

Состав

действующее вещество: мидекамицин;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит 400 мг мидекамицина;

вспомогательные вещества: калия полакрилин, тальк, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, акрилатный сополимер, полиэтиленгликоль, титана диоксид (Е 171).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: круглые, слегка двояковыпуклые таблетки белого цвета, покрытые пленочной оболочкой, со скошенными краями и чертой с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Противомикробные средства для системного применения. Макролиды, линкозамиды и стрептограмин. Мидекамицин. Код АТХ J01F A03.

Фармакодинамика

Антибактериальное действие.

Мидекамицин - макролидный антибиотик широкого спектра действия, по действию подобен эритромицину. Активный против грамположительных бактерий (стафилококков, стрептококков, пневмококков, *Bacillus anthracis*, *Corynebacterium diphtheriae* и *Listeria monocytogenes*), некоторых грамотрицательных бактерий (*Bordetella pertussis*, *Campylobacter spp.*, *Moraxella catarrhalis* и *Neisseria spp.*), Анаэробных бактерий (*Clostridium spp.* и *Bacteroides spp.*) и других бактерий, таких как микоплазмы, уреоплазмы, хламидии и легионеллы.

Чувствительность микроорганизмов *in vitro* к мидекамицину ацетата (MDM-acetate) и мидекамицину (MDM):

Значения МИС₉₀ (минимальная подавляющая концентрация) (мкг/мл)		
Bacterium	MDM-acetate	MDM
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	0,5	0,10
<i>Streptococcus pyogenes</i>	0,67	0,20
<i>Streptococcus viridans</i>	0,28	0,39
<i>Staphylococcus aureus</i>	1,5	1,5
<i>Listeria monocytogenes</i>	2	1,5
<i>Bordetella pertussis</i>	0,25	0,20
<i>Legionella pneumophila</i>	0,1	0,12-1
<i>Moraxella catarrhalis</i>	2	-
<i>Helicobacter pylori</i>	0,5	-
<i>Propionibacterium acnes</i>	0,12	-
<i>Bacteroides fragilis</i>	5,5	3,13
<i>Mycoplasma pneumoniae</i>	0,024	0,0078
<i>Ureaplasma urealyticum</i>	0,34	1,56

<i>Mycoplasma hominis</i>	2,3	-
<i>Gardnerella vaginalis</i>	0,08	-
<i>Chlamydia trachomatis</i>	0,06	-
<i>Chlamydia pneumoniae</i>	0,5	-

Критерии мидекамицина относительно толкования МИС такие же, как для других макролидов, в соответствии с NCCLS (Национальный комитет по клиническим лабораторным стандартам). Бактерии определяются как чувствительные, если их МИС90 \leq 2 мкг / мл и устойчивые, если их МИС90 \geq 8 мкг / мл.

Антимикробная эффективность метаболитов.

Метаболиты мидекамицин оказывают аналогичное антибактериальное действие, но менее выраженное. Исследования на животных показали, что мидекамицин и мидекамицина ацетат более эффективными *in vivo*, чем *in vitro*, частично из-за высокой концентрации метаболитов в тканях.

Механизм действия.

Мидекамицин подавляет синтез РНК-зависимых белков в стадии пролонгации протеинового цепи путем обратного связывания с субъединицей 50S и блокирует реакции транспептидации и / или транслокации. Из-за различия структуры рибосом связывания с рибосомами эукариотических клеток не происходит. Поэтому токсичность макролидов для клеток человека низкая.

Главным образом мидекамицин оказывает бактериостатическое действие. Однако также может проявлять бактерицидное действие в зависимости от типа бактерии, концентрации препарата в месте действия, размера инокулята и репродуктивной стадии микроорганизма. Активность *in vitro* снижается в кислой среде. Если значение pH в среде культур *Staphylococcus aureus* или *Streptococcus pyogenes* увеличивается до 7,2-8, минимальная ингибирующая

способность Мидекамицин снижается вдвое. Если рН снижается, активность Мидекамицин повышается.

Мидекамицин кумулируется в альвеолярных макрофагах человека. Также макролиды кумулируются в нейтрофилах. Исследования *in vitro* обнаружили, что мидекамицин также влияет на иммунные функции. Установлено усиление хемотаксиса по сравнению с эритромицином. *In vivo* мидекамицин стимулирует активность естественных клеток-киллеров. Эти исследования показывают влияние Мидекамицин на иммунную систему, что важно для противомикробного эффекта Мидекамицин *in vivo*.

Резистентность.

Устойчивость к макролидам развивается в связи с уменьшением проницаемости наружной мембраны клетки бактерии (энтеробактерии), инактивации препарата (*S. aureus*, *E. coli*) и, что самое главное, изменения места действия.

Частота возникновения бактериальной резистентности к макролидам сильно варьирует. Резистентность метициллино *S. aureus* колеблется от 1% до 50%, тогда как большинство резистентных к метициллину штаммов *S. aureus* также устойчивы к макролидам. Резистентность пневмококков в основном ниже 5%, но в некоторых частях мира составляет более 50% (Япония). Резистентность бактерии *Streptococcus pyogenes* к макролидам колеблется от 1% до 40% в Европе. Очень редко развивается устойчивость микоплазм, легионелл и *C. diphtheriae*.

Фармакокинетика

Всасывание.

Мидекамицин и мидекамицина ацетат быстро и относительно хорошо всасываются и достигают максимальных концентраций в сыворотке крови 0,5-2,5 мкг / мл и 1,31-3,3 мкг / мл соответственно за 1-2 часа. Поскольку прием пищи несколько снижает максимальные концентрации, особенно у детей в возрасте от 4 до 16 лет, мидекамицин рекомендуется принимать перед приемом пищи.

Распределение.

Мидекамицин хорошо проникает в ткани, где он достигает концентраций, более высоких, чем в крови, на 100%. Он достигает высоких концентраций в секрете бронхов, а также в коже. Объем распределения миокамицину (Мидекамицин ацетата) составляет 228-329 л.

47% Мидекамицина и 3-29% метаболитов связываются с белками. Миокамицин (Мидекамицин ацетат) также проникает в грудное молоко. После приема дозы 1200 мг / сут в грудном молоке было обнаружено 0,4-1,7 мкг / мл Мидекамицин ацетата.

Метаболизм и выведение.

Мидекамицин главным образом метаболизируется в печени. Преимущественно выводится с желчью и только около 5% - с мочой.

Значительное увеличение пиковых концентраций в сыворотке крови, AUC и периода полувыведения возможные у пациентов с циррозом печени.

Показания

Инфекции респираторного и мочеполового тракта, вызванные микоплазмами, легионелла, хламидиями и *Ureaplasma urealyticum*; инфекции респираторного тракта, кожи и мягких тканей и другие инфекции, вызванные чувствительными к Мидекамицин и пенициллина бактериями, у пациентов с гиперчувствительностью к пенициллину; энтериты, вызванные бактериями *Campylobacter spp.*; лечение и профилактика дифтерии и коклюша.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к мидекамицину или к любому из вспомогательных веществ препарата, тяжелые нарушения функции печени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Известно, что макролиды взаимодействуют с другими лекарственными средствами. Макролидные антибиотики влияют на печеночный метаболизм, они могут блокировать активность ферментов цитохромного комплекса P450. В отличие от эритромицина, мидекамицин и Мидекамицин ацетат не связываются с микросомальными оксидазами клеток печени и не образуют стабильных комплексов с цитохромом P450, вследствие чего они не влияют на

фармакокинетику теофиллина. Мидекамицин может привести к увеличению уровня циклоспорина в сыворотке крови (уровни вдвое больше) и удлинению периода полувыведения и увеличению AUC (площади под кривой) карбамазепина. Следует с осторожностью применять пациентам, которые параллельно принимают карбамазепин или циклоспорин, и, если возможно, контролировать уровень последних в сыворотке крови.

Одновременное применение Мидекамицин и алкалоидов спорыньи может угнетать их метаболизм в печени и повысить их концентрацию в плазме крови.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении мидекамицина с варфарином, поскольку выведение последнего может уменьшиться, что повышает риск возникновения кровотечения.

Особенности применения

Во время длительного лечения следует контролировать активность печеночных ферментов, особенно у пациентов с нарушениями функции печени в анамнезе.

Длительное применение препарата может привести к суперинфекции. Выраженная диарея может быть проявлением псевдомембранозного колита.

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

Отсутствуют данные о влиянии препарата на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Не было сообщений о вредном влиянии мидекамицина на плод. Применение в период беременности возможно только в крайних случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Поскольку препарат проникает в грудное молоко, кормление грудью следует прекратить на период лечения.

Способ применения и дозы

Препарат следует применять перед приемом пищи.

Взрослые и дети с массой тела более 30 кг по 1 таблетке 400 мг 3 раза в сутки.

Максимальная суточная доза для взрослых составляет 1600 мг Мидекамицин.

Дети с массой тела менее 30 кг применять суспензию для перорального применения. Лечение длится от 7 до 14 дней. Лечение хламидийной инфекции следует продолжать в течение 14 дней.

Дети

Препарат в данной лекарственной форме следует применять детям с массой тела более 30 кг.

Передозировка

Информация о передозировке отсутствует. При приеме доз, превышающих терапевтические, возможны тошнота и рвота. Лечение симптоматическое.

Побочные реакции

Со стороны крови и лимфатической системы: эозинофилия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, снижение аппетита, рвота, диарея, стоматит, боль в животе, псевдомембранозный колит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: сыпь, крапивница и зуд, ангионевротический отек, синдром Стивенса - Джонсона.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: повышение уровня трансаминаз и желтуха.

Общие нарушения: реакции гиперчувствительности, включая гиперемию; общая слабость, головокружение.

При возникновении тяжелых побочных реакций лечение следует прекратить.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Упаковка

По 8 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

КРКА, д.д., Ново место, Словения/KRKA, d.d., Novo mesto, Slovenia.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Шмарьешка цеста 6, 8501 Ново место, Словения / Smarjeska cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).