Тремак-Сановель (порошок)



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Порошок для приготовления суспензии для приема внутрь белого цвета, однородный, с запахом вишни и банана; после растворения - однородная суспензия белого или светло-желтого цвета, с запахом вишни и банана; приложенный растворитель - прозрачный, бесцветный.

	5 мл
азитромицина дигидрат	209.64 мг,
что соответствует содержанию азитромицина	200 мг

Вспомогательные вещества: сахароза - 4447.443 мг, натрия фосфат - 20.1 мг, гипролоза - 7.65 мг, камедь ксантановая - 7.65 мг, ароматизатор вишневый - 55.483 мг, ароматизатор банановый - 28.7 мг.

Растворитель: вода очищенная.

14.33 г - флаконы полиэтиленовые объемом 15 мл (1) в комплекте с растворителем (контейнеры 7.5 мл), мерной ложкой на 5 мл и шприцем для дозирования - пачки картонные.
28.66 г - флаконы полиэтиленовые объемом 30 мл (1) в комплекте с растворителем (контейнеры 15 мл), мерной ложкой на 5 мл и шприцем для дозирования - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы макролидов, является представителем азалидов. Обладает широким спектром противомикробного действия. Механизм действия азитромицина связан с подавлением синтеза белка микробной клетки. Связываясь с 50S субъединицей рибосом, угнетает пептидтранслоказу на стадии трансляции, подавляет синтез белка, замедляет рост и размножение бактерий. Действует бактериостатически. В высоких концентрациях оказывает бактерицидное действие.

Обладает активностью в отношении ряда грамположительных, грамотрицательных, анаэробных, внутриклеточных и других микроорганизмов.

К азитромицину *чувствительны* грамположительные кокки: Streptococcus pneumoniae (пенициллин-чувствительные штаммы), Streptococcus pyogenes, Staphylococcus aureus (метициллин-чувствительные штаммы); аэробные грамотрицательные бактерии: Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Legionella pneumophila, Moraxella catarrhalis, Pasteurella multocida, Neisseria gonorrhoeae; некоторые анаэробные микроорганизмы: Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Prevotella spp., Porphyriomonas spp.; а также Chlamydia trachomatis, Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Mycoplasma pneumoniae, Mycoplasma hominis, Borrelia burgdorferi.

Микроорганизмы с *приобретенной резистентностью* к азитромицину: аэробные грамположительные микроорганизмы

-Streptococcus pneumoniae (пенициллин-резистентные штаммы и штаммы со средней чувствительностью к пенициллину).

Микроорганизмы с *природной резистентностью:* аэробные грамположительные микроорганизмы - Enterococcus faecalis, Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis (метициллин-резистентные штаммы), анаэробные микроорганизмы - Bacteroides fragilis.

Описаны случаи *перекрестной резистентности* между Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes (бета-гемолитический стрептококк группы А), Enterococcus faecalis и Staphylococcus aureus (метициллин-резистентные штаммы) к эритромицину, азитромицину, другим макролидам и линкозамидам.

Азитромицин не применялся для лечения инфекционных заболеваний, вызванных Salmonella typhi (МИК < 16 мг/л) и Shigella spp.

Фармакокинетика

После приема внутрь азитромицин хорошо всасывается и быстро распределяется в организме. После однократного приема в дозе 500 мг биодоступность составляет 37% за счет эффекта "первого прохождения" через печень. C_{max} в плазме крови достигается через 2-3 ч и составляет 0.4 мг/л.

Связывание с белками обратно пропорционально концентрации в плазме крови и составляет 7-50%. Кажущийся V_d составляет 31.1 л/кг. Проникает через мембраны клеток (эффективен при инфекциях, вызванных внутриклеточными возбудителями). Транспортируется фагоцитами к месту инфекции, где высвобождается в присутствии бактерий. Легко проникает через гистогематические барьеры и поступает в ткани. Концентрация в тканях и клетках в 10-50 раз выше, чем в плазме, а в очаге инфекции - на 24-34% больше, чем в здоровых тканях.

Препарат метаболизируется в печени. Метаболиты не обладают противомикробной активностью.

$T_{1/2}$ очень длинный - 35-50 ч. $T_{1/2}$ из тканей значительно больше. Терапевтическая концентрация азитромицина сохраняется до 5-7 дней после приема последней дозы. Азитромицин выводится, в основном, в неизмененном виде - 50% через кишечник, 6% почками.

После в/в инфузии азитромицин быстро проникает из сыворотки крови в ткани. Концентрируясь в фагоцитах и не нарушая их функции, азитромицин мигрирует к очагу воспаления, накапливаясь непосредственно в инфицированных тканях.

Фармакокинетика азитромицина у здоровых добровольцев после однократной в/в инфузии продолжительностью более 2 ч в дозе 1-4 г (концентрация раствора 1 мг/мл) имеет линейную зависимость и пропорциональна вводимой дозе.

У здоровых добровольцев при в/в инфузии азитромицина в дозе 500 мг (концентрация раствора 1 мг/мл) в течение 3 ч C_{max} в сыворотке крови составляла 1.14 мкг/мл. C_{min} в сыворотке крови (0.18 мкг/мл) отмечалась на протяжении 24 ч и AUC составила 8.03 мкг×мл/ч. Схожие фармакокинетические значения были получены и у пациентов с внебольничной пневмонией, которым назначались в/в 3-часовые инфузии на протяжении от 2 до 5 дней. V_d составляет 33.3 л/кг.

После введения азитромицина ежедневно в дозе 500 мг (продолжительность инфузии 1 ч) в течение 5 дней в среднем 14% от дозы выводится почками на протяжении 24-часового интервала дозирования.

$T_{1/2}$ составляет 65-72 ч. Большой V_d (33.3 л/кг) и высокий клиренс плазмы (10.2 мл/мин/кг) позволяют предположить, что длительный $T_{1/2}$ является следствием накопления антибиотика в тканях с последующим медленным его высвобождением.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к азитромицину микроорганизмами: инфекции верхних отделов дыхательных путей и ЛОР-органов (ангина, синусит, тонзиллит, фарингит, средний отит); инфекции нижних отделов дыхательных путей (острый бронхит, обострение хронического бронхита, пневмонии, в т.ч. вызванные атипичными возбудителями); инфекции кожи и мягких тканей (угри обыкновенные средней степени тяжести, рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы); неосложненные инфекции мочеполовых путей, вызванные Chlamydia trachomatis (уретрит и/или цервицит); начальная стадия болезни Лайма (боррелиоз) - мигрирующая эритема (erythema migrans).

Относится к болезням:

- Ангина
- Бронхит
- Дерматит
- Импетиго
- Инфекции

- Отит
- Пневмония
- Рожа
- Синусит
- Тонзиллит
- Угри
- Уретрит
- Фарингит
- Цервицит
- Эритема

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к азитромицину, эритромицину, другим макролидам или кетолидам; повышенная чувствительность к вспомогательным веществам используемого препарата; нарушения функции печени тяжелой степени; тяжелые нарушения функции почек (КК <40 мл/мин); одновременное применение с эрготамином и дигидроэрготамином; детский возраст до 18 лет (для в/в инфузий).

С осторожностью: миастения; легкое и умеренное нарушение функции печени; легкое и умеренное нарушение функции почек (КК > 40 мл/мин); пациенты с наличием проаритмогенных факторов (особенно в пожилом возрасте) - с врожденным или приобретенным удлинением интервала QT, пациенты, получающие терапию антиаритмическими средствами классов IA (хинидин, прокаинамид) и III (дофетилид, амиодарон и соталол), цизапридом, терфенадином, антипсихотическими препаратами (пимозид), антидепрессантами (циталопрам), фторхинолонами (моксифлоксацин и левофлоксацин), с нарушениями водно-электролитного баланса, особенно при гипокалиемии или гипомагниемии, с клинически значимой брадикардией, аритмией или с тяжелой сердечной недостаточностью; одновременное применение дигоксина, варфарина, циклоспорина.

Способ применения и дозы:

Для приема внутрь

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут за 1 ч до или через 2 ч после еды, не разжевывая.

Взрослым и детям старше 12 лет и с массой тела более 45 кг

При *инфекциях верхних и нижних отделов дыхательных путей, ЛОР-органов, при инфекциях кожи и мягких тканей (за исключением хронической мигрирующей эритемы)* - 500 мг/сут за 1 прием в течение 3 дней (курсовая доза - 1.5 г).

При *угрях обыкновенных средней степени тяжести* - по 500 мг 1 раз/сут в течение 3 дней, затем по 500 мг 1 раз в неделю в течение 9 недель; курсовая доза - 6 г. Первую еженедельную дозу следует принять через 7 дней после приема первой
ежедневной дозы (8-й день от начала лечения), последующие 8 еженедельных доз - с интервалом 7 дней.

При *острых инфекциях мочеполовых органов (неосложненный уретрит или цервицит)* - 1 г однократно.

При *болезни Лайма (боррелиоз) для лечения I стадии (erythema migrans)* - 1 г в 1-й день и со 2-го по 5-й день - по 500 мг ежедневно (курсовая доза - 3 г).

Для лечения **пациентов пожилого возраста старше 65 лет** используются те же дозы, что и для взрослых. Поскольку у данной категории пациентов возможно наличие проаритмогенных факторов, необходимо обращать особое внимание на возможность развития у них аритмии и желудочковой тахикардии типа "пируэт".

При **нарушении функции почек (КК более 40 мл/мин)** коррекция дозы не требуется.

При **умеренном нарушении функции печени** коррекция дозы не требуется.

Для в/в инфузий

Вводят в/в капельно, в течение 3 ч - при концентрации 1 мг/мл, в течение 1 ч - при концентрации 2 мг/мл. Необходимо избегать введения в более высоких концентрациях из-за опасности возникновения реакций в месте введения препарата.

Нельзя вводить в/в струйно или в/м!

При *внебольничной пневмонии* назначают в дозе 500 мг 1 раз/сут в течение не менее 2 дней. В случае необходимости, по решению лечащего врача, курс лечения может быть продлен, но должен составлять не более 5 дней. После окончания в/в введения рекомендуется назначение азитромицина внутрь в суточной дозе 500 мг 1 раз/сут до полного завершения 7-10-дневного общего курса лечения.

При *инфекционно-воспалительных заболеваниях органов малого таза* назначают в дозе 500 мг 1 раз/сут в течение 2 дней. Максимальный курс лечения препаратом при в/в введении составляет 5 дней. После окончания в/в введения,

рекомендуется назначение азитромицина внутрь в дозе 250 мг/сут до полного завершения 7-дневного общего курса лечения.

Сроки перехода от в/в введения азитромицина к пероральному приему определяются врачом в соответствии с данными клинического обследования.

Пациентам с легким и умеренным нарушением функции почек (КК > 40 мл/мин) коррекция дозы не требуется.

Пациентам с легким и умеренным нарушением функции печени коррекция дозы не требуется.

У **пациентов пожилого возраста** коррекция дозы не требуется. Поскольку у данной категории пациентов возможно наличие проаритмогенных состояний, следует с осторожностью применять азитромицин в связи с высоким риском развития аритмий, в т.ч. желудочковой аритмии типа "пируэт".

Эффективность и безопасность применения азитромицина для в/в инфузий, у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлена.

Побочное действие:

Инфекционные заболевания: нечасто - кандидоз (в т.ч. слизистой оболочки полости рта и гениталий), пневмония, фарингит, гастроэнтерит, респираторные заболевания, ринит; неизвестная частота - псевдомембранозный колит.

Со стороны крови и лимфатической системы: нечасто - лейкопения, нейтропения, эозинофилия; очень редко - тромбоцитопения, гемолитическая анемия.

Со стороны обмена веществ: нечасто - анорексия.

Аллергические реакции: нечасто - ангионевротический отек, реакция гиперчувствительности; неизвестная частота - анафилактическая реакция.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, нарушение вкусовых ощущений, парестезия, сонливость, бессонница, нервозность; редко - ажитация; неизвестная частота - гипестезия, тревога, агрессия, обморок, судороги, психомоторная гиперактивность, потеря обоняния, извращение обоняния, потеря вкусовых ощущений, миастения, бред, галлюцинации.

Со стороны органа зрения: нечасто - нарушение зрения.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - расстройство слуха, вертиго; неизвестная частота - нарушение слуха вплоть до глухоты и/или шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, приливы крови к лицу; неизвестная частота - снижение АД, увеличение интервала QT на ЭКГ, аритмия типа "пируэт", желудочковая тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - диарея; часто - тошнота, рвота, боль в животе; нечасто - метеоризм, диспепсия, запор, гастрит, дисфагия, вздутие живота, сухость слизистой оболочки полости рта, отрыжка, язвы слизистой оболочки полости рта, повышение секреции слюнных желез; очень редко - изменение цвета языка, панкреатит.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто - гепатит; редко - нарушение функции печени, холестатическая желтуха; неизвестная частота - печеночная недостаточность (в редких случаях с летальным исходом в основном на фоне тяжелого нарушения функции печени), некроз печени, фульминантный гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь, зуд, крапивница, дерматит, сухость кожи, потливость; редко - реакция фотосенсибилизации; неизвестная частота - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, многоформная эритема.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - остеоартрит, миалгия, боль в спине, боль в шее; неизвестная частота - артралгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто - дизурия, боль в области почек; неизвестная частота - интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

Со стороны половых органов и молочной железы: нечасто - метроррагии, нарушение функции яичек.

Местные реакции: часто - боль и воспаление в месте инъекции.

Прочие: нечасто - астения, недомогание, ощущение усталости, отек лица, боль в груди, лихорадка, периферические отеки.

Лабораторные данные: часто - снижение количества лимфоцитов, повышение количества эозинофилов, повышение количества базофилов, повышение количества моноцитов, повышение количества нейтрофилов, снижение концентрации бикарбонатов в плазме крови; нечасто - повышение активности АСТ, АЛТ, повышение концентрации билирубина в плазме крови, повышение концентрации мочевины в плазме крови, повышение концентрации креатинина в плазме крови, изменение содержания калия в плазме крови, повышение активности ЩФ в плазме крови, повышение содержания хлора в плазме крови, повышение концентрации глюкозы в крови, увеличение количества тромбоцитов, повышение гематокрита, повышение концентрации бикарбонатов в плазме крови, изменение содержания натрия в плазме крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Азитромицин проникает через плацентарный барьер. Применение при беременности возможно только в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения азитромицина в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение макролидных антибиотиков, в т.ч. азитромицина, с субстратами Р-гликопротеина, такими как дигоксин, приводит к повышению концентрации субстрата Р-гликопротеина в сыворотке крови. При одновременном применении дигоксина или дигитоксина с азитромицином возможно значительное повышение концентрации сердечных гликозидов в плазме крови и риск развития гликозидной интоксикации.

Одновременное применение азитромицина (однократный прием 1000 мг и многократный прием 1200 мг или 600 мг оказывает незначительное влияние на фармакокинетику, в т.ч. выведение почками зидовудина или его глюкуронидного метаболита. Однако применение азитромицина вызывало увеличение концентрации фосфорилированного зидовудина, клинически активного метаболита в мононуклеарах периферической крови. Клиническое значение этого факта неясно.

При одновременном применении азитромицина с варфарином описаны случаи усиления эффектов последнего.

Азитромицин слабо взаимодействует с изоферментами системы цитохрома Р450.

Учитывая теоретическую возможность возникновения эрготизма, одновременное применение азитромицина с производными алкалоидов спорыньи не рекомендуется.

Одновременное применение аторвастатина (10 мг ежедневно) и азитромицина (500 мг ежедневно) не вызывало изменения концентраций аторвастатина в плазме крови (на основе анализа ингибирования ГМК-КоА-редуктазы). Однако в пострегистрационном периоде были получены отдельные сообщения о случаях рабдомиолиза у пациентов, получающих одновременно азитромицин и статины.

Было установлено, что одновременное применение терфенадина и макролидов может вызвать аритмию и удлинение интервала QT.

При одновременном применении с дизопирамидом описан случай развития желудочковой фибрилляции.

При одновременном применении с ловастатином описаны случаи развития рабдомиолиза.

При одновременном применении с рифабутином повышается риск развития нейтропении и лейкопении.

При одновременном применении нарушается метаболизм циклоспорина, что повышает риск развития побочных и токсических реакций, вызываемых циклоспорином.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять у пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени из-за возможности развития фульминантного гепатита и тяжелой печеночной недостаточности. При наличии симптомов нарушения функции печени, таких как быстро нарастающая астения, желтуха, потемнение мочи, склонность к кровотечениям, печеночная энцефалопатия терапию азитромицином следует прекратить и провести исследование функционального состояния печени.

При легких и умеренных нарушениях функции почек (КК > 40 мл/мин) терапию азитромицином следует проводить с осторожностью под контролем состояния функции почек.

При длительном применении азитромицина возможно развитие псевдомембранозного колита, вызванного Clostridium difficile, как в виде легкой диареи, так и тяжелого колита. При развитии антибиотик-ассоциированной диареи на фоне

применения азитромицина, а также через 2 месяца после окончания терапии следует исключить псевдомембранозный колит, вызванный Clostridium difficile.

При лечении макролидами, в т.ч. азитромицином, наблюдалось удлинение сердечной реполяризации и интервала QT, повышающих риск развития сердечных аритмий, в т.ч. аритмии типа "пируэт".

Использование в педиатрии

Эффективность и безопасность применения у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** азитромицина для в/в инфузий не установлена.

При применени азитромицина для приема внутрь у детей следует строго соблюдать соответствие лекарственной формы препарата возрасту пациента.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При развитии нежелательных эффектов со стороны нервной системы и органа зрения пациенты должны соблюдать осторожность при выполнении действий, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций

жжжжжжжжжжжж

Не рекомендуется применять у пациентов с нарушениями функции печени.

С осторожностью применяют при нарушениях функции почек.

Азитромицин следует принимать не менее чем за 1 ч до или через 2 ч после приема пищи или антацидов.

Источник: http://drugs.thead.ru/Tremak-Sanovel_poroshok