Кларитромицин Ретард-Obl



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

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

5 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бактериостатический антибиотик второго поколения из группы макролидов широкого спектра действия. Нарушает синтез белка микроорганизмов (связывается с 50Sсубъединицей мембраны рибосом микробной клетки). Действует на вне- и внутриклеточно расположенных возбудителей.

Активен в отношении: Streptococcus agalactiae, Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans, Streptococcus pneumoniae, Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Haemophilus ducreyi, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Listeria monocytogenes, Legionella pneumophila, Mycoplasma pneumoniae, Helicobacter(Campilobacter) pylori, Campilobacter jejuni, Chlamidia pneumoniae, Moraxella catarrhalis, Bordetella pertussis, Mycobacterium avium, Mycobacterium leprae, Staphylococcus aureus, Mycobacterium cansasii, Mycobacterium marinom, Ureaplasma urealyticum, Toxoplasma gondii, Corynebacterium spp., Borrelia burgdorferi, Pasteurella multocida, некоторых анаэробов (Eubacter spp., Peptococcus spp., Propionibacterium spp., Clostridium perfringens, Bacteroides melaninogenicus).

Фармакокинетика

Прием кларитромицина пролонгированного действия внутрь в дозе 500 мг в день позволяет поддерживать равновесные уровни C_{max} кларитромицина и 14-гидроксикларитромицина в плазме крови. Абсолютная биодоступность составляет около 50 %. 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/сут (2 таб. 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 1 000 мг/сут составляет около 6 ч.

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 гематоэнцефалического барьера 1-2 % от уровня в сыворотке крови). Содержание в тканях обычно в несколько раз больше содержания в сыворотке крови.

Кларитромицин метаболизируется в системе цитохрома P450 3A (CYP3A) печени. При многократном приеме 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 4,5 мкг/мл. При концентрации 45 мкг/мл связывание снижается до 41 %, вероятно, в результате насыщения мест связывания. Это наблюдается только при концентрациях, многократно превышающих терапевтическую.

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. Почками выделяется около 40% дозы кларитромицина, через кишечник - около 30 %.

Нарушения функции печени

У пациентов с умеренным и тяжелым нарушением функционального состояния печени, но с сохраненной функцией почек корректировки дозы кларитромицина не требуется. C_{ss}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-гидроксикларитромицина. Константа элиминации и выведение почками уменьшаются. Степень изменений этих параметров зависит от степени нарушения функции почек.

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста уровень кларитромицина и его 14-гидроксикларитромицина 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:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами, в т. ч. атипичными возбудителями:

— инфекции нижних отделов дыхательных путей (бронхит, пневмония);

— инфекции верхних отделов дыхательных путей (фарингит, синусит);

— инфекции кожи и мягких тканей (фолликулит, рожистое воспаление).

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к препаратам группы макролидов;

— тяжелая почечная недостаточность - КК менее 30 мл/мин;

— одновременный прием кларитромицина со следующими препаратами: астемизол, цизаприд, пимозид и терфенадин;

— порфирия;

— беременность;

— период лактации;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (для данной лекарственной формы).

С осторожностью: почечная и/или печеночная недостаточность, одновременный прием препаратов, метаболизирующихся печенью (рекомендуется измерять их концентрацию в крови).

Способ применения и дозы:

Внутрь, во время еды. Таблетки не следует разжевывать или разламывать, их необходимо проглатывать целиком.

Взрослым- 500 мг 1 раз/сут. При тяжелом течении инфекции дозу увеличивают до 1000 мг (2 таб.) 1 раз/сут. Длительность лечения - 6-14 дней.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - желудочковая аритмия, включая желудочковую тахикардию (при увеличении интервала QT).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, боли в области живота, рвота, диарея, гастралгия, панкреатит, глоссит, стоматит, кандидоз ротовой полости, изменение цвета языка и зубов; редко - псевдомембранозный энтероколит.

Изменение цвета зубов обратимо и обычно восстанавливается профессиональной чисткой у зубного врача. Редко отмечались нарушения функции печени, в том числе повышение активности «печеночных» трансаминаз, печеночноклеточный и/или холестатический гепатит с желтухой или без нее. Эти нарушения функции печени могут быть тяжелыми, но обычно они обратимы. Очень редко наблюдались случаи печеночной недостаточности и смертельного исхода, в основном, на фоне тяжелых сопутствующих заболеваний и/или сопутствующей лекарственной терапии.

Со стороны ЦНС: преходящие головные боли, головокружение, тревожность, бессонница, кошмарные сновидения, звон в ушах, деперсонализация, галлюцинации, судороги, страх; редко - психоз, спутанность сознания.

Со стороны органов чувств: отдельные случаи потери слуха. Однако, при прекращении приема кларитромицина слух восстанавливался. Также наблюдались случаи изменения обоняния, обычно в сопровождении с искажениями вкусовых ощущений.

Аллергические реакции: крапивница, гиперемия кожи, кожный зуд, анафилактические реакции, синдром Стивенса-Джонсона.

Изменения лабораторных показателей: лейкопения, тромбоцитопения, увеличение содержания креатинина в сыворотке крови; редко - гипогликемия (при одновременном приеме гипогликемических препаратов).

Прочие: развитие устойчивости микроорганизмов.

Передозировка:

Симптомы: нарушение функции ЖКТ, головная боль, спутанность сознания.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия. Гемодиализ и перитонеальный диализ не оказывает существенного влияния на уровень кларитромицина в сыворотке.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказано одновременное применение кларитромицина с цизапридом, пимозидом, терфенадином, астемизолом, так как это ведет к повышению концентрации этих препаратов в плазме крови в 2-3 раза, что может

вызвать удлинение интервала QT, нарушение ритма сердца, включая желудочковую тахикардию, фибрилляцию желудочков. При одновременном приеме кларитромицин увеличивает концентрацию в крови лекарственных препаратов, метаболизирующихся в печени с помощью ферментов цитохрома Р450: непрямых антикоагулянтов, карбамазепина, теофиллина, триазолама, мидазолама, циклоспорина, винбластина, дизопирамида, фенитоина, рифабутина, симвастатина, ловастатина, дигоксина, алпразолама, вальпроевой кислоты, цилостазола, метилпреднизолона, омепразола, хинидина, алкалоидов спорыньи, силденафила, такролимуса.

При одновременном приеме кларитромицина и зидовудина у ВИЧ-инфицированных пациентов отмечено понижение величины равновесной концентрации зидовудина, прием этих препаратов следует разделять по времени.

При одновременном применении ритонавира (по 200 мг каждые 8 ч) и кларитромицина (по 500 мг каждые 12 ч) метаболизм кларитромицина замедляется (C_{max} кларитромицина увеличивалась на 31%, C_{min}- на 182%, AUC- на 77%). Отмечено существенное замедление образования 14-гидроксикларитромицина. При приеме ритонавира не следует одновременно назначать кларитромицин в дозе более 1 г/сут. В этом случае у пациентов без нарушения функции почек нет необходимости в коррекции дозы кларитромицина. Это имеет большое значение в случае применения такой комбинации у пациентов с нарушениями функции почек: пациентам с клиренсом креатинина от 30 до 60 мл/мин дозу кларитромицина уменьшают на 50 % (до 500 мг 1 раз/сут). Возможно развитие перекрестной резистентности между кларитромицином, линкомицином и клиндамицином.

Особые указания и меры предосторожности:

При наличии хронических заболеваний печени необходимо регулярно контролировать содержание ферментов сыворотки крови.

В случае совместного назначения с варфарином или другими непрямыми антикоагулянтами следует периодически определять протромбиновое время.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин). Применять с осторожностью при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Применять с осторожностью при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет (для данной лекарственной формы).

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Не использовать после истечения срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Klaritromicin_Retard-Obl