Состав

действующее вещество: азитромицин;

1 капсула содержит азитромицина (в форме дигидрата) 250 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, натрия лаурилсульфат, магния стеарат;

оболочка капсулы содержит:

корпус: желатин, титана диоксид (Е 171);

крышка: желатин, титана диоксид (Е 171), индиготин (Е 132)

маркировки на крышку краситель синий.

Лекарственная форма

Капсулы.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы № 1 с корпусом белого цвета, крышкой синего цвета и маркировкой темно-синего цвета.

Содержимое капсул - порошок белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Антибактериальные средства для системного применения. Макролиды, линкозамиды и стрептограмины. Азитромицин. Код АТХ J01F A10.

Фармакодинамика

Азитромицин - представитель нового поколения макролидных антибиотиков, принадлежит к подгруппе азалидов. Антибактериальное действие препарата обусловлено блокированием биосинтеза белков чувствительных к нему микроорганизмов путем связывания с 50S-субъединицами рибосом и угнетение транслокации пептидов. К препарату чувствительны: Streptococcus pneumoniae (пенициллинчутливий), Streptococcus pyogenes, Staphylococcus aureus (метицилинчутливий), H. influenzae, H. parainfluenzae, M. catarrhalis, Pasteurella multocida, Clostridium perfringens, Legionella pneumophila, Fusobacterium spp., Prevotella spp., Porphyromonas spp ., Chlamydia trachomatis, Chlamydia pneumoniae, Mycoplasma pneumoniae. Виды микроорганизмов, для которых

приобретенная резистентность может быть проблемной: Streptococcus pneumoniae с промежуточной чувствительностью к пенициллину и пенициллинрезистентний. Резистентные организмы: полная перекрестная резистентность существует в Streptococcus pneumoniae, бета-гемолитического стрептококка группы A, Enterococcus faecalis, группа бактероидов Bacteroides fragilis, Staphylococcus MRSA и MRSE (метициллинрезистентный стафилококк имеет очень высокую распространенность приобретенной устойчивости к макролидам, чувствительность к азитромицину в таких видов является редкой).

Распространенность приобретенной резистентности для выделенных видов может быть разной в зависимости от местности и времени, поэтому нужна локальная информация о резистентности, особенно при лечении тяжелых инфекций. В случае необходимости можно обратиться за квалифицированным советом, если местная распространенность резистентности такова, что эффективность препарата для лечения крайней мере некоторых типов инфекций сомнительна.

Фармакокинетика

После приема азитромицин хорошо всасывается и быстро распределяется в организме. Максимальная концентрация в крови обнаруживается примерно через 2-3 часа, биодоступность азитромицина составляет примерно 37%. При приеме азитромицин распределяется по всему организму. Концентрация азитромицина в тканях значительно выше (в 50 раз), чем в плазме крови, что свидетельствует о сильном связывания препарата с тканями. Связывание с белками плазмы крови является вариабельным в зависимости от плазменных концентраций и составляет от 12% при 0,5 мкг / мл до 52% при 0,05 мкг / мл. Конечный период плазменного полувыведения полностью отражает период полувыведения из тканей на протяжении 2-4 дней. Примерно 12% внутривенно введенной дозы азитромицина выделяются неизменными с мочой в течение последующих 3 дней. Особенно высокие концентрации неизмененного азитромицина оказываются в желчи человека. Также в желчи оказываются 10 метаболитов, образующихся с помощью N- и O-деметилирования, гидроксилирования колец дезозамина и агликона и расщепления кладинозы конъюгата. Метаболиты азитромицина не является микробиологически активными.

Показания

Инфекции, вызванные микроорганизмами, чувствительными к азитромицину:

- ЛОР-органов (бактериальный фарингит / тонзиллит, синусит, средний отит);

- инфекции дыхательных путей (бактериальный бронхит, внебольничная пневмония);
- инфекции кожи и мягких тканей мигрирующая эритема (начальная стадия болезни Лайма), рожа, импетиго, вторичные пиодерматозы;
- инфекции, передающиеся половым путем: неосложненный и осложненный уретрит / цервицит, вызванный Chlamydia trachomatis.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к азитромицину, эритромицину или к любому макролидного или кетолидного антибиотика, или к любому другому компоненту препарата. Через теоретическую возможность эрготизма азитромицин не следует назначать одновременно с производными спорыньи.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Следует с осторожностью назначать азитромицин пациентам вместе с другими лекарственными средствами, которые могут удлинять интервал QT.

Антациды. При изучении влияния одновременного применения антацидов на фармакокинетику азитромицина в общем не наблюдалось изменений в биодоступности, хотя плазменные пиковые концентрации азитромицина уменьшались на 25%. Азитромицин необходимо принимать по крайней мере за 1 час до или через 2 часа после приема антацидов.

Цетиризин. При одновременном применении азитромицина в течение 5 дней с цетиризином 20 мг в равновесном состоянии не наблюдалось явлений фармакокинетического взаимодействи*я или существенных изменений интервала QT.*

Диданозин. При одновременном применении суточных доз азитромицина 1200 мг с диданозином не было обнаружено влияния на фармакокинетику диданозина по сравнению с плацебо.

Дигоксин. Сообщалось, что одновременное применение макролидных антибиотиков, включая азитромицин, и субстратов Р-гликопротеина, таких как дигоксин, приводит к повышению уровня субстрата Р-гликопротеина в сыворотке крови. Соответственно, в случае одновременного применения азитромицина и дигоксина необходимо учитывать возможность повышения концентраций дигоксина в сыворотке крови.

Зидовудин. Однократные дозы 1000 мг и 1200 мг многократные дозы 600 мг азитромицина не влияли на плазменную фармакокинетику или выделение с мочой зидовудина или его глюкуроновой метаболитов. Однако прием азитромицина повышал концентрации фосфорилированного зидовудина, клинически активного метаболита, в мононуклеарах периферической крови. Клиническая значимость этих данных не выяснена, но может быть полезной для пациентов.

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

Азитромицин не имеет существенного взаимодействия с печеночной системой цитохрома Р450. Считается, что препарат не имеет фармакокинетического взаимодействия, наблюдается при применении эритромицина и других макролидов. Азитромицин не вызывает индукцию или инактивации цитохрома Р450 через цитохром-метаболитных комплекс.

Существуют данные о проведении фармакокинетических исследований применения оригинального азитромицина и следующих препаратов, метаболизм которых в значительной степени происходит с участием цитохрома Р450.

Аторвастатин. Одновременное применение аторвастатина 10 мг и азитромицина 500 мг в сутки не вызывало изменения концентраций аторвастатина в плазме крови (на основе анализа ингибирования HMG CoA-редуктазы). Однако в постмаркетинговый период были зарегистрированы случаи рабдомиолиза у пациентов, получавших азитромицин со статинами.

Карбамазепин. Азитромицин не обнаружил значительного влияния на плазменные уровни карбамазепина или на его активные метаболиты.

Циметидин. Изменения фармакокинетики азитромицина при однократном применении циметидина за 2 часа до применения азитромицина отсутствовали.

Пероральные антикоагулянты кумариновой группы. Сообщалось о повышенной тенденции к кровотечениям в связи с одновременным применением азитромицина и варфарина или кумарин-подобных пероральных антикоагулянтов. Необходимо уделять внимание частоте мониторинга ПВ и международного нормализационного отношения.

Циклоспорин. В Фармакокинетические исследования с участием здоровых добровольцев, получавших перорально дозу азитромицина 500 мг / сут в течение 3 дней, а затем однократного приема дозу циклоспорина 10 мг / кг, было продемонстрировано значительное повышение максимальной концентрации и

AUC0-5 циклоспорина. Некоторые из родственных макролидных антибиотиков влияют на метаболизм циклоспорина. Следует тщательно взвесить терапевтическую ситуацию до назначения одновременного приема этих препаратов. Если комбинированное применение считается оправданным, необходимо проводить тщательный мониторинг уровня циклоспорина и соответственно регулировать дозировку.

Эфавиренц. Одновременное применение однократной дозы азитромицина 600 мг и ежедневное применение эфавиренза по 400 мг в течение 7 дней не вызывало каких-либо существенного взаимодействия.

Флуконазол. Одновременное применение однократной дозы азитромицина 1200 мг не приводит к изменению фармакокинетики однократной дозы флуконазола 800 мг. Общая экспозиция и период полувыведения азитромицина не изменялись при одновременном применении флуконазола, однако наблюдалось клинически незначительное снижение максимальной концентрации азитромицина на 18%.

Индинавир. Одновременное применение однократной дозы азитромицина 1200 мг не вызывало статистически достоверного влияния на фармакокинетику индинавира, который принимали в дозе 800 мг 3 раза в сутки в течение 5 дней.

Метилпреднизолон. Азитромицин не проявлял значительного влияния на фармакокинетику метилпреднизолона.

Мидазолам. Одновременное применение азитромицина 500 мг в течение 3 дней не вызывало клинически значимых изменений фармакокинетики и фармакодинамики мидазолама.

Нелфинавир. Одновременное применение азитромицина 1200 мг и нелфинавира в равновесных концентрациях (750 мг 3 раза в сутки) приводит к повышению концентрации азитромицина. Клинически значимых побочных явлений не наблюдалось, соответственно, нет необходимости в коррекции дозы.

Рифабутин. Одновременное применение азитромицина и рифабутина не влияло на плазменные концентрации этих препаратов. Нейтропения наблюдалась у пациентов, принимавших одновременно азитромицин и рифабутин. Хотя нейтропения была связана с применением рифабутина, причинная связь с одновременным приемом азитромицина не была установлена.

Силденафил. Нет доказательств влияния применения азитромицина 500 мг в течение 3 дней на значение AUC і Cmax силденафила или его основного метаболита у лиц мужского пола.

Терфенадин. Не сообщалось о взаимодействии между азитромицином и терфенадином. Как и в случае с другими макролидные антибиотики, азитромицин необходимо с осторожностью назначать в комбинации с терфенадином.

Теофиллин. Азитромицин не влиял на фармакокинетику теофиллина при одновременном приеме азитромицина и теофиллина.

Триазолам. Одновременное применение азитромицина 500 мг в первый день и 250 мг второго дня с 0,125 мг триазолама существенно не влияло на все фармакокинетические показатели триазолама.

Триметоприм / сульфаметоксазол. Одновременное применение триметоприма / сульфометоксазол 160/800 мг в течение 7 дней и азитромицина 1200 мг на 7-е сутки не выявило существенного влияния на максимальные концентрации, общую экспозицию или экскрецию с мочой триметоприма или сульфометоксазол. Концентрации азитромицина также не менялись.

Особенности применения

Аллергические реакции. Как и в случае с эритромицином и другими макролидные антибиотики, сообщалось о редких серьезные аллергические реакции, включая ангионевротический отек и анафилаксии (в редких случаях - с летальным исходом), дерматологические реакции, в том числе острый генерализованный экзантематозный пустулез. Некоторые из этих реакций имели рецидивирующий характер и требовали более длительного наблюдения и лечения.

Нарушение функции печени. Поскольку печень является основным путем выведения азитромицина, следует осторожно назначать азитромицин пациентам с серьезными заболеваниями печени. Сообщалось о случаях фульминантного гепатита при приеме азитромицина, вызывает опасные для жизни нарушения функции печени. Возможно, некоторые пациенты в анамнезе имели заболевания печени или применяли другие гепатотоксические лекарственные средства. Необходимо проводить функциональные печеночные пробы в случае развития признаков и симптомов дисфункции печени, например астении, быстро развивается и сопровождается желтухой, темной мочой, склонностью к кровотечениям или печеночной энцефалопатией. В случае выявления нарушения функции печени применение азитромицина следует прекратить.

Рожки. У пациентов, принимающих производные спорыньи, одновременное применение макролидных антибиотиков вызывает быстрое развитие эрготизма. Отсутствуют данные о возможности взаимодействия между рожками и

азитромицином. Однако через теоретическую возможность эрготизма азитромицин не следует назначать одновременно с производными спорыньи.

Суперинфекции. Как и в случае с другими антибактериальными препаратами, рекомендуется проводить наблюдения по признакам суперинфекции, вызванной нечувствительными организмами, включая грибы. При приеме почти всех антибактериальных препаратов, включая азитромицин, сообщалось о Clostridium difficile-ассоциированной диареи (CDAD), серьезность которой варьировалась от слабо выраженной диареи до колита с летальным исходом. Лечение антибактериальными препаратами изменяет нормальную флору в толстой кишке, что приводит к чрезмерному росту C. difficile. C. difficile производит токсины A и B, которые вызывают развитие CDAD. Штаммы C. difficile, что гиперпродуцирующими токсины, является причиной повышенного уровня заболеваемости и летальности, поскольку эти инфекции могут быть резистентными к антимикробной терапии и потребовать проведения колэктомии. Необходимо рассмотреть возможность развития CDAD у всех пациентов с диареей, вызванной применением антибиотиков. Нужно тщательное ведение истории болезни, поскольку, как сообщалось, CDAD может иметь место в течение 2 месяцев после приема антибактериальных препаратов.

Нарушение функции почек. У пациентов с серьезной дисфункцией почек (скорость клубочковой фильтрации <10 мл / мин) наблюдалось 33% увеличение системной экспозиции с азитромицином.

Удлинение сердечной реполяризации и интервала QT, что повышали риск развития сердечной аритмии, в том числе трепетание-мерцание желудочков (torsades de pointes), наблюдались при лечении другими макролидные антибиотики. Подобный эффект азитромицина нельзя полностью исключить у пациентов с повышенным риском удлиненной сердечной реполяризации, поэтому следует с осторожностью назначать лечение пациентам:

- С врожденной или зарегистрированной пролонгацией интервала QT;
- Которые в данный момент применяют другие лекарственные средства, пролонгируют интервал QT, например антиаритмические препараты классов ИА (хинидин и прокаинамид) и III (амиодарон, соталол, дофетилида), цизаприд и терфенадин, нейролептические средства, такие как пимозид, антидепрессанты, такие как циталопрам, а также фторхинолоны, такие как моксифлоксацин и левофлоксацин;
- С нарушениями электролитного обмена, особенно в случае гипокалиемии и гипомагниемии;
- С клинически релевантной брадикардией, аритмией или тяжелой сердечной недостаточностью.

Миастения гравис. Сообщалось об обострении симптомов миастении гравис или о новом развитии миастенического синдрома у пациентов, принимавших азитромицин.

Стрептококковые инфекции. Азитромицин целом эффективен в лечении стрептококковой инфекции в ротоглотке, но нет данных, демонстрирующих эффективность азитромицина в профилактике ревматической атаки. Антимикробный препарат с антианаэробной активностью необходимо применять в сочетании с азитромицином, если предполагается, что анаэробные микроорганизмы вызывают развитие инфекции.

Другие. Безопасность и эффективность для профилактики или лечения Mycobacterium Avium Complex у детей не установлены.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациентам с редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы Лаппа или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Нет данных, азитромицин может ухудшать способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами, но следует учесть возможность развития побочных реакций, таких как головокружение, сонливость, нарушение зрения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Азитромицин проникает через плаценту, однако доказательств токсического влияния на плод в исследованиях оригинального азитромицина на животных не было получено. Однако адекватных и хорошо контролируемых исследований по применению препарата беременным женщинам нет. Поскольку исследования влияния на репродуктивную функцию животных не всегда соответствуют такому же эффекта у человека, азитромицин следует назначать в период беременности только по жизненным показаниям.

Кормления грудью. Азитромицин проникает в грудное молоко, однако отсутствуют соответствующие и контролируемые исследования фармакокинетики экскреции. Азитромицин можно применять в период кормления грудью только в случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для ребенка.

Фертильность. Существуют исследования на крысах, согласно которым показано снижение показателя беременности после введения азитромицина. Актуальность этих данных относительно человека неизвестна.

Способ применения и дозы

Капсулы препарата принимают внутрь 1 раз в сутки за 1 час до или через 2 часа после еды, запивая небольшим количеством жидкости. В случае пропуска приема препарата пропущенную дозу необходимо принять как можно скорее, а следующую дозу принимать через 24 часа.

Взрослые и дети с массой тела более 45 кг.

При инфекциях дыхательных путей, ЛОР-органов, кожи и мягких тканей (кроме хронической мигрирующей эритемы) азитромицин применять по 500 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки в течение 3 дней. Общая лечебная доза составляет 1500 мг.

При инфекциях, передающихся половым путем, пациентам назначать 1 г (4 капсулы) однократно.

При мигрирующей эритеме: 1 раз в сутки в течение 5 дней, 1-й день 1 г (4 капсулы по 250 мг), затем по 500 мг (2 капсулы) с 2-го по 5-й день.

Для лиц пожилого возраста нет необходимости изменять дозу препарата. Поскольку пациенты пожилого возраста могут входить в группы риска нарушений электрической проводимости сердца, рекомендуется соблюдать осторожность при применении азитромицина в связи с риском развития сердечной аритмии, в том числе torsades de pointes.

Пациенты с нарушениями функции почек. У пациентов с незначительной дисфункцией почек (скорость клубочковой фильтрации 10-80 мл / мин) нет необходимости изменять дозировку. Азитромицин необходимо с осторожностью применять пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек (скорость клубочковой фильтрации <10 мл / мин).

Пациенты с нарушениями функции печени. Поскольку азитромицин метаболизируется в печени и выводится с желчью, препарат не следует применять пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени. Нет данных по лечению таких пациентов.

Дети

Азитромицин в форме капсул можно назначать детям с массой тела более 45 кг.

Передозировка

Симптомы

При передозировке азитромицина наблюдаются выраженные тошнота, рвота, диарея, боль в животе, оборотная потеря слуха.

Лечение

Прием активированного угля и проведение общих симптоматических и поддерживающих лечебных мероприятий.

Побочные реакции

Инфекции и инвазии: кандидоз, оральный кандидоз, влагалищные инфекции, пневмония, грибковая инфекция, бактериальная инфекция, фарингит, гастроэнтерит, нарушение функции дыхания, ринит, псевдомембранозный колит.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: лейкопения, нейтропения, эозинофилия, тромбоцитопения, гемолитическая анемия.

Со стороны иммунной системы: ангионевротический отек, реакции повышенной чувствительности, анафилактические реакции.

Со стороны обмена веществ: анорексия.

Со стороны психики: нервозность, бессонница, возбуждение, агрессивность, беспокойство, делирий, галлюцинации, тревога.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, сонливость, парестезии, дисгевзия, обморок, судороги, психомоторная повышенная активность, аносмия, паросмия, агевзия, миастения гравис, гипестезия.

Со стороны органа зрения: зрительные расстройства, ухудшение зрения.

Со стороны органов слуха: нарушение слуха, вертиго, ухудшение слуха, включая глухоту и / или звон в ушах.

Со стороны сердца: пальпитация, трепетание-мерцание желудочков (torsades de pointes), аритмия, включая желудочковую тахикардию, увеличение интервала QT на ЭКГ.

Со стороны сосудов: приливы, артериальная гипотензия.

Со стороны дыхательной системы: одышка, носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительного тракта: диарея, вздутие живота, частый жидкий стул, рвота, боль в животе, тошнота, гастрит, запор, метеоризм, желудочно-кишечный дискомфорт, диспепсия, дисфагия, сухость во рту, отрыжка, язвы в ротовой полости, гиперсекреция слюны , панкреатит, изменение цвета языка.

Со стороны пищеварительной системы: нарушение функции печени, холестатическая желтуха, печеночная недостаточность (редко приводит к летальному исходу), гепатит, фульминантной гепатит, некротический гепатит.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь, зуд, крапивница, дерматит, сухость кожи, гипергидроз, фотосенсибилизация, острый генерализованный экзантематозный пустулез, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, полиморфная эритема, реакция на лекарственное средство с эозинофилией и системными симптомами .

Со стороны костно-мышечной системы: остеоартрит, миалгия, боль в спине, боль в шее, артралгия.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, боль в почках, острая почечная недостаточность, интерстициальный нефрит.

Со стороны половой системы: маточное кровотечение, тестикулярные нарушения.

Общие нарушения и местные реакции: боль в груди, отек, недомогание, астения, повышенная утомляемость, отек лица, гипертермия, боль, периферические отеки.

Лабораторные показатели: снижено количество лейкоцитов, повышенное количество эозинофилов, снижен уровень бикарбоната крови, повышение уровня базофилов, повышение уровня моноцитов, повышение уровня нейтрофилов, повышение уровня аспартатаминотрансферазы, повышение уровня аланинаминотрансферазы, повышение уровня билирубина в крови, повышение уровня мочевины в крови, повышение уровня креатинина в крови, изменения показателей калия в крови, повышение уровня щелочной фосфатазы, повышение уровня хлоридов, повышение уровня глюкозы, повышение уровня тромбоцитов, снижение уровня гематокрита, повышение уровня бикарбонатов, отклонение уровня натрия.

Поражения и отравления: осложнения после процедуры.

Срок годности

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

Условия хранения

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

Упаковка

По 6 капсул в пластиковом контейнере белого цвета, закупоренной пластиковой крышкой с контролем первого вскрытия в пачке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Совместное украинский-испанское предприятие «Сперко Украина».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 21027, г. Винница, ул. 600-летия, 25.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.