Клабакс ОД



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:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
кларитромицин	500 мг

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Макролидный бактериостатический антибиотик второго поколения из группы макролидов широкого спектра действия. Нарушает синтез белка микроорганизмов (связывается с 50S субъединицей мембраны рибосом микробной клетки). *Активен в отношении:* Streptococcus agalactiae (Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans, Streptococcus pneumoniae), Haemophilus influenzae (parainfluenzac), Haemophilus ducreyi, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Listeria monocytogenes, Legionella pneumophila, Mycoplasma pneumoniae, Helicobacter(Campylobacter) pylori,

Campylobacter jejuni, Chlamidia pneumoniae (trachomatis), Moraxella (Branhamella) catarrhalis, Bordetella pertussis, Propionibacterium acnes, Staphylococcus aureus, Ureaplasma urealyticum, Toxoplasma gondii, Corynebacterium spp., Borrelia burgdorferi, Treponema pallidum, Pasteurella multocida, некоторых анаэробов (Eubacteriumspp., Peptococcus spp., Propionibacterium spp., Clostridium perfringens, Bacteroides melaninogenicus) и всех микобактерий, кроме M.tuberculosis.

Основным метаболитом кларитромицина в организме человека является микробиологически активный метаболит 14-гидроксикларитромицин. Микробиологическая активность метаболита такая же, как у исходного вещества, или в 1-2 раза слабее в отношении большинства микроорганизмов. Исключение составляет H.influenzae, в отношении которого эффективность метаболита в два раза выше. Исходное вещество и его основной метаболит оказывают либо аддитивный, либо синергический эффект в отношении H.influenzae в условиях in vitro и in vivo в зависимости от культуры бактерий.

Фармакокинетика

Кларитромицин метаболизируется в системе цитохрома P450 3A (CYP3A) печени. Абсолютная биодоступность составляет около 50%. При многократном приеме дозы препарата кумуляции не обнаружено, и характер метаболизма в организме человека не изменялся.

Кларитромицин связывается с белками плазмы крови на 70% в концентрации от 0.45 до 4.5мкг/мл. При концентрации 45 мкг/мл связывание снижается до 41%, вероятно, в результате насыщения мест связывания. Это наблюдается только при концентрациях, многократно превышающих терапевтическую.

Прием кларитромицина пролонгированного действия внутрь в дозе 500 мг/сут позволяет поддерживать равновесные уровни максимальных концентраций кларитромицина и 14- гидроксикларитромицина в плазме крови. Равновесные C_{max} кларитромицина и 14-гидроксикларитромицина в плазме составляют 1.3 мкг/мл и 0.48 мкг/мл соответственно. $T_{1/2}$ исходного препарата и его основного метаболита составляют соответственно 5.3 ч и 7.7 ч. При приеме кларитромицина пролонгированного действия внутрь в дозе 1000 мг в день (2 таблетки по 500 мг) равновесные уровни C_{max} кларитромицина и 14-гидроксикларитромицина составляют, в среднем, 2.4 мкг/мл и 0.67 мкг/мл соответственно. $T_{1/2}$ исходного препарата и его основного метаболита составляют соответственно 5.8 ч и 8.9 ч. Значение T_{max} при приеме доз по 500 мг и 1000 мг/сут составляет около 6 ч. При равновесном состоянии уровень 14-гидроксикларитромицина не увеличивается пропорционально дозам кларитромицина, а $T_{1/2}$ кларитромицина и его основного метаболита увеличиваются с повышением дозы. Нелинейный характер фармакокинетики кларитромицина связан с уменьшением образования 14-гидроксилированного и N-деметилированного метаболитов при применении более высоких доз, что указывает на нелинейность метаболизма кларитромицина при приеме высоких доз. С мочой выделяется около 40 % дозы кларитромицина, через кишечник - около 30 %.

Кларитромицин и 14-гидроксикларитромицин широко распределяются в тканях и жидкостях организма. После перорального приема кларитромицина его содержание в спинномозговой жидкости остается невысоким (при нормальной проницаемости гемато-энцефалического барьера 1-2 % от уровня в сыворотке крови). Содержание в тканях обычно в несколько раз больше содержания в сыворотке крови.

Нарушения функции печени

У пациентов с умеренным и тяжелым нарушением функционального состояния печени, но с сохраненной функцией почек, корректировки дозы кларитромицина не требуется. Равновесная концентрация в плазме крови и системный клиренс кларитромицина не отличается у больных данной группы и здоровых пациентов.
C_{ss} 14-гидроксикларитромицина у людей с нарушениями функции печени ниже, чем у здоровых.

Нарушение функции почек

При нарушении функции почек увеличивается C_{min} и C_{max} кларитромицина в плазме крови, $T_{1/2}$, площадь под кривой концентрация-время кларитромицина и 14-OH метаболита. Константа элиминации и выведение с мочой уменьшаются. Степень изменения этих параметров зависит от степени нарушения функции почек.

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста уровень кларитромицина и его 14-OH метаболита в крови был выше, а выведение медленнее, чем у группы молодых людей. Считают, что изменения фармакокинетики у пожилых больных связаны, в первую очередь, с изменениями клиренса креатинина и функционального состояния почек, а не с возрастом пациентов.

Показания к применению:

Клабакс ОД показан для лечения инфекционных заболеваний, вызванных чувствительными микроорганизмами:

— инфекции нижнего отдела дыхательных путей (бронхиты, пневмония);

— инфекции верхнего отдела дыхательных путей (фарингиты, синуситы), отиты;

— инфекции кожи и мягких тканей (фолликулиты, рожистое воспаление);

— распространенные или локализованные микобактериальные инфекции, вызванные Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellular; локализованные инфекции, вызванные Mycobacterium chelonae, Mycobacterium fortuitum и Mycobacterium kamasii;

— Клабакс ОД показан для ликвидации H.pylori и снижения частоты рецидивов язвы двенадцатиперстной кишки, ассоциированной с H.pylori.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Воспаление
- Инфекции
- Отит
- Пневмония
- Синусит
- Фарингит
- Фолликулит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к антибиотикам из группы макролидов;

— одновременный прием кларитромицина с дериватами спорыньи;

— одновременный прием кларитромицина со следующими препаратами: цизаприд, пимозил, астемизол и терфенадин (у больных, принимающих эти препараты одновременно с кларитромицином, отмечается повышение их концентрации в крови; при этом возможно удлинение интервала QT и развитие сердечных аритмий, включая желудочковую пароксизмальную тахикардию, фибрилляцию желудочков и трепетание или мерцание желудочков);

— тяжелые нарушения функции печени и/или почек (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин);

— порфирия;

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

Способ применения и дозы:

Взрослые и дети старше 12 лет: обычно Клабакс® ОД назначают 500 мг 1 раз/сут во время еды. В тяжелых случаях дозу увеличивают до 500 мг 2 раза/сут. Таблетки Клабакс® ОД нельзя разламывать, разжевывать, их необходимо проглатывать целиком.

Продолжительность лечения 7-14 дней.

Для пациентов с КК 30-60 мл/мин только при тяжелых инфекциях возможно назначение в дозе 500мг 1 раз/сут (т.е. снижение суточной дозы на 50%).

Побочное действие:

Наиболее часто отмечаются жалобы со стороны ЖКТ (тошнота, диспепсия, боли в животе, рвота и диарея). Имеются сообщения о развитии псевдомембранозного колита от средне тяжелого течения до угрожающего жизни. К другим побочным реакциям относятся головные боли, нарушения вкуса и преходящее повышение активности ферментов печени.

Имеются сообщения о редких случаях развития парестезии, а также гепатита с повышением уровня ферментов печени в крови, развитием холестаза и желтухи, который в некоторых случаях был тяжелым, но, как правило, обратимым. В исключительных случаях наблюдалась печеночная недостаточность с летальным исходом.

Известно о редких случаях увеличения концентрации креатинина в сыворотке, развитии интерстициальных нефритов, а также почечной недостаточности.

При приеме кларитромицина наблюдались аллергические реакции, интенсивность которых варьировала от крапивницы и кожной сыпи до анафилаксии и синдрома Стивенса-Джонсона. Имеются сообщения о потере слуха в период лечения кларитромицином, который, в большинстве случаев, восстанавливался после отмены препарата. Также могут быть изменения восприятия вкуса, возникающие, как правило, вместе с нарушением вкуса.

Есть данные о развитии глосситов, стоматитов, кандидоза слизистой оболочки полости рта и изменении цвета языка

в период лечения кларитромицином. Сообщается также об обратимом в большинстве случаев изменении цвета зубов у больных, получавших кларитромицин.

В редких случаях отмечалась гипогликемия; в этих случаях гипогликемия развивалась у больных, принимавших в период лечения кларитромицином гипогликемические средства для перорального приема или инсулин.

Сообщается об отдельных случаях тромбоцитопении и лейкопении.

При приеме кларитромицина наблюдалось транзиторное побочное действие на ЦНС: головокружение, тревога, страх, бессонница, ночные кошмары, шум в ушах, спутанность сознания, дезориентация, галлюцинации, психозы и деперсонализация.

При лечении кларитромицином, как и при использовании других макролидов, крайне редко наблюдалось удлинение интервала QT, желудочковая аритмия, в том числе желудочковая пароксизмальная тахикардия и трепетание или мерцание желудочков.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, диарея, головная боль, спутанность сознания.

Лечение: немедленное промывание желудка и симптоматическое лечение. Гемодиализ и перитонеальный диализ не приводят к значительному изменению уровня кларитромицина в сыворотке крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность кларитромицина во время беременности и кормления грудью не установлена. Поэтому в период беременности кларитромицин назначают только в случае отсутствия альтернативной терапии, если предполагаемая польза превышает возможный риск для плода. Кларитромицин проникает в женское молоко, поэтому при необходимости его применения в период лактации кормление грудью следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном приеме увеличивает концентрацию в крови препаратов, метаболизирующихся в печени с помощью ферментов цитохрома Р450 - непрямых антикоагулянтов, карбамазепина, теофиллина, астемизола, цизаприда, терфенадина (в 2-3 раза), триазолама, мидазолама, циклоспорина, дизопирамида, фенитоина, рифабутина, ловастатина, дигоксина, алкалоидов спорыньи и др.

Сообщается о редких случаях острого некроза скелетных мышц, совпадающих по времени с одновременным назначением кларитромицина и ингибиторов гидроксиметилглутарил-КоА-редуктазы - ловастатина и симвастатина.

Имеются сообщения о повышении концентрации дигоксина в плазме больных, получавших одновременно дигоксин и таблетки кларитромицина. У таких больных необходимо постоянно контролировать содержание дигоксина в сыворотке, чтобы избежать дигиталисной интоксикации.

Кларитромицин может уменьшать клиренс триазолама и, таким образом, повышать его фармакологические эффекты с развитием сонливости и спутанности сознания.

Одновременное использование кларитромицина и эрготамина (дериваты спорыньи) может привести к острой эрготаминовой интоксикации, проявляющейся тяжелым вазоспазмом и ишемией конечностей и других тканей.

Одновременное назначение ВИЧ-инфицированным взрослым зидовудина перорально и таблеток кларитромицина может привести к уменьшению равновесных концентраций зидовудина. Учитывая то, что кларитромицин, вероятно, изменяет всасывание назначаемого внутрь одновременно с ним зидовудина, этого взаимодействия в значительной степени удается избежать при приеме кларитромицина и зидовудина в различные часы суток (с интервалом не менее 4 ч).

При одновременном назначении кларитромицина и ритонавира возрастают значения сывороточной концентрации кларитромицина. Коррекция дозы кларитромицина в этих случаях у больных с нормальной функцией почек не требуется. Однако у больных с КК от 30 до 60 мл/мин дозу кларитромицина следует снизить на 50%, а при КК менее 30 мл/мин не следует назначать таблетки кларитромицина пролонгированного действия. Таким больным назначается кларитромицин быстрого высвобождения 250 мг или 500 мг. При одновременном лечении ритонавиром не следует назначать кларитромицин в дозах свыше 1 г/сут.

Особые указания и меры предосторожности:

При наличии хронических заболеваний печени необходимо проводить регулярный контроль ферментов сыворотки крови.

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

В случае совместного назначения с варфарином или др. непрямыми антикоагулянтами необходимо контролировать протромбиновое время.

Необходимо обратить внимание на возможность перекрестной устойчивости между кларитромицином и другими антибиотиками из группы макролидов, а также линкомицином и клиндамицином.

При длительном или повторном применении препарата возможно развитие суперинфекции (повторное заражение теми же возбудителями на фоне развившейся болезни).

Детям до 12 лет рекомендуется применять Клабакс® в лекарственной форме гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь 250мг/5 мл, 125мг/5 мл.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин).

Для пациентов с КК 30-60 мл/мин только при тяжелых инфекциях возможно назначение в дозе 500мг 1 раз/сут (т.е. снижение суточной дозы на 50%).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Детям до 12 лет рекомендуется применять Клабакс® в лекарственной форме гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь 250мг/5 мл, 125мг/5 мл.

Условия хранения:

Список Б.

Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Х

Срок годности: 2 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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