

Препарат Арлет®

Состав и форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
амоксциллин (в форме тригидрата)	250 мг
клавулановая кислота (в форме калиевой соли)	125 мг
<i>вспомогательные вещества:</i> повидон (поливинилпирролидон); тальк; крахмал 1500; кальция стеарат; кремния диоксид коллоидный (аэросил); МКЦ	
<i>оболочка:</i> гипромеллоза (оксипропилметилцеллюлоза); пропиленгликоль; титана диоксид; макрогол 4000 (полиэтиленоксид 4000)	

в контурной ячейковой упаковке 7 шт., в пакете 2 упаковки; в пачке картонной 1 пакет; или в банках темного стекла 14 шт.; в пачке картонной 1 банка.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
амоксциллин (в форме тригидрата)	500 мг
клавулановая кислота (в форме калиевой соли)	125 мг
<i>вспомогательные вещества:</i> повидон (поливинилпирролидон); тальк; крахмал 1500; кальция стеарат; кремния диоксид коллоидный (аэросил); МКЦ	

<i>оболочка:</i> гипромеллоза (оксипропилметилцеллюлоза); пропиленгликоль; титана диоксид; макрогол 4000 (полиэтиленоксид 4000)	
---	--

в контурной ячейковой упаковке 7 шт., в пакете 2 упаковки; в пачке картонной 1 пакет; или в банках темного стекла 14 шт.; в пачке картонной 1 банка.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
амоксициллин (в форме тригидрата)	875 мг
клавулановая кислота (в форме калиевой соли)	125 мг
<i>вспомогательные вещества:</i> повидон (поливинилпирролидон); тальк; крахмал 1500; кальция стеарат; кремния диоксид коллоидный (аэросил); МКЦ	
<i>оболочка:</i> гипромеллоза (оксипропилметилцеллюлоза); пропиленгликоль; титана диоксид; макрогол 4000 (полиэтиленоксид 4000)	

в контурной ячейковой упаковке 7 шт., в пакете 2 упаковки; в пачке картонной 1 пакет; или в банках темного стекла 14 шт.; в пачке картонной 1 банка.

Описание лекарственной формы

Таблетки белого или почти белого цвета, продолговатые.

Характеристика

Антибиотик широкого спектра действия.

Фармакологическое действие

Фармакологическое действие - антибактериальное широкого спектра.

Фармакодинамика

Содержит полусинтетический пенициллин-амоксициллин и необратимый ингибитор β -лактамаз — клавулановую кислоту. Клавулановая кислота обеспечивает стойкий инактивированный комплекс с этими ферментами и обеспечивает устойчивость амоксициллина к воздействию β -лактамаз, продуцируемых микроорганизмами.

Клавулановая кислота, подобная по структуре β -лактамным антибиотикам, обладает слабой собственной антибактериальной активностью.

Препарат обладает широким спектром антибактериального действия.

Активен в отношении чувствительных к амоксициллину штаммов, включая штаммы, продуцирующие β -лактамазы: аэробные грамположительные бактерии — *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus viridans*, *Streptococcus bovis*, *Staphylococcus aureus* (кроме метициллин-резистентных штаммов), *Staphylococcus epidermidis* (кроме метициллин-резистентных штаммов), *Staphylococcus saprophyticus*, *Listeria spp.*, *Enterococcus spp.*; аэробные грамотрицательные бактерии — *Bordetella pertussis*, *Brucella spp.*, *Campylobacter jejuni*, *Escherichia coli*, *Gardnerella vaginalis*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus ducreyi*, *Klebsiella spp.*, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Pasteurella multocida*, *Proteus spp.*, *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*, *Vibrio cholerae*, *Yersinia enterocolitica*, *Helicobacter pylori*, *Eikenella corrodens*; анаэробные грамположительные бактерии — *Peptococcus spp.*, *Peptostreptococcus spp.*, *Clostridium spp.*, *Actinomyces israelii*, *Fusobacterium spp.*, *Prevotella spp.*; анаэробные грамотрицательные бактерии — *Bacteroides spp.*

Фармакокинетика

Основные фармакокинетические параметры амоксициллина и клавулановой кислоты сходны.

Всасывание

После приема препарата внутрь оба компонента хорошо всасываются из ЖКТ, прием пищи не влияет на степень всасывания. C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч после приема препарата и составляет (в зависимости от дозы) для амоксициллина 3–12 мкг/мл, для клавулановой кислоты — около 2 мкг/мл.

Распределение

Оба компонента характеризуются хорошим объемом распределения в жидкостях и тканях организма (в т.ч. легкие, среднее ухо, плевральная и перитонеальная жидкости, матка, яичники). Амоксициллин проникает также в синовиальную жидкость, печень, предстательную железу, небные миндалины, мышечную ткань, желчный пузырь, секрет придаточных пазух носа, слюну, бронхиальный секрет.

Амоксициллин и клавулановая кислота не проникают через ГЭБ при невоспаленных мозговых оболочках.

Активные вещества проникают через плацентарный барьер и в следовых концентрациях выделяются с грудным молоком. Степень связывания с белками плазмы крови низкая.

Метаболизм

Амоксициллин частично метаболизируется, клавулановая кислота подвергается, по-видимому, интенсивному метаболизму.

Выведение

Амоксициллин выводится почками практически в неизмененном виде путем канальцевой секреции и клубочковой фильтрации. Клавулановая кислота выводится путем клубочковой фильтрации, частично в виде метаболитов. Небольшие количества могут выводиться через кишечник и легкие.

$T_{1/2}$ амоксициллина и клавулановой кислоты — 1–1,5 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При тяжелой почечной недостаточности $T_{1/2}$ увеличивается до 7,5 ч для амоксициллина и до 4,5 ч — клавулановой кислоты. Оба компонента удаляются гемодиализом и незначительные количества — перитонеальным диализом.

Показания препарата Арлет®

Лечение инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами:

инфекции верхних отделов дыхательных путей и ЛОР-органов (в т.ч. острый и хронический синусит, острый и хронический средний отит, заглоточный абсцесс, тонзиллит, фарингит);

инфекции нижних отделов дыхательных путей (в т.ч. острый бронхит с бактериальной суперинфекцией, хронический бронхит, пневмония);

инфекции мочевыводящих путей;

гинекологические инфекции;

инфекции кожи и мягких тканей;

инфекции костной и соединительной ткани;

инфекции желчных путей (холецистит, холангит);

одонтогенные инфекции.

Противопоказания

повышенная чувствительность к амоксициллину или клавулановой кислоте, антибиотикам группы пенициллинов, цефалоспоринов;

инфекционный мононуклеоз (в т.ч. при появлении кореподобной сыпи);

детский возраст до 3 лет.

С осторожностью:

печеночная недостаточность тяжелой степени;

заболевания ЖКТ (в т.ч. колит, связанный с применением антибиотиков группы пенициллинов, в анамнезе);

хроническая почечная недостаточность.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат с осторожностью назначают при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Арлет® можно применять при беременности, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Амоксициллин и клавулановая кислота в небольших количествах выделяются с грудным молоком, поэтому при необходимости назначения препарата в период лактации необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Побочные действия

Со стороны пищеварительной системы: потеря аппетита, тошнота, рвота, диарея; редко — нарушения функции печени, повышение активности АЛТ и АСТ; в единичных случаях — холестатическая желтуха, гепатит, псевдомембранозный колит.

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, обратимые гиперактивность и судороги.

Со стороны системы кроветворения: обратимое увеличение протромбинового времени, лейкопения, обратимые агранулоцитоз и гемолитическая анемия.

Со стороны мочеполовой системы: интерстициальный нефрит, кристаллурия.

Аллергические реакции: зуд, крапивница, эритематозная сыпь; редко — многоформная экссудативная эритема, ангионевротический отек, анафилактический шок; в единичных случаях — эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона.

Прочие: развитие суперинфекции (в т.ч. кандидоз).

Взаимодействие

При одновременном применении Арлет® усиливает токсичность метотрексата.

При одновременном применении Арлета® с аллопуринолом повышается риск развития экзантемы.

При одновременном применении Арлета® с антацидами, глюкозамином, слабительными средствами, аминогликозидами абсорбция замедляется, с аскорбиновой кислотой — повышается.

При одновременном применении Арлета® с бактерицидными антибиотиками (в т.ч. аминогликозиды, цефалоспорины, циклосерин, ванкомицин, рифампицин) проявляется

синергизм действия; с антибиотиками с бактериостатическим механизмом действия (в т.ч. макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины) и сульфаниламидами — антагонизм.

При одновременном применении Арлет® повышает эффективность действия непрямых антикоагулянтов за счет подавления кишечной микрофлоры, снижения синтеза витамина К и снижения протромбинового индекса. При назначении данной комбинации следует проводить динамический контроль анализов крови.

При одновременном применении Арлет® уменьшает эффективность пероральных контрацептивов.

При одновременном назначении Арлета® с препаратами, в процессе метаболизма которых образуется парааминобензойная кислота, этинилэстрадиолом повышается риск развития прорывных кровотечений.

Диуретики, аллопуринол, фенилбутазон, НПВС и другие ЛС, блокирующие канальцевую секрецию, повышают концентрацию амоксициллина (клавулановая кислота выводится в основном путем клубочковой фильтрации).

Способ применения и дозы

Внутрь. Взрослым и детям старше 12 лет (или с массой тела >40 кг) при *легком или среднетяжелом течении инфекции* — по 1 табл. 250/125 мг каждые 8 ч или по 1 табл. 500/125 мг каждые 12 ч, в случае *тяжелого течения инфекции и инфекций дыхательных путей* — по 1 табл. 500/125 мг каждые 8 ч или по 1 табл. 875/125 мг каждые 12 ч.

Детям младше 12 лет с массой тела <40 кг доза препарата подбирается индивидуально на основании рекомендуемой схемы дозирования (для амоксициллина) — 45 мг/кг/сут в 2 приема или 40 мг/кг/сут в 3 приема. Оптимальной лекарственной формой препарата для детей от 6 до 12 лет являются таблетки 500/125 мг при назначении 2 раза в сутки.

Максимальная суточная доза клавулановой кислоты (в форме калиевой соли) для взрослых — 600 мг, для детей — 10 мг/кг массы тела. Максимальная суточная доза амоксициллина для взрослых — 6 г, для детей — 45 мг/кг массы тела.

Курс лечения — 5–14 дней. Продолжительность курса лечения определяется лечащим врачом. Лечение не должно продолжаться более 14 дней без повторного медицинского осмотра.

При *одонтогенных инфекциях* — по 1 табл. 250/125 мг каждые 8 ч или 1 табл. 500/125 мг каждые 12 ч в течение 5 дней.

При почечной недостаточности средней степени тяжести (С1 креатинина 10–30 мл/мин) — по 1 табл. 500/125 мг каждые 12 ч взрослым и 15/3,75 мг/кг массы тела 2 раза в сутки детям до 12 лет.

При почечной недостаточности тяжелой степени (С1 креатинина <10 мл/мин) — по 1 табл. 500/125 мг каждые 24 ч взрослым, детям до 12 лет — 15/3,75 мг/кг массы тела 1 раз в сутки.

При анурии интервал между приемами разовых доз следует увеличить до 48 ч и более.

Взрослым, находящимся на гемодиализе, следует назначать препарат в дозе по 1 табл. 500/125 мг или по 2 табл. 250/125 мг каждые 24 ч. Для компенсации снижения концентрации амоксициллина и клавулановой кислоты в сыворотке крови во время диализа следует дополнительно принимать 1 дозу препарата во время сеанса диализа и еще одну дозу в конце сеанса.

Детям, находящимся на гемодиализе, следует назначать препарат в дозе из расчета 15/3,75 мг/кг массы тела 1 раз в сутки. Для компенсации снижения концентрации амоксициллина и клавулановой кислоты в крови во время диализа следует дополнительно принимать 1 дозу препарата до начала сеанса диализа и еще одну дозу после сеанса диализа.

Передозировка

Симптомы: боль в животе, диарея, рвота; возможно также тревожное возбуждение, бессонница, головокружение; в отдельных случаях — судорожные припадки.

Лечение: в случае недавнего приема препарата (<4 ч) необходимо промыть желудок и назначить активированный уголь для уменьшения всасывания препарата; пациент должен находиться под врачебным контролем. При необходимости следует провести симптоматическую терапию. Эффективен гемодиализ.

Особые указания

С осторожностью применяют препарат у пациентов с нарушениями функции печени, в период лечения регулярно контролируют функцию печени.

При курсовом лечении следует контролировать функции кроветворения, печени и почек.

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек требуется адекватная коррекция режима дозирования или увеличение интервалов между приемами препарата.

С целью снижения риска развития побочных реакций со стороны ЖКТ следует принимать препарат во время еды.

Поскольку таблетки комбинированного препарата 250 мг/125 мг и 500 мг/125 мг содержат одинаковое количество клавулановой кислоты (125 мг), то 2 табл. по 250 мг/125 мг не эквивалентны 1 табл. 500 мг/125 мг.

Высокие концентрации амоксициллина дают ложноположительную реакцию при определении глюкозы в моче при использовании реактива Бенедикта или раствора Феллинга (рекомендуют применять ферментативные реакции с глюкозидазой).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат в рекомендуемых дозах не влияет на способность к вождению транспорта и управлению сложными механизмами.

Условия хранения препарата Арлет®

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности препарата Арлет®

2 года.