Селемицин



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения прозрачный, бесцветный или слегка желтоватого цвета.

	1 мл	**1 фл.**
амикацин (в форме сульфата)	250 мг	500 мг

Вспомогательные вещества: натрия цитрат, натрия метабисульфит, серная кислота концентрированная, вода д/и.

2 мл - флаконы (100) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы аминогликозидов. Полусинтетический антибиотик широкого спектра действия, действует бактерицидно. Связываясь с 30S-субъединицей рибосом, препятствует образованию комплекса транспортной и матричной РНК, блокирует синтез белка, а также разрушает цитоплазматические мембраны бактерий.
Высокоактивен в отношении аэробных грамотрицательных микроорганизмов: Pseudomonas aeruginosa, Escherichia coli, Klebsiella spp., Serratia spp., Providencia spp., Enterobacter spp., Salmonella spp., Shigella spp., некоторых *грамположительных микроорганизмов:* Staphylococcus spp. (в т.ч. устойчивых к пенициллину и некоторым цефалоспоринам).

Препарат *умеренно активен в отношении* Streptococcus spp.

При одновременном назначении с бензилпенициллином проявляет синергизм в отношении штаммов Enterococcus faecalis.

Амикацин не теряет активности под действием ферментов, инактивирующих другие аминогликозиды, и может оставаться активным в отношении штаммов Pseudomonas aeruginosa, устойчивых к тобрамицину, гентамицину и нетилмицину.

Амикацин *не активен* в отношении анаэробных микроорганизмов.

Фармакокинетика

Всасывание

После в/м введения всасывается быстро и полностью. C_{max} в плазме крови при в/м введении препарата в дозе 7.5 мг/кг - 21 мкг/мл, после в/в инфузии в дозе 7.5 мг/кг в течение 30 мин - 38 мкг/мл. Время достижения C_{max} после в/м введения - около 1.5 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы 4-11%.

Хорошо распределяется во внеклеточной жидкости (содержимое абсцессов, плевральный выпот, асцитическая, перикардиальная, синовиальная, лимфатическая и перитонеальная жидкость); в высоких концентрациях обнаруживается в моче; в низких - в желчи, грудном молоке, водянистой влаге глаза, бронхиальном секрете, мокроте и спинномозговой жидкости. Хорошо проникает во все ткани организма, где накапливается внутриклеточно; высокие концентрации отмечаются в органах с хорошим кровоснабжением - легкие, печень, миокард, селезенка, и особенно в почках, где накапливается в корковом веществе; более низкие концентрации - в мышцах, жировой ткани и костях.

У взрослых при применении в средних терапевтических дозах (в норме) амикацин не проникает через ГЭБ, при воспалении мозговых оболочек проницаемость несколько увеличивается. У новорожденных достигаются более высокие концентрации в СМЖ, чем у взрослых.

Амикацин проникает через плацентарный барьер - обнаруживается в крови плода и амниотической жидкости.

V_d у взрослых - 0.26 л/кг, у детей - 0.2-0.4 л/кг, у новорожденных в возрасте менее 1 недели и с массой тела менее 1.5 кг - до 0.68 л/кг, в возрасте менее 1 недели и массой тела более 1.5 кг - до 0.58 л/кг, у больных муковисцидозом - 0.3-0.39 л/кг.

Средняя терапевтическая концентрация при в/в или в/м введении сохраняется в течение 10-12 ч.

Метаболизм

Не метаболизируется.

Выведение

$T_{1/2}$ в терминальной (β) фазе у взрослых - 2-4 ч, у новорожденных - 5-8 ч, у детей более старшего возраста - 2.5-4 ч. Конечная величина $T_{1/2}$ - более 100 ч (высвобождение из внутриклеточных депо).

Выводится почками путем клубочковой фильтрации (65-94%) преимущественно в неизмененном виде. Почечный клиренс - 79-100 мл/мин.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При нарушении функции почек у взрослых $T_{1/2}$ варьирует в зависимости от степени нарушения - до 100 ч, у больных с муковисцидозом - 1-2 ч. У больных с ожогами и гипертермией $T_{1/2}$ может быть короче по сравнению со средними показателями вследствие повышенного клиренса.

Выводится при гемодиализе (50% за 4-6 ч), перитонеальный диализ менее эффективен (25% за 48-72 ч).

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные грамотрицательными микроорганизмами (устойчивыми к гентамицину, сизомицину и канамицину) или ассоциациями грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов:

— инфекции дыхательных путей (бронхит, пневмония, эмпиема плевры, абсцесс легких);

— сепсис;

— септический эндокардит;

— инфекции ЦНС (включая менингит);

— инфекции брюшной полости (в т.ч. перитонит);

— инфекции мочеполовых путей (пиелонефрит, цистит, уретрит, простатит, гонорея);

— гнойные инфекции кожи и мягких тканей (в т.ч. инфицированные ожоги, инфицированные язвы и пролежни различного генеза);

— инфекции желчных путей;

— инфекции костей и суставов (в т.ч. остеомиелит);

— раневая инфекция;

— послеоперационные инфекции;

— отит.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Бронхит
- Гонорея
- Инфекции
- Менингит
- Ожоги
- Остеомиелит
- Отит
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Плеврит
- Пневмония
- Пролежни
- Простатит
- Сепсис
- Уретрит
- Цистит
- Эмпиема
- Эмпиема плевры
- Эндокардит

Противопоказания:

— неврит слухового нерва;

— тяжелая почечная недостаточность с азотемией и уремией;

— беременность;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата (в т.ч. к другим аминогликозидам) в анамнезе.

С *осторожностью* применяют препарат при миастении, паркинсонизме, ботулизме (аминогликозиды могут вызывать нарушение нервно-мышечной передачи, что приводит к дальнейшему ослаблению скелетной мускулатуры), дегидратации, почечной недостаточности, у новорожденных (особенно недоношенных детей), в пожилом возрасте, в период лактации (грудного вскармливания).

Способ применения и дозы:

В/м, в/в (струйно в течение 2 мин или капельно) по 5 мг/кг каждые 8 ч или по 7.5 мг/кг каждые 12 ч. При *бактериальных инфекциях мочевых путей (неосложненных)* - 250 мг каждые 12 ч; после сеанса гемодиализа может быть назначена дополнительная доза - 3-5 мг/кг. Максимальные дозы для **взрослых** - до 15 мг/кг/сут, но не более 1.5 г/сут в течение 10 дней.

Продолжительность лечения при в/в введении - 3-7 дней, при в/м - 7-10 дней.

Недоношенным новорожденным начальная доза - 10 мг/кг, затем по 7.5 мг/кг каждые 18-24 ч; **новорожденным** начальная доза - 10 мг/кг, затем по 7.5 мг/кг каждые 12 ч в течение 7-10 дней.

Пациентам с **почечной недостаточностью** требуется коррекция режима дозирования.

Пациентам с **ожогами** может потребоваться доза 5-7.5 мг/кг каждые 4-6 ч в связи с более коротким $T_{1/2}$ (1-1.5 ч) у этих больных.

Для в/в введения применяют те же растворы, что и для в/м, предварительно разбавив их 200 мл 5% раствора декстрозы или 0.9% раствора натрия хлорида. Концентрация амикацина в растворе для в/в введения не должна превышать 5 мг/мл.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, нарушения функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия).

Со стороны системы кроветворения: анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, сонливость, нейротоксическое действие (подергивание мышц, ощущение онемения, покалывания, эпилептические припадки), нарушение нервно-мышечной передачи (остановка дыхания).

Со стороны органов чувств: ототоксичность (снижение слуха, вестибулярные и лабиринтные нарушения, необратимая глухота), токсическое действие на вестибулярный аппарат (дискоординация движений, головокружение, тошнота, рвота).

Со стороны мочевыделительной системы: нефротоксичность - нарушение функции почек (олигурия, протеинурия, микрогематурия).

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, гиперемия кожи, лихорадка, отек Квинке.

Передозировка:

Симптомы: токсические реакции (потеря слуха, атаксия, головокружение, расстройства мочеиспускания, жажда, снижение аппетита, тошнота, рвота, звон или ощущение закладывания в ушах, нарушение дыхания).

Лечение: для снятия блокады нервно-мышечной передачи и ее последствий - гемодиализ или перитонеальный диализ; антихолинэстеразные средства, соли кальция, искусственная вентиляция легких, другая симптоматическая и поддерживающая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Селемицина при беременности и в период лактации возможно при наличии жизненных показаний (аминогликозиды проникают в грудное молоко в небольших количествах, однако их абсорбция из ЖКТ низкая, и осложнений у грудных детей, связанных с их применением, не зарегистрировано).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармацевтически несовместим с пенициллинами, гепарином, цефалоспоринами, капреомицином, амфотерицином В, гидрохлоротиазидом, эритромицином, нитрофурантоином, витаминами группы В и С, калия хлоридом.

Амикацин проявляет синергизм при взаимодействии с карбенициллином, бензилпенициллином, цефалоспоринами (у больных с тяжелой хронической почечной недостаточностью при совместном применении с бета-лактамными антибиотиками возможно снижение эффективности аминогликозидов).

Налидиксовая кислота, полимиксин В, цисплатин и ванкомицин увеличивают риск развития ото- и нефротоксичности.

Диуретики (особенно фуросемид), цефалоспорины, пенициллины, сульфаниламиды и НПВС, конкурируя за активную секрецию в канальцах нефрона блокируют элиминацию аминогликозидов, повышают их концентрацию в сыворотке крови, усиливая нефро- и нейротоксичность.

Усиливает миорелаксирующее действие курареподобных препаратов.

Метоксифлуран, полимиксины для парентерального введения, капреомицин и другие лекарственные средства, блокирующие нервно-мышечную передачу (галогенизированные углеводороды в качестве препаратов для ингаляционной анестезии, опиоидные анальгетики), переливание большого объема крови с цитратными консервантами - повышают риск остановки дыхания (особенно при внутрибрюшинном введении амикацина).

Парентеральное введение индометацина повышает риск развития токсического действия аминогликозидов (увеличение $T_{1/2}$ и снижение клиренса).

Амикацин уменьшает эффективность лекарственных средств для лечения миастении.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед применением препарата определяют чувствительность выделенных возбудителей, используя диски, содержащие 30 мкг амикацина. При диаметре свободной от роста зоны 17 мм и более микроорганизм считается чувствительным, от 15 до 16 мм - умеренно чувствительным, менее 14 мм - устойчивым.

Концентрация амикацина в плазме не должна превышать 25 мкг/мл (терапевтической является концентрация 15-25

мкг/мл).

В период лечения необходимо не реже 1 раза в неделю контролировать функцию почек, слухового нерва и вестибулярного аппарата.

Вероятность развития нефротоксичности выше у больных с нарушением функции почек, а также при назначении препарата в высоких дозах или в течение длительного времени (у этой категории больных может потребоваться ежедневный контроль функции почек).

При неудовлетворительных аудиометрических тестах дозу препарата снижают или прекращают лечение.

Пациентам с инфекционно-воспалительными заболеваниями мочевыводящих путей рекомендуется принимать повышенное количество жидкости.

При отсутствии положительной клинической динамики следует помнить о возможности развития резистентных микроорганизмов. В подобных случаях необходимо отменить лечение и начать проведение соответствующей терапии.

Содержащийся в ампулах натрия метабисульфит может обусловливать развитие у больных аллергических осложнений (вплоть до анафилактических реакций), особенно у больных с аллергическим анамнезом.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почеченой недостаточности, пациентам с **почечной недостаточностью** требуется коррекция режима дозирования.

Применение в пожилом возрасте

Препарат с осторожностью назначают в пожилом возрасте.

Применение в детском возрасте

С*осторожностью* применяют препарат у новорожденных (особенно недоношенных детей).

Недоношенным новорожденным начальная доза - 10 мг/кг, затем по 7.5 мг/кг каждые 18-24 ч; **новорожденным** начальная доза - 10 мг/кг, затем по 7.5 мг/кг каждые 12 ч в течение 7-10 дней.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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