Инструкция по применению
Экозитрин таблетки 250 мг 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Россия
Производитель: Авва Рус
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Кларитромицин
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 250 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Кларитромицин

Состав

Кларитромицин 250 мг;Вспомогательные вещества: лактулоза - 300 мг, повидон-К25 - 9.1 мг, магния стеарат - 6.5 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 4.33 мг, тальк - 13 мг, полакрилин калия - до 650 мг.;Состав оболочки: гипромеллоза - 9.52 мг, тальк - 1.14 мг, титана диоксид - 5.171 мг, макрогол-4000 - 4.14 мг, краситель азорубин - 0.029 мг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая. Пища замедляет всасывание, существенно не влияя на биодоступность. Биодоступность таблеток 250 мг - 50%. Связь с белками плазмы - 65-75%. После однократного приема регистрируется два пика максимальной концентрации (Cmax). Второй пик обусловлен способностью препарата накапливаться в желчном пузыре с последующим постепенным или быстрым поступлением в кишечник и всасыванием. Время достижения максимальной концентрации (TCmax) при приеме 250 мг - 2-3 ч.; После приема внутрь 20-30% от принятой дозы быстро гидроксилируется в печени изоферментами цитохрома CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 с образованием основного метаболита - 14-гидроксикларитромицина, обладающего выраженной противомикробной активностью в отношении Haemophllus influenzae. Является ингибитором изоферментов CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7.;При регулярном приеме по 250 мг/сутки равновесная концентрация (Css) неизмененного препарата и его основного метаболита - 1 и 0,6 мкг/мл соответственно; период полувыведения – 3-4 и 5-6 часов соответственно. При увеличении дозы до 500 мг/сутки Css неизмененного препарата и его метаболита в плазме – 2,7-2,9 и 0,83-0,88 мкг/мл соответственно; период полувыведения – 4,8-5 и 6,9-8,7 ч соответственно. В терапевтических концентрациях накапливается в легких, коже и мягких тканях (в них концентрации в 10 раз превышают уровень антибиотика в плазме крови). ;Выделяется почками и кишечником (20-30% – в неизмененной форме остальное - в виде метаболитов). При однократном приеме 250 и 1200 мг почками выделяется 37,9 и 46%, кишечником – 40,2 и 29,1% соответственно. ;При нарушении функции почек отмечается увеличение TCmax, Cmax и площади под кривой «концентрация-время» (AUC) кларитромицина и его метаболита.

Показания

Взрослым: — фарингит; — тонзиллит; — острый гайморит; — обострение хронического бронхита; — внебольничная пневмония; — неосложненные инфекции кожи и подкожной клетчатки; — диссеминированная инфекция, вызванная Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellulare.;— в комбинации с амоксициллином и омепразолом/лансопразолом в виде тройной терапии при инфекциях, вызванных Helicobacter pylori, включая язвенную болезнь двенадцатиперстной кишки.;Детям: — фарингит; — тонзиллит; — внебольничная пневмония; — острый гайморит; — острый средний отит; — неосложненные инфекции кожи и подкожной клетчатки; — диссеминированная инфекция, вызванная Mycobacterium avium и Mycobacterium intracellulare.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь. Таблетки следует проглатывать, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.;Взрослым и детям старше 12 лет и с массой тела более 33 кг: при фарингите и тонзиллите, вызванным Streptococcus pyogenes - по 250 мг каждые 12 ч в течение 10 дней; при остром гайморите - по 500 мг каждые 12 ч в течение 14 дней; при обострении хронического бронхита, вызванного Haemophilus influenzae - по 500 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней; вызванного Haemophilus parainfluenzae - по 500 мг каждые 12 ч в течение 7 дней; вызванного Moraxella catarrhalis, Streptococcus pneumoniae - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней; при внебольничной пневмонии, вызванной Haemophilus influenzae - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7 дней; вызванной Streptococcus pneumoniae, Chlamydia pneumoniae, Mycoplasma pneumoniae - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней; при неосложненных инфекциях кожи и подкожной клетчатки, вызванных Staphylococcus aureus, Streptococcus pyogenes - по 250 мг каждые 12 ч в течение 7-14 дней.;Для лечения и профилактики инфекций, вызванных Mycobacterium avium, назначают по 500 мг 2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 1000 мг. Длительность лечения - 6 мес и более.;С целью эрадикации Helicobacter pylori;Комбинированное лечение тремя препаратами: - кларитромицин - 500 мг, лансопразол - 30 мг и амоксициллин - 1000 мг 2 раза/сут в течение 10-14 дней; - кларитромицин - 500 мг, омепразол - 20 мг и амоксициллин - 1000 мг 2 раза/сут в течение 10 дней.; Комбинированное лечение двумя препаратами: - кларитромицин - 500 мг 3 раза/сут, омепразол - 40 мг/сут в течение 14 дней, с назначением омепразола в течение последующих 14 дней в дозе 20 мг/сут.;Для пациентов с хронической почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин или концентрации сывороточного креатинина более 3.3 мг/100 мл) дозу снижают в 2 раза, либо в 2 раза увеличивают интервал. Максимальная длительность лечения у пациентов этой группы - 14 дней.

Противопоказания

— повышенная чувствительность к кларитромицину, другим антибиотикам группы макролидов, другим компонентам препарата; — тяжелая печеночная недостаточность, протекающая одновременно с почечной недостаточностью; — порфирия; — гипокалиемия; — одновременный прием цизаприда, астемизола, пимозида, терфенадина, эрготамина и других алкалоидов спорыньи; — одновременное применение с ловастатином и симвастатином, с мидазоламом для перорального приема, с колхицином у пациентов с нарушенной функцией почек или печени, принимающих ингибиторы Р-гликопротеина или мощные ингибиторы изофермента CYP3A4; — наличие у пациентов удлинения интервала QT в анамнезе, желудочковой аритмии или желудочковой тахикардии типа "пируэт"; — холестатическая желтуха /гепатит, возникшие при применении кларитромицина (в анамнезе); — детский возраст до 12 лет (для данной лекарственной формы); — период лактации (грудного вскармливания); — непереносимость лактозы или недостаточность лактазы, а также глюкозо-галактозная мальабсорбция.;С осторожностью: — почечная недостаточность средней и тяжелой степени; — печеночная недостаточность средней и тяжелой степени; — миастения gravis; — одновременное применение с лекарственными препаратами, индуцирующими и метаболизирующимися изоферментом CYP3A4, бензодиазепинами (алпразолам, триазолам, мидазолам для в/в применения), антиаритмическими препаратами класса IA и III, блокаторами медленных кальциевых каналов, которые метаболизируются изоферментом CYP3A4; — ИБС; — тяжелая сердечная недостаточность; — гипомагниемия; выраженная брадикардия.

Применение при беременности и кормлении грудью

Безопасность применения кларитромицина в период беременности не установлена. При беременности, особенно в первый триместр, рекомендуется назначать кларитромицин, если польза от его приема превышает потенциальные риски для плода и/или отсутствует более безопасная терапия альтернативными препаратами. Если беременность наступила во время приема препарата, пациентку следует предупредить о возможных рисках для плода. При необходимости назначения препарата в период лактации следует решить вопрос об отмене грудного вскармливания.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, беспокойство, бессонница, кошмарные сновидения, тремор, судороги, депрессия, дезориентация, галлюцинации, психоз, деперсонализация, спутанность сознания, усиление симптомов миастении gravis, психотические расстройства, парестезия, мания.;Со стороны пищеварительной системы: анорексия, ухудшение аппетита, тошнота, отрыжка, рвота, метеоризм, гастрит, гастралгия, диарея, стоматит, глоссит, кандидоз слизистой оболочки полости рта, изменение цвета языка и зубов, сухость слизистой оболочки полости рта, острый панкреатит, повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз, гепатоцеллюлярный и холестатический гепатит, холестатическая желтуха; редко - псевдомембранозный колит, печеночная недостаточность с летальным исходом в основном на фоне тяжелых сопутствующих заболеваний и/или сопутствующей лекарственной терапии, диспепсия, запор.;Со стороны сердечно-сосудистой системы: желудочковая тахикардия, в т.ч. типа "пируэт", трепетание и мерцание желудочков, увеличение интревала QT на ЭКГ.;Со стороны органов чувств: шум, звон в ушах, вертиго, изменение вкуса (дисгевзия), агевзия; в единичных случаях - потеря слуха, проходящая после отмены препарата, нарушение обоняния, аносмия.; Со стороны кожи и мягких тканей: эритразма, акне, рожа.;Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, миопатия, боль в грудной клетке.;Со стороны органов кроветворения: редко - тромбоцитопения, (необычные кровотечения, кровоизлияния), агранулоцитоз, тромбоцитоз, удлинение протромбинового времени, повышение уровня МНО.;Со стороны мочевыводящей системы: интерстициальный нефрит, почечная недостаточность.;Лабораторные показатели: лейкопения, нейтропения, эозинофилия, повышение концентрации билирубина в крови гиперкреатининемия, гипогликемия (в т.ч. при одновременном приеме гипогликемических препаратов), изменение цвета мочи.;Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, гиперемия кожи, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз, анафилактические реакции, лекарственная сыпь с эозинофилией и системной симптоматикой (DRESS-синдром), пурпура Шенлейна-Геноха, геморрагии.;Прочие: вторичные инфекции (развитие устойчивости микроорганизмов), интенсивное потоотделение, недомогание, астения, озноб, утомляемость.

Передозировка

Симптомы: абдоминальня боль, тошнота, рвота, диарея.; Лечение: промывание желудка, поддерживающая терапия. Не удаляется при гемо - или перитонеальном диализе.

Взаимодействие с другими препаратами

При совместном приеме кларитромицина и лекарственных средств, первично метаболизирующихся изоферментом CYP3A, возможно взаимное повышение их концентраций, что может усилить или продлить как терапевтические, так и побочные эффекты. Противопоказан совместный прием с астемизолом, цизапридом, пимозидом, терфенадином, эрготамином и др. алкалоидами спорыньи; алпразоламом, мидазоламом, триазоламом.;Назначают с осторожностью с карбамазепином, цилостазолом, циклоспорином, дизопирамидом, ловастатином, метилпредниозолоном, омепразолом, непрямыми антикоагулянтами (в т.ч. варфарином), хинидином, рифабутином, силденафилом, симвастатином, такролимусом, винбластином, а так же фенитоином, теофиллином и вальпроевой кислотой (метаболизируются через др. изоферменты цитохрома Р450). Необходима коррекция дозы лекарственного средства и контроль концентрации в крови.;При совместном применении с цизапридом, пимозидом, терфенадином и астемизолом возможно увеличение концентрации последних в крови, увеличение интервала QT, появление аритмии, включая желудочковую тахикардию в т.ч. типа "пируэт" и фибрилляцию желудочков.; При совместном применении с эрготамином и дигидроэрготамином возможно острое отравление препаратами группы эрготамина (сосудистый спазм, ишемия конечностей и других тканей, включая центральную нервную систему).;Эфавиренз, невирапин, рифампицин, рифабутин и рифапентин (индукторы цитохрома Р450) снижают уровень кларитромицина в плазме и ослабляют терапевтический эффект последнего, и, вместе с тем, увеличивая уровень 14-гидроксикларитромицина.;При совместном приеме флуконазола в дозе 200 мг ежедневно и кларитромицина в дозе 1 г/сут возможно увеличение Css и AUC кларитромицина на 33% и 18%, соответственно. Коррекция дозы кларитромицина не требуется.;При совместном приеме ритонавира 600 мг/сут и кларитромицина 1 г/сут возможно снижение метаболизма кларитромицина (увеличение Cmax на 31%, Css на 182% и AUC на 77%), полное подавление образования 14-гидроксикларитромицина. У пациентов с хронической почечной недостаточностью необходима коррекции дозы: при клиренсе креатинина (КК) 30-60 мл/мин доза кларитромицина должна быть уменьшена на 50%, при КК менее 30 мл/мин на 75%. Ритонавир не следует принимать совместно с кларитромицином в дозе, превышающей 1 г/сут.;При совместном приеме с хинидином и дизопирамидом возможно возникновение желудочковой тахикардии типа "пируэт". Необходим контроль ЭКГ (увеличение интервала QT), сывороточных концентраций этих лекарственных средств.;Кларитромицин увеличивает концентрации ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы (ловастатин, симвастатин). Возможно развитие рабдомиолиза у пациентов, принимающих эти препараты совместно.; При применении кларитромицина и омепразола возможно увеличение Cmax, AUC и

периода полувыведения омепразола на 30%, 89% и 34% соответственно. Среднее значение pH в желудке в течение 24 ч составляло 5,2 при приеме только омепразола и 5,7 при приеме омепразола совместно с кларитромицином.;При применении кларитромицина и непрямых антикоагулянтов возможно усиление действия последних.;При применении кларитромицина с силденафилом, тадалафилом или варденафилом (ингибиторы фосфодиэстеразы-5), возможно увеличение ингибирующего воздействия на фосфодиэстеразу. Может потребоваться уменьшение дозы силденафила, тадалафила и варденафила.;При совместном применениии кларитромицина с теофиллином и карбамазепином возможно повышение концентрации последних в системном кровотоке.;При применении кларитромицина с толтеродином у пациентов с низким уровнем метаболизма через CYP2D6 может потребоваться снижение дозы толтеродина в присутствии кларитромицина (ингибитор CYP3A).; При совместном приеме кларитромицина (1 г/сут) с мидазоламом (перорально) возможно увеличение AUC мидазолама в 7 раз. Необходимо избегать совместного перорального приема кларитромицина и мидазолама и др. бензодиазепинами, которые метаболизируются CYP3A (триазолам и алпразолам). При применении мидазолама (внутривенно) и кларитромицина может потребоваться корректировка дозы. Такие же меры предосторожности следует применять и к другим бензодиазепинам, которые метаболизируются CYP3A. Для бензодиазепинов, выведение которых не зависит от CYP3A (темазепам, нитразепам, лоразепам), маловероятно клинически значимое взаимодействие с кларитромицином.;При совместном приеме кларитромицина с колхицином возможно усиление действия колхицина. Необходим контроль возможного развития клинических симптомов интоксикации колхицином, особенно у пожилых пациентов и пациентов с хронической почечной недостаточностью (сообщалось о случаях с летальным исходом).;При совместном приеме кларитромицина и дигоксина следует тщательно контролировать концентрацию дигоксина в сыворотке (возможно повышение его концентрации и развитие потенциально летальных аритмий).;Одновременный прием кларитромицина и зидовудина взрослыми ВИЧ-инфицированными пациентами может привести к снижению Css зидовудина. Необходим подбор доз кларитромицина и зидовудина. Этот вид взаимодействия не встречается у ВИЧ-инфицированных детей, получающих кларитромицин в виде суспензии совместно с зидовудином.; При совместном приеме кларитромицина (l г/сут) и атазанавира (400 мг/сут) возможно увеличение AUC атазанавира на 28%, кларитромицина в 2 раза, уменьшение AUC 14-гидроксикларитромицина на 70%. У пациентов с КК 30-60 мл/мин доза кларитромицина должна быть уменьшена на 50%. Кларитромицин в дозах, превышающих 1 г/сут, нельзя назначать совместно с ингибиторами протеаз.;При совместном приеме кларитромицина и интраконазола возможно обоюдное увеличение концентрации препаратов в плазме. За пациентами, одновременно

принимающими итраконазол и кларитромицин, необходимо тщательное наблюдение из-за возможного усиления или удлиннения фармакологических эффектов этих лекарственных средств.;При одновременном приеме кларитромицина (l г/сут) и саквинавира (в мягких желатиновых капсулах, 1200 мг 3 раза в день) возможно увеличение AUC и Css саквинавира на 177% и 187% соответственно, а кларитромицина на 40%. При совместном назначении этих двух лекарственных средств в течение ограниченного времени в дозах/лекарственных формах, указанных выше, корректировка дозы не требуется.;При совместном приеме с верапамилом возможно снижение артериального давления, брадиаритмия и молочнокислый ацидоз.

Особые указания

При наличии хронических заболеваний печени необходимо проводить регулярный контроль активности ферментов в сыворотке крови.;С осторожностью назначают на фоне лекарственных средств, метаболизирующихся печенью (рекомендуется измерять их концентрацию в крови).;В случае совместного назначения с варфарином или другими антикоагулянтами необходимо контролировать протромбиновое время.;При развитии вторичной инфекции должна быть назначена адекватная терапия.;При возникновении во время или после лечения тяжелой диареи следует исключить диагноз псевдомембранозного колита, который требует немедленной отмены препарата и назначения соответствующего лечения.

Условия хранения

В сухом месте