванного Moraxella catarrhalis*, *Streptococcus pneumoniae* - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней;

при *внебольничной пневмонии, вызванной Haemophilus influenzae* - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7 дней; *вызванной Streptococcus pneumoniae, Chlamydia pneumoniae, Mycoplasma pneumoniae* - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней;

при *неосложненных инфекциях кожи и подкожной клетчатки, вызванных Staphylococcus aureus, Streptococcus pyogenes* - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней.

Для лечения и профилактики инфекций, вызванных Mycobacterium avium, назначают по 500 мг 2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 1000 мг. Длительность лечения - 6 мес и более.

С целью эрадикации Helicobacter pylori

Комбинированное лечение тремя препаратами:

- кларитромицин - 500 мг, лансопразол - 30 мг и амоксициллин - 1000 мг 2 раза/сут в течение 10-14 дней;

- кларитромицин - 500 мг, омепразол - 20 мг и амоксициллин - 1000 мг 2 раза/сут в течение 10 дней.

Комбинированное лечение двумя препаратами:

- кларитромицин - 500 мг 3 раза/сут, омепразол - 40 мг/сут в течение 14 дней, с назначением омепразола в течение последующих 14 дней в дозе 20 мг/сут.

Для **пациентов с хронической почечной недостаточностью** (**КК менее 30 мл/мин или концентрации сывороточного креатинина более 3.3 мг/100 мл)** дозу снижают в 2 раза, либо в 2 раза увеличивают интервал. Максимальная длительность лечения у пациентов этой группы - 14 дней.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, беспокойство, бессонница, кошмарные сновидения, тремор, судороги, депрессия, дезориентация, галлюцинации, психоз, деперсонализация, спутанность сознания, усиление симптомов миастении gravis, психотические расстройства, парестезия, мания.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, ухудшение аппетита, тошнота, отрыжка, рвота, метеоризм, гастрит, гастралгия, диарея, стоматит, глоссит, кандидоз слизистой оболочки полости рта, изменение цвета языка и зубов, сухость слизистой оболочки полости рта, острый панкреатит, повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз, гепатоцеллюлярный и холестатический гепатит, холестатическая желтуха; редко - псевдомембранозный колит, печеночная недостаточность с летальным исходом в основном на фоне тяжелых сопутствующих заболеваний и/или сопутствующей лекарственной терапии, диспепсия, запор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: желудочковая тахикардия, в т.ч. типа "пируэт", трепетание и мерцание желудочков, увеличение интревала QT на ЭКГ.

Со стороны органов чувств: шум, звон в ушах, вертиго, изменение вкуса (дисгевзия), агевзия; в единичных случаях - потеря слуха, проходящая после отмены препарата, нарушение обоняния, аносмия.

Со стороны кожи и мягких тканей: эритразма, акне, рожа.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, миопатия, боль в грудной клетке.

Со стороны органов кроветворения: редко - тромбоцитопения, (необычные кровотечения, кровоизлияния), агранулоцитоз, тромбоцитоз, удлинение протромбинового времени, повышение уровня МНО.

Со стороны мочевыводящей системы: интерстициальный нефрит, почечная недостаточность.

Лабораторные показатели: лейкопения, нейтропения, эозинофилия, повышение концентрации билирубина в крови гиперкреатининемия, гипогликемия (в т.ч. при одновременном приеме гипогликемических препаратов), изменение цвета мочи.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, гиперемия кожи, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз, анафилактические реакции, лекарственная сыпь с эозинофилией и системной симптоматикой (DRESS-синдром), пурпура Шенлейна-Геноха, геморрагии.

Прочие: вторичные инфекции (развитие устойчивости микроорганизмов), интенсивное потоотделение, недомогание, астения, озноб, утомляемость.

Передозировка:

Симптомы: абдоминальная боль, тошнота, рвота, диарея.

Лечение: промывание желудка, поддерживающая терапия. Не удаляется при перитонеальном или гемодиализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения кларитромицина в период беременности не установлена. При беременности, особенно в I триместре, рекомендуется назначать кларитромицин, если польза от его приема превышает потенциальный риск для плода и/или отсутствует более безопасная терапия альтернативными препаратами. Если беременность наступила во время приема препарата, пациентку следует предупредить о возможном риске для плода.

При необходимости назначения препарата в период лактации следует решить вопрос об отмене грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При совместном приеме кларитромицина и ЛС, первично метаболизирующихся изоферментом CYP3A, возможно взаимное повышение их концентраций, что может усилить или продлить как терапевтические, так и побочные эффекты. Противопоказан совместный прием с астемизолом, цизапридом, пимозидом, терфенадином, эрготамином и другими алкалоидами спорыньи; алпразоламом, мидазоламом, триазоламом.

Назначают с осторожностью с карбамазепином, цилостазолом, циклоспорином, дизопирамидом, ловастатином, метилпреднизолоном, омепразолом, непрямыми антикоагулянтами (в т.ч. варфарином), хинидином, рифабутином, силденафилом, симвастатином, такролимусом, винбластином, а также фенитоином, теофиллином и вальпроевой кислотой (метаболизируются через другие изоферменты цитохрома P450).

При совместном применении с цизапридом, пимозидом, терфенадином и астемизолом возможно увеличение концентрации последних в крови, увеличение интервала QT, появление аритмии, включая желудочковую тахикардию, в т.ч. типа «пируэт», и фибрилляцию желудочков. Необходима коррекция дозы ЛС и контроль концентрации в крови.

При совместном применении с эрготамином и дигидроэрготамином возможно острое отравление препаратами группы эрготамина (сосудистый спазм, ишемия конечностей и других тканей, включая ЦНС).

Эфавиренз, невирапин, рифампицин, рифабутин и рифапентин (индукторы цитохрома P450) снижают уровень кларитромицина в плазме и ослабляют терапевтический эффект последнего, и вместе с тем, увеличивают уровень 14-гидроксикларитромицина.

При совместном приеме флуконазола в дозе 200 мг ежедневно и кларитромицина в дозе 1 г/сут возможно увеличение C_{SS} и AUC кларитромицина на 33 и 18% соответственно. Коррекция дозы кларитромицина не требуется.

При совместном приеме ритонавира 600 мг/сут и кларитромицина 1 г/сут возможно снижение метаболизма кларитромицина (увеличение C_{max} — на 31%, C_{SS} — на 182% и AUC — на 77%), полное подавление образования 14-гидроксикларитромицина. У пациентов с хронической почечной недостаточностью необходима коррекция дозы: при Cl креатинина 30–60 мл/мин доза кларитромицина должна быть уменьшена на 50%, <30 мл/мин — на 75%. Ритонавир не следует принимать совместно с кларитромицином в дозе, превышающей 1 г/сут.

При совместном приеме с хинидином и дизопирамидом возможно возникновение желудочковой тахикардии типа «пируэт». Необходим контроль ЭКГ (увеличение интервала QT), сывороточных концентраций этих ЛС.

Кларитромицин увеличивает концентрации ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы (ловастатин, симвастатин). Возможно развитие рабдомиолиза у пациентов, принимающих эти препараты совместно.

При применении кларитромицина и омепразола возможно увеличение C_{max}, AUC и $T_{1/2}$ омепразола на 30, 89 и 34% соответственно. Среднее значение pH в желудке в течение 24 ч составляло 5,2 — при приеме только омепразола и 5,7 — при приеме омепразола совместно с кларитромицином.

При применении кларитромицина и непрямых антикоагулянтов возможно усиление действия последних.

При применении кларитромицина с силденафилом, тадалафилом или варденафилом (ингибиторы фосфодиэстеразы-5) возможно увеличение ингибирующего воздействия на фосфодиэстеразу. Может потребоваться уменьшение дозы силденафила, тадалафила и варденафила.

При совместном применениии кларитромицина с теофиллином и карбамазепином возможно повышение концентрации последних в системном кровотоке.

При применении кларитромицина с толтеродином у пациентов с низким уровнем метаболизма через CYP2D6 может потребоваться снижение дозы толтеродина в присутствии кларитромицина (ингибитор CYP3A).

При совместном приеме кларитромицина (1 г/сут) с мидазоламом (перорально) возможно увеличение AUC мидазолама в 7 раз. Необходимо избегать совместного перорального приема кларитромицина с мидазоламом и другими бензодиазепинами, которые метаболизируются CYP3A (триазолам и алпразолам). При применении мидазолама (в/в) и кларитромицина может потребоваться корректировка дозы. Такие же меры предосторожности следует применять и к другим бензодиазепинам, которые метаболизируются CYP3A. Для бензодиазепинов, выведение которых не зависит от CYP3A (темазепам, нитразепам, лоразепам), маловероятно клинически значимое взаимодействие с кларитромицином.

При совместном приеме кларитромицина с колхицином возможно усиление действия колхицина. Необходим контроль возможного развития клинических симптомов интоксикации колхицином, особенно у пожилых пациентов и пациентов с хронической почечной недостаточностью (сообщалось о случаях с летальным исходом).

При совместном приеме кларитромицина и дигоксина следует тщательно контролировать концентрацию дигоксина в сыворотке (возможно повышение его концентрации и развитие потенциально летальных аритмий).

Одновременный прием кларитромицина и зидовудина взрослыми ВИЧ-инфицированными пациентами может привести к снижению C_{SS} зидовудина. Необходим подбор доз кларитромицина и зидовудина. Этот вид взаимодействия не встречается у ВИЧ-инфицированных детей, получающих кларитромицин в виде суспензии

совместно с зидовудином.

При совместном приеме кларитромицина (l г/сут) и атазанавира (400 мг/сут) возможно увеличение AUC атазанавира на 28%, кларитромицина в 2 раза и уменьшение AUC 14-гидроксикларитромицина на 70%. У пациентов с Cl креатинина 30–60 мл/мин доза кларитромицина должна быть уменьшена на 50%. Кларитромицин в дозах, превышающих 1 г/сут, нельзя назначать совместно с ингибиторами протеаз.

При совместном приеме кларитромицина и интраконазола возможно обоюдное увеличение концентрации препаратов в плазме. За пациентами, одновременно принимающими итраконазол и кларитромицин, необходимо тщательное наблюдение из-за возможного усиления или удлинения фармакологических эффектов этих ЛС.

При одновременном приеме кларитромицина (l г/сут) и саквинавира (в мягких желатиновых капсулах, 1200 мг 3 раза в день) возможно увеличение AUC и C_{SS} саквинавира на 177 и 187% соответственно, а кларитромицина — на 40%. При совместном назначении этих двух ЛС в течение ограниченного времени в дозах/лекарственных формах, указанных выше, корректировка дозы не требуется.

При совместном приеме с верапамилом возможно снижение АД, брадиаритмия и молочнокислый ацидоз.

Особые указания и меры предосторожности:

При наличии хронических заболеваний печени необходимо проводить регулярный контроль активности ферментов в сыворотке крови.

С осторожностью назначают на фоне ЛС, метаболизирующихся в печени (рекомендуется измерять их концентрацию в крови).

В случае совместного назначения с варфарином или другими антикоагулянтами необходимо контролировать ПВ.

При развитии вторичной инфекции должна быть назначена адекватная терапия.

При возникновении во время или после лечения тяжелой диареи следует исключить диагноз псевдомембранозного колита, который требует немедленной отмены препарата и назначения соответствующего лечения.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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