Кларитромицин Пфайзер



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	**1 таб.**
кларитромицин	250 мг

7 шт. - блистеры (2) из двухслойной ПВХ/ПВДХ пленки и алюминиевой фольги - пачки картонные.

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

7 шт. - блистеры (2) из двухслойной ПВХ/ПВДХ пленки и алюминиевой фольги - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кларитромицин представляет собой полусинтетическое производное эритромицина А. В клетке восприимчивых бактерий кларитромицин проявляет противомикробную активность, связывая 50S рибосомальную субъединицу, и подавляя, таким образом, синтез белка. Действует на вне- и внутриклеточно расположенных возбудителей. Характер противомикробного действия кларитромицина преимущественно бактериостатический. Бета-лактамазы не влияют на активность кларитромицина.

Кларитромицин проявляет антибактериальную активность in vitro и в клинической практике в отношении следующего спектра микроорганизмов:

- аэробные грамположительные микроорганизмы: Staphylococcus aureus, Streptococcus pyogenes, Streptococcus pneumoniae;

- аэробные грамотрицательные микроорганизмы: Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Moraxella (Branhamella) catarrhalis;

- микобактери и комплекс Mycobacterium avium (MAC), состоящий из Mycobacterium avium, Mycobacterium intracellulars;

- микоплазмы: Mycoplasma pneumoniae;

- другие микроорганизмы: Chlamydia pneumoniae.

В следующих сочетаниях проявляет активность in vitro и в клинической практике в тношении Helicobacter pylori:

- комбинированная, терапия двумя препаратами: омепразол и кларитромицин; лансопразол и кларитромицин;

- комбинированная терапия тремя препаратами: лансопразол, кларитромицин и амоксициллин; омепразол, кларитромицин и амоксициллин.

Также кларитромицин оказывает действие in vitro в отношении большинства штаммов следующих микроорганизмов (однако безопасность и эффективность применения кларитромицина в клинической практике не подтверждена клиническими исследованиями и практическое значение остается неясным):

- аэробные грамположительные микроорганизмы: Streptococcus agalactiae. Streptococcus spp. группы viridans, Streptococci (группы C, F, G);

- аэробные грамотрицательные микроорганизмы: Bordetella pertussis, Legionella pneumophila, Pasteurella multocida;

- анаэробные грамположительные микроорганизмы: Clostridium perfringes, Peptococcus niger, Propionibacterium acnes;

- анаэробные грамотрицательные микроорганизмы: Prevotella melaninogenica (ранее Bacteroides melaninogenicus).

Метаболит кларитромицина 14-гидроксикларитромицин также обладает терапевтически значимой противомикробной активностью.

Фармакокинетика

Кларитромицин при приеме внутрь быстро и активно всасывается, его биологическая доступность составляет приблизительно 50%. Связь с белками плазмы - 65-75%. После приема внутрь 20-30% от принятой дозы кларитромицина быстро гидроксилируется в печени изоферментами CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 с образованием основного метаболита - 14(K)-гидроксикларитромицина, обладающего выраженной противомикробной активностью в отношении Haemophilus influenzae. Является ингибитором изоферментов CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. Кларитромицин и его 14-гидроксиметаболит быстро распределяются по всем тканям и жидкостям организма. После приема внутрь концентрация кларитромицина в тканях (особенно в легких) в несколько раз выше, чем в плазме крови. Прием пищи непосредственно перед назначением препарата немного замедляет начало всасывания кларитромицина, но не влияет на его биологическую доступность и образование активного метаболита 14-гидроксикларитромицина. Таким образом, кларитромицин может применяться вне зависимости от приема пищи.

Кларитромицин и 14-гидроксикларитромицин не кумулируют.

При назначении препарата 2 раза в сутки по 250 мг C_{max} кларитромицина в плазме достигалась через 2-3 дня и составляла в среднем 1 мкг/мл для кларитромицина и 0.6 мкг/мл для 14-гидроксикларитромицина, при этом периоды полувыведения исходного соединения и его метаболита составляли 3-4 и 5-6 часов, соответственно.

При назначении препарата 2 раза в сутки по 500 мг равновесные C_{max} кларитромицина и его гидроксилированного метаболита в плазме составляли в среднем 2.7-2.9 мкг/мл и 0.88-0.83 мкг/мл, соответственно. Период полувыведения исходного соединения при приеме дозы 500 мг составлял 5-7 часов, тогда как для 14-гидроксикларитромицина это значение составляло 7-9 часов.

После назначения более высоких доз кларитромицина отмечается дальнейшее увеличение C_{max} и продолжительности периода полувыведения, что свидетельствует о нелинейном характере фармакокинетики кларитромицина.

Выводится почками и кишечником (20-30% - в неизмененной форме, остальное - в виде метаболитов). При однократном приеме выводится почками 37% и кишечником 40%.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к кларитромицину микроорганизмами:

— инфекции нижних дыхательных путей (например, острый и, хронический бронхит, пневмония);

— инфекции верхних дыхательных путей (например, синусит и фарингит);

— инфекции кожи и мягких тканей (фолликулиты, флегмоны, рожа);

— диссеминированные или локализованные микобактериальные инфекции, вызванные, Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellulare;

— профилактика диссеминации инфекции, обусловленной комплексом Mycobacterium avium (MAC), ВИЧ-инфицированным больным с содержанием CD4+-лимфоцитов (Т-хелперных лимфоцитов) не более 100 в 1 $мм^3$;

— эрадикация H. pylori (в составе комбинированной терапии) и снижения частоты рецидивов язвы двенадцатиперстной кишки.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Инфекции

- Лимфома
- Пневмония
- Рожа
- Синусит
- Фарингит
- Флегмона
- Фолликулит

Противопоказания:

— одновременный прием астемизола, цизаприда, пимозида, терфенадина, эрготамина и других алкалоидов спорыньи, мидазолама для приема внутрь, алпразолама, триазолама (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»). У больных принимающих эти препараты одновременно с кларитромицином, отмечается повышение их концентраций в крови. При этом возможно удлинение интервала QT и развитие, сердечных аритмий, включая желудочковую пароксизмальную тахикардию, фибрилляцию желудочков и трепетание желудочков;

— порфирия;

— период лактации;

— детский возраст до 12 лет (ввиду невозможности адекватного подбора дозы);

— повышенная чувствительность к антибиотикам группы макролидов;

— гиперчувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: почечная и/или печеночная недостаточность, миастения gravis, одновременный прием лекарственных, средств, метаболизирующихся печенью, одновременный прием колхицина, беременность.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Фарингит или тонзиллит, вызванные S. pyogenes - 250 мг 2 раза в сутки в течение 10 дней.

Острый синусит, вызванный H. influenzae, M. catarrhalis, S. pneumoniae - 500 мг 2 раза в сутки в течение 14 дней.

Обострение хронического бронхита, вызванное:

- H. influenzae - 500 мг 2 раза в сутки в течение 7-14 дней,

- H. parainfluenzae - 500 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней,

- M.catarrhalis, S. pneumoniae - 250 мг 2 раза в сутки в течение 7-14 дней.

Внебольничная пневмония, вызванная:

- H. influenzae, H. parainfluenzae, M. catarrhalis - 250 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней,

- S. pneumoniae - 250 мг 2 раза в сутки в течение 7-14 дней,

- C. pneumoniae- 250 мг2 раза в сутки в течение 7-14 дней.

Неосложненные инфекции кожи и мягких тканей вызванные S. aureus, S. pyogenes - 250 мг 2 раза в сутки в течение 7-14 дней.

При инфекционных заболеваниях, вызванных микобактериями рекомендуемая начальная доза - по 500 мг 2 раза в сутки.

Лечение следует продолжать до тех пор, пока имеются клинические и микробиологические подтверждения его эффективности. Кларитромицин Пфайзер следует применять в комбинации с другими противомикробными препаратами.

Для эрадикации H.pylori.

Комбинированное лечение тремя препаратами

Кларитромицин Пфайзер, по 500 мг 2 раза в сутки, в комбинации с лансопразолом, по 30 мг 2 раза в сутки, и амоксициллином, по 1000 мг 2 раза в сутки, в течение 10-14 дней. Кларитромицин Пфайзер, по 500 мг 2 раза в сутки, в комбинации с амоксициллином, по 1000 мг 2 раза в сутки, и омепразолом, по 20 мг 2 раза в сутки, в течение 10

дней.

У пациентов с язвой желудка, диагностированной на момент начала терапии с целью заживления язвы и купирования симптомов рекомендуется прием омепразола в дозе 20 мг, один раз в сутки в течение еще 18 дней.

Комбинированное лечение двумя препаратами .

Кларитромицин Пфайзер, по 500 мг 3 раза в сутки, в комбинации с омепразолом в дозе 40 мг/сутки, в течение 14 дней, с назначением в течение следующих 14 дней омепразола в дозе 20-40 мг/сутки.

Кларитромицин, по 500 мг 3 раза в сутки, в комбинации с лансопразблом в дозе 60 мг/сутки, в течение 14 -дней. Для полного заживления язвы может потребоваться дополнительное снижение кислотности желудочного сока:

При хронической почечной недостаточности (ХПН)

Больным с клиренсом креатинина (КК) менее 30 мл/мин назначают половину обычной дозы препарата Кларитромицин Пфайзер или увеличивают интервалы между приемом препарата вдвое.

При печеночной недостаточности

При применении препарата Кларитромицин Пфайзер у больных с печеночной недостаточностью необходимо соблюдать осторожность. Однако, при сохранении нормальной функции почек больным с умеренной или тяжелой печеночной
недостаточностью коррекция дозы препарата Кларитромицин Пфайзер не требуется.

Пожилой возраст

Снижения дозы для лиц пожилого возраста не требуется.

Способ применения и дозы у детей

Применение препарата Кларитромицин Пфайзер у детей младше 12 лет или с массой тела меньше 33 кг противопоказано. У детей старше 12 лет препарат применяют в тех же дозах, что и у взрослых.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, беспокойство, бессонница, «кошмарные» сновидения, судороги, депрессия, дезориентация, галлюцинации, психоз, деперсонализация, спутанность сознания, тремор.

Со стороны пищеварительной системы: диспепсия, тошнота, рвота, гастралгия, диарея, стоматит, глоссит, кандидоз слизистой оболочки полости рта, изменение цвета языка и зубов, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатоцеллюлярный и холестатический гепатит, холестатическая желтуха псевдомембранозный колит, острый панкреатит, печеночная недостаточность с летальным исходом в основном на фоне тяжелых сопутствующих заболеваний и/или сопутствующей лекарственной терапии.

Со стороны сердечно-сосудистой системы (ССС): желудочковая тахикардия, в т.ч. типа «пируэт», трепетание и фибрилляция желудочков, удлинение интервала QT на ЭКГ.

Со стороны органов чувств: шум, звон в ушах, изменение вкуса (дисгевзия), увеит, потеря слуха,проходящая после отмены препарата, нарушение обоняния.

Со стороны органов, кроветворения: тромбоцитопения (необычные кровотечения, кровоизлияния), лейкопения, нейтропения.

Со стороны мочевыводящей системы: интерстициальный нефрит.

Лабораторные показатели: лейкопения, гиперкреатининемия, гипогликемия (в т.ч. при одновременном приеме гипогликемических лекарственных средств).

Аллергические реакции: кожная сыпь зуд, крапивница, гиперемия кожи, злокачественная экссудативная эритема - (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз, ангионевротический отек, анафилактические реакции.

Прочие: артралгия, миалгия, вторичные инфекции (развитие устойчивости микроорганизмов), анорексия, гипогликемия.

Передозировка:

Симптомы: абдоминальная боль, тошнота, рвота, диарея. Имеется сообщение об одном пациенте/с биполярным

расстройством, принявшем 8 г кларитромицина. У данного пациента, отмечались следующие, симптомы: нарушение психического статуса, параноидальное поведение, гипокалиемия и гипоксемия.

Лечение: промывание желудка, поддерживающая терапия. Не удаляется при гемо- или перитонеальном диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность кларитромицина во время беременности и в период грудного вскармливания не установлена. Поэтому применение препарата Кларитромицин Пфайзер во времябеременности возможно только при наличии четких показаний и только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Кларитромицин проникает в грудное молоко, поэтому, в период лактации следует прекратить грудное вскармливание из-за возможности серьезных побочных реакций у грудных детей.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном приеме кларитромицина и лекарственных средств, первично метаболизирующихся изоферментами CYP3A, возможно взаимное повышение их, концентраций, что может усилить или продлить как терапевтические, так и побочные эффекты. Противопоказан одновременный прием с астемизолом, цизапридом, пимозидом, терфенадином, эрготамином и другими алкалоидами спорыньи, алпразоламом, мидазоламом, триазоламом.

С осторожностью назначают с карбамазепином, цилостазолом, циклоспорином, дизопирамидом, ловастатином, метилпреднизолоном, омепразолом, непрямыми антикоагулянтами (в т.ч. варфарином), хинидином, рифабутином, силденафилом, симвастатином, такролимусом, винбластином, фенитоином, теофиллином и вальпроевой кислотой (метаболизируются через другие изоферменты цитохрома P450). Необходима коррекция дозы лекарственных средств и контроль концентрации в крови.

При одновременном применении с цизапридом, пимозидом, терфенадином и астемизолом возможно увеличение концентрации последних в крови удлинение интервала QT, появление аритмии включая желудочковую тахикардию в том числе типа «пируэт» и фибрилляцию желудочков.

При одновременном применении с эрготамином и дигидроэрготамином возможно острое отравление препаратами группы эрготамина (сосудистый спазм, ишемия конечностей и других тканей, включая центральную нервную систему).

Эфавиренз, невирапин, рифампицин, рифабутин и рифапентин (индукторы цитохрома P450) снижают концеотрацию кларитромицина в плазме и ослабляют его терапевтический эффект, и, вместе с тем, повышают концентрацию 14-гидроксикларитромицина.

При одновременном приеме флуконазола в дозе 200 мг ежедневно и кларитромицина в дозе 1 г/сут возможно увеличение равновесной концентрации (C_{ss}) и площади под кривой "концентрация-время" (AUC) кларитромицина на 33% и 18% соответственно. Коррекции дозы кларитромицина не требуется.

При одновременном 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 ХПН необходима коррекция дозы: при КК 30-60 мл/мин доза кларитромицина должна быть уменьшена на 50%, при КК менее 30 мл/мин на 75%. Ритонавир не следует принимать одновременно с кларитромицином в дозе, превышающей 1 г/сут.

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

Кларитромицин повышает концетрацию ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы (ловастатин, симвастатин), что связано с риском развития рабдомиолиза.

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 применений, кларитромицина и непрямых антикоагулянтов возможно, усиление действия последних.

При применении кларитромицина с силденафилом, тадалафилом или варденафилом (ингибиторы фосфодиэстеразы-5 (ФДЭ5)), возможно увеличение ингибирующего воздействия на ФДЭ. Может потребоваться снижение дозы ингибиторов ФДЭ5.

При одновременном применении кларитромицина с теофиллином и карбамазепином возможно повышение

концентрации последних в системном кровотоке.

При применении кларитромицина с толтеродином у пациентов, с низкой активностью изофермента CYP2D6 может потребоваться снижение дозы толтеродина в присутствии кларитромицина (ингибитор изоферментов CYP3A).

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

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

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

Одновременный прием кларитромицина (таблетки обычного высвобождения) и зидовудина у взрослых ВИЧ-инфицированных пациентов может привести к снижению C_{ss} зидовудина. Необходим подбор доз кларитромицина и зидовудина. Этот вид взаимодействия не встречается у ВИЧ-инфицированых детей, получающих кларитромицин в виде суспензии совместно с зидовудином.

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

При одновременном приеме кларитромицина и итраконазола возможно обоюдное повышение концентрации препаратов в плазме. За пациентами, одновременно принимающими итраконазол и кларитромицин, необходимо тщательное наблюдение из-за возможного усиления или удлинения фармакологических,эффектов этих лекарственных средств.

При одновременном приеме кларитромицина (1 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 лекарственных, средств в течение ограниченного времени в дозах и лекарственных формах, указанных выше, коррекции дозы не требуется. При совместном приеме с верапамилом возможно, снижение артериального давления, брадиарнтмия и молочнокислый ацидоз.

Особые указания и меры предосторожности:

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

С осторожностью применяют в комбинации с лекарственными средствами, метаболизирующимися печенью (рекомендуется контролировать их концентрацию в крови).

В случае одновременного применения, с варфарином или другими непрямыми антикоагулянтами необходимо контролировать протромбиновое время.

При заболеваниях сердца в анамнезе не рекомендуется одновременный прием с терфенадином, цизапридом, астемизолом.

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

Длительное или, многократное применение препарата Кларитромицин Пфайзер может привести к развитию резистентной микрофлоры (бактериальной или грибковой). При развитии вторичной инфекции необходимо прекратить прием препарата Кларитромицин Пфайзер. Необходимо назначение адекватной терапии.

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

У небольшого числа пациентов носителей H. pylori, может развиться резистентность к препарату Кларитромицин Пфайзер.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Прием препарата Кларитромицин Пфайзер может сопровождаться головокружением и другими нежелательными реакциями со стороны центральной нервной системы, в связи с ем следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами или сложной техникой.

При нарушениях функции почек

Больным с клиренсом креатинина (КК) менее 30 мл/мин назначают половину обычной дозы препарата Кларитромицин Пфайзер или увеличивают интервалы между приемом препарата вдвое.

При нарушениях функции печени

При применении препарата Кларитромицин Пфайзер у больных с печеночной недостаточностью необходимо соблюдать осторожность: Однако, при сохранении нормальной функции почек больным с умеренной или тяжелой печеночной
недостаточностью коррекция дозы препарата Кларитромицин Пфайзер не требуется.

Применение в пожилом возрасте

Снижения дозы для лиц пожилого возраста не требуется.

Применение в детском возрасте

Применение препарата Кларитромицин Пфайзер у детей младше 12 лет или с массой тела меньше 33 кг противопоказано. У детей старше 12 лет препарат применяют в тех же дозах, что и у взрослых.

Условия хранения:

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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