

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Ампициллин

Регистрационный номер Р N000068/04

Торговое наименование: Ампициллин

Международное непатентованное наименование: ампициллин

Химическое название: натриевая соль (6R)-6-[D (-) альфа-аминофенилацетида]-пенициллановой кислоты

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения

Состав на 1 флакон:

Действующее вещество: ампициллин натрия - 0,5315 г, 1,063 г, 2,126 г (в пересчете на ампициллин – 0,5 г, 1 г, 2 г).

Описание. Порошок белого или почти белого цвета. Гигроскопичен.

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик - пенициллин полусинтетический

Код АТХ [J01CA01].

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Ампициллин - антибиотик широкого спектра действия из группы полусинтетических пенициллинов. Действует бактерицидно за счет подавления синтеза клеточной стенки бактерий. Ингибирует полимеразу пептидогликана и транспептидазу, препятствует образованию пептидных связей и нарушает поздние этапы синтеза клеточной стенки делящегося микроорганизма, что приводит к снижению осмотической устойчивости бактериальной клетки и вызывает её лизис.

Активен в отношении:

грамположительных аэробных бактерий: *Staphylococcus* spp. (штаммов, не вырабатывающих пенициллиназу и другие бета-лактамазы, *Streptococcus* spp. (в т.ч. альфа- и бета-гемолитических стрептококков, *Streptococcus pneumoniae*), *Bacillus anthracis*, *Listeria* spp. Умеренно активен против большинства энтерококков *Enterococcus* spp. (в т.ч. *Enterococcus faecalis*).

грамотрицательных аэробных бактерий (штаммов, не вырабатывающих бета-лактамазу): *Haemophilus influenzae*, *Bordetella pertussis*, *Neisseria meningitidis*, *Proteus mirabilis*, *Yersinia multocida* (ранее *Pasteurella*), многие виды *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Escherichia coli*; анаэробов: *Clostridium* spp.

Неактивен в отношении пенициллиназопродуцирующих штаммов *Staphylococcus* spp., всех штаммов *Pseudomonas aeruginosa*, *Proteus vulgaris*, большинства штаммов *Klebsiella* spp. и *Enterobacter* spp., некоторых штаммов *Escherichia coli*, микоплазм, хламидий, риккетсий.

Фармакокинетика

Связь с белками плазмы - 20%. При парентеральном введении (в/в, в/м) концентрация в крови превышает создаваемую при приеме внутрь. Равномерно распределяется в органах и тканях организма, обнаруживается в терапевтических концентрациях в плевральной, перитонеальной, амниотической и синовиальной жидкостях, ликворе, содержимом волдырей, моче (высокие концентрации), слизистой оболочке кишечника, костях, желчном пузыре, легких, тканях женских половых органов, желчи, в бронхиальном секрете (в гнойном бронхиальном секрете накопление слабое), придаточных пазухах носа, жидкости среднего уха, слюне, тканях плода. Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, но его проницаемость увеличивается при воспалении мозговых оболочек.

Период полувыведения препарата ($T_{1/2}$) - 1-2 ч.

Выводится преимущественно почками (70-80%), в моче создаются очень высокие концентрации неизменённого антибиотика; частично выводится с желчью, у кормящих матерей - с молоком. Не кумулирует. Удаляется при гемодиализе.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания:

- нижних дыхательных путей (бронхит, пневмония, абсцесс легкого);
- ЛОР-органов (синусит, тонзиллит, средний отит);
- инфекции почек и мочевыводящих путей (пиелонефрит, пиелит, цистит, уретрит);
- инфекции билиарной системы (холангит, холецистит);
- инфекции кожи и мягких тканей (рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы);
- инфекции опорно-двигательного аппарата;
- инфекции желудочно-кишечного тракта (брюшной тиф и паратиф, дизентерия, сальмонеллез, сальмонеллезное носительство);
- абдоминальные инфекции (перитонит);
- эндокардит (профилактика и лечение);
- менингит;
- пастереллез;
- листериоз,
- гонорея (в т.ч. гонорейный уретрит, гонорейный цервицит);
- сепсис.

Противопоказания

Гиперчувствительность (в т.ч. к другим пенициллинам, цефалоспорином, карбапенемам), инфекционный мононуклеоз, лимфолейкоз, печёночная недостаточность, заболевания желудочно-кишечного тракта в анамнезе (особенно колит, связанный с применением антибиотиков), период лактации.

С осторожностью

Бронхиальная астма, поллиноз и другие аллергические заболевания, почечная недостаточность, кровотечения в анамнезе, беременность, детский возраст до 1 месяца.

Способ применения и дозы

Внутривенно (в/в) (струйно и капельно), внутримышечно (в/м)

Дозы и длительность лечения устанавливают индивидуально в зависимости от тяжести течения, локализации и чувствительности возбудителя инфекции.

При инфекциях среднетяжелого течения взрослым и детям с массой тела свыше 20 кг вводят в/м или в/в - 250-500 мг каждые 6 ч; при тяжелом течении - 1000-2000 мг каждые 3-4 ч.

Листериоз - по 50 мг/кг каждые 6 ч.

Тифозная лихорадка - по 25 мг/кг каждые 6 ч.

При гонококковом уретрите - 3,5 г однократно.

Максимальная суточная доза 14 г/сут.

Детям (при менингите): новорожденным с массой тела до 2 кг - в/м или в/в по 25-50 мг/кг каждые 12 ч в первую неделю жизни, затем 50 мг/кг каждые 8 ч; новорожденным с массой тела 2 кг и выше - 50 мг/кг каждые 8 ч в первую неделю жизни, затем 50 мг/кг каждые 6 ч.

При других показаниях в/м или в/в детям с массой тела до 20 кг - 12,5-25 мг/кг каждые 6 ч.

Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания (от 5-10 дней до 2-3 нед, а при хронических процессах - в течение нескольких месяцев).

Раствор для внутримышечного введения готовят, добавляя к содержимому флакона воду для инъекций в количестве: 2 мл на флакон 500 мг; 4 мл - на флакон 1000 мг и 6 мл - на флакон 2 г.

Для внутривенного струйного введения разовую дозу препарата (не более 2 г) растворяют в 5-10 мл воды для инъекций или 0,9% раствора натрия хлорида и вводят медленно в течение 3-5 мин. При разовой дозе, превышающей 2 г, препарат вводят только внутривенно капельно.

Для внутривенного капельного введения разовую дозу препарата (2-4 г) растворяют в небольшом объеме воды для инъекций (7,5-15 мл соответственно), затем полученный раствор антибиотика добавляют к 125-250 мл 0,9% раствора натрия хлорида или 5-10% раствора декстрозы и вводят со скоростью 60-80 капель в минуту.

При капельном введении детям в качестве растворителя используют 5-10% раствор декстрозы (30-50 мл в зависимости от возраста).

Растворы используют сразу после приготовления.

Перед назначением ампициллина следует определять чувствительность возбудителя заболевания к препарату.

Побочное действие

Аллергические реакции: шелушение кожи, зуд, крапивница, ринит, конъюнктивит, отек Квинке, редко - лихорадка, артралгия, эозинофилия, эритематозная и макулопапулезная сыпь, эксфолиативный дерматит, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, реакции, сходные с сывороточной болезнью, в единичных случаях - анафилактический шок.

Со стороны пищеварительной системы: дисбактериоз, гастрит, сухость во рту, изменение вкуса, боль в животе, рвота, тошнота, диарея, стоматит, глоссит, умеренное повышение уровня "печеночных" трансаминаз, псевдомембранозный энтероколит.

Со стороны центральной нервной системы: агитация или агрессивность, тревожность, спутанность сознания, изменение поведения, депрессия, головная боль, тремор, судороги (при терапии высокими дозами).

Лабораторные показатели: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, анемия.

Местные реакции: боль в месте введения, инфильтраты при в/м введении, флебиты при в/в введении в больших дозах.

Прочие: интерстициальный нефрит, нефропатия, суперинфекция (особенно у пациентов с хроническими заболеваниями или сниженной резистентностью организма), кандидамикоз влагалища.

Передозировка

Симптомы: проявление токсического действия на центральную нервную систему (особенно у больных с почечной недостаточностью); тошнота, рвота, диарея, нарушение водно-электролитного баланса (как следствие рвоты и диареи).

Лечение симптоматическое. Выводится с помощью гемодиализа.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Фармацевтически несовместим с аминогликозидами.

Бактерицидные антибиотики (в т.ч. аминогликозиды, цефалоспорины, циклосерин, ванкомицин, рифампицин) - оказывают синергидное действие; бактериостатические лекарственные средства (макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины, сульфаниламиды) - антагонистическое.

Повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (подавляя кишечную микрофлору, снижает синтез витамина К и протромбиновый индекс); уменьшает эффективность эстрогенсодержащих пероральных контрацептивов (необходимо использовать дополнительные методы контрацепции), лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется парааминобензойная кислота, этинилэстрадиола (в последнем случае повышается риск развития кровотечений "прорыва").

Диуретики, аллопуринол, оксифенбутазон, фенилбутазон, нестероидные противовоспалительные средства и другие лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, повышают концентрацию ампициллина в плазме (за счет снижения канальцевой секреции).

Аллопуринол повышает риск развития кожной сыпи.

Уменьшает клиренс и повышает токсичность метотрексата.

Синергизм антибактериального действия наблюдается при одновременном назначении с аминогликозидными антибиотиками (но не смешивании в одном шприце!).

Особые указания

При курсовом лечении необходимо проводить контроль состояния функции органов кроветворения, печени и почек.

Возможно развитие суперинфекции за счет роста нечувствительной к препарату микрофлоры, что требует соответствующего изменения антибактериальной терапии.

При назначении больным с сепсисом возможно развитие реакции бактериолиза (реакция Яриша-Герксгеймера).

У пациентов, имеющих повышенную чувствительность к пенициллинам, возможны перекрестные аллергические реакции с другими бета-лактамами антибиотиками.

При лечении легкой диареи, возникающей на фоне курсового лечения, следует избегать противодиарейных лекарственных средств, снижающих перистальтику кишечника; можно использовать каолин- или аттапулыгитсодержащие противодиарейные лекарственные

средства, показана отмена препарата. При тяжелой диарее необходимо обратиться к врачу.

Лечение должно обязательно продолжаться на протяжении еще 48-72 ч после исчезновения клинических признаков заболевания.

При нетяжелом течении инфекций у детей предпочтительнее назначать препарат в виде суспензии.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения 0,5 г, 1 г, 2 г.

По 0,5 г, 1 г, 2 г ампициллина во флаконы вместимостью 10 мл или 20 мл, герметично закупоренные пробками резиновыми, обжатыми колпачками алюминиевыми или колпачками комбинированными алюминиевыми с пластмассовыми крышками.

1, 10 флаконов с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

50 флаконов с равным количеством инструкций по применению помещают в коробку из картона для поставки в стационары.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 20 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии потребителей:

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»), Россия,

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Тел./факс: (3522) 48-16-89

e-mail: real@kurgansintez.ru

www.kurgansintez.ru