

## **ИНСТРУКЦИЯ**

**по медицинскому применению препарата**

## **АЗИТРОМИЦИН**

**Регистрационный номер:** ЛСР-002099/10

**Торговое название:** АЗИТРОМИЦИН

**Международное непатентованное название:** азитромицин

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые пленочной оболочкой

### **Состав**

С 1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит

*Активное вещество:* Азитромицина дигидрат (эквивалентен безводному азитромицину) - 524 мг (500 мг)

*Вспомогательные вещества:* крахмал прежелатинизированный, гипролоза, коповидон, кросповидон, кальция гидрофосфат безводный, тальк, натрия лаурилсульфат, магния стеарат, гипромеллоза, макрогол 6000, титана диоксид, диметикон.

**Описание:** овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого цвета, с поперечной насечкой на одной стороне, разделяющей таблетку на две равные половины. На поперечном разрезе таблетки видно белое ядро и тонкое белое пленочное покрытие.

**Фармакотерапевтическая группа:** антибиотик - азитромицин

**Код АТХ:** J01FA10

### **Фармакологическое действие**

#### *Фармакодинамика*

Азитромицин - бактериостатический антибиотик широкого спектра действия из группы макролидов-азалидов. Обладает широким спектром антимикробного действия. Механизм действия азитромицина связан с подавлением синтеза белка микробной клетки. Связываясь с 50S-субъединицей рибосом, угнетает пептидтрансферазу на стадии трансляции и подавляет синтез белка, замедляя рост и размножение бактерий. В высоких концентрациях оказывает бактерицидное действие.

Обладает активностью в отношении ряда грамположительных, грамотрицательных, анаэробов, внутриклеточных и других микроорганизмов.

Микроорганизмы могут изначально быть устойчивыми к действию антибиотика или могут приобретать устойчивость к нему.

*В большинстве случаев чувствительные микроорганизмы*

1. Грамположительные аэробы  
Staphylococcus aureus - метициллинчувствительный, Streptococcus pneumoniae - пенициллинчувствительный, Streptococcus pyogenes
2. Грамотрицательные аэробы  
Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Legionella pneumophila, Moraxella catarrhalis, Pasteurella multocida, Neisseria gonorrhoeae
3. Анаэробы  
Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Prevotella spp., Porphyromonas spp.
4. Другие микроорганизмы  
Chlamydia trachomatis, Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Mycoplasma pneumoniae, Mycoplasma hominis, Borrelia burgdorferi

*Микроорганизмы, способные развить устойчивость к азитромицину*

Грамположительные аэробы

*Streptococcus pneumoniae* пенициллиноустойчивый

*Изначально устойчивые микроорганизмы* Грамположительные аэробы

*Enterococcus faecalis, Staphylococci* (метициллиноустойчивые стафилококки проявляют очень высокую степень устойчивости к макролидам).

Грамположительные бактерии, устойчивые к эритромицину.

*Анаэробы*

*Bacteroides fragilis*

*Фармакокинетика*

После приема внутрь азитромицин хорошо всасывается и быстро распределяется в организме.

После однократного приема 500 мг биодоступность - 37 % (эффект «первого прохождения»), максимальная концентрация (0,4 мг/мл) в крови создается через 2-3 часа, кажущийся объем распределения 31,1 л/кг, связывание с белками обратно пропорционально концентрации в крови и составляет 7-50%. Проникает через мембраны клеток (эффективен при инфекциях, вызванных внутриклеточными возбудителями). Транспортируется фагоцитами к месту инфекции, где высвобождается в присутствии бактерий. Легко проходит гистогематические барьеры и поступает в ткани. Концентрация в тканях и клетках в 10-50 раз выше, чем в плазме, а в очаге инфекции - на 24-34% больше, чем в здоровых тканях.

У азитромицина очень длительный период полувыведения - 35-50 ч. Период полувыведения из тканей значительно больше. Терапевтическая концентрация азитромицина сохраняется до 5-7 дней после приема последней дозы. Азитромицин выводится, в основном, в неизменном виде - 50% кишечником, 6% - почками. В печени деметилируется, теряя активность.

### **Показания к применению**

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

- инфекции верхних отделов дыхательных путей и ЛОР-органов (синусит, тонзиллит, фарингит, средний отит);
- инфекции нижних отделов дыхательных путей: острый бронхит, обострение хронического бронхита, пневмония, в том числе вызванные атипичными возбудителями;
- инфекции кожи и мягких тканей (рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы, угри обыкновенные средней степени тяжести);
- начальная стадия болезни Лайма (боррелиоз) - мигрирующая эритема (*erythema migrans*);
- инфекции мочеполовых путей, вызванные *Chlamidia trachomatis* (уретрит, цервицит).

### **Противопоказания**

Гиперчувствительность к антибиотикам группы макролидов, тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность, детский возраст до 12 лет (с массой тела менее 45 кг), грудное вскармливание, одновременный прием с эрготамином и дигидроэрготамином.

### **С осторожностью**

Умеренные нарушения функции печени и почек, при аритмиях или предрасположенности к аритмиям и удлинению интервала QT, при совместном назначении терфенадина, варфарина, дигоксина.

### **Применение при беременности и в период лактации**

При беременности препарат назначают только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания на время применения препарата.

### **Способ применения и дозы**

Внутрь, 1 раз в сутки, по крайней мере, за 1 час или через 2 часа после еды. Взрослым (включая пожилых людей) и детям старше 12 лет с массой тела свыше 45 кг.

При инфекциях верхних и нижних отделов дыхательных путей, ЛОР-органов, кожи и мягких тканей - 0,5 г/сут за 1 прием в течение 3 дней (курсовая доза - 1,5 г).

При мигрирующей эритеме (болезни Лайма) для лечения I стадии - 1 раз в сутки в течение 5 дней: 1-ый день - 1,0 г, затем со 2-го по 5-ый день - по 0,5 г ежедневно (курсовая доза - 3 г).

Угри обыкновенные - 6 г курсовая доза, 0,5 г/сут за 1 прием в течение 3 дней, затем по 0,5 г/сут 1 раз в неделю в течение 9 недель. Первую еженедельную таблетку следует принять через 7 дней после приема первой ежедневной таблетки (8 день от начала лечения), последующие 8 еженедельных таблеток - с интервалом в 7 дней.

При инфекциях мочеполовых путей, вызванных *Chlamidia trachomatis* (неосложненный уретрит или цервицит) - однократно 1 г.

Назначение пациентам с нарушениями функции почек: для пациентов с умеренными нарушениями функции почек (клиренс креатинина > 40 мл/мин) коррекция дозы не нужна.

### **Побочные действия**

*Со стороны кровеносной и лимфатической систем:* тромбоцитопения, нейтропения.

*Со стороны центральной нервной системы:* головокружение/вертиго, головная боль, судороги, сонливость, парестезия, астения, бессонница, гиперактивность, агрессивность, беспокойство, нервозность.

*Со стороны органов чувств:* шум в ушах, обратимое нарушение слуха вплоть до глухоты (при приеме высоких доз в течение длительного времени), нарушение восприятия вкуса и запаха.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* сердцебиение, аритмия, желудочковая тахикардия, увеличение интервала QT, двунаправленная желудочковая тахикардия.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* тошнота, рвота, диарея, абдоминальные боли/спазмы, метеоризм, расстройство пищеварения, анорексия, запор, изменение цвета языка, псевдомембранозный колит, холестатическая желтуха, гепатит, изменение лабораторных показателей функции печени, печеночная недостаточность, некроз печени (возможно со смертельным исходом).

*Аллергические реакции:* зуд, кожные высыпания, ангионевротический отек, крапивница, фотосенсибилизация, анафилактическая реакция, включая отек (в редких случаях со смертельным исходом), многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз. *Со стороны опорно-двигательного аппарата:* артралгия.

*Со стороны мочеполовой системы:* нефрит, острая почечная недостаточность.

*Прочие:* вагинит, кандидоз.

### **Передозировка**

*Симптомы:* тошнота, временная потеря слуха, рвота, диарея.

*Лечение:* прием активированного угля, промывание желудка, симптоматическая терапия.

### **Взаимодействие с другими лекарственными препаратами**

Антацидные средства не влияют на биодоступность азитромицина, но уменьшают максимальную концентрацию азитромицина в плазме крови на 30 %, поэтому препарат следует принимать, по крайней мере, за один час до или через два часа после приема этих препаратов и еды.

Азитромицин не влияет на концентрацию карбамазепина, диданозина, рифабутина и метилпреднизолона в крови при совместном использовании.

При парентеральном применении азитромицин не влияет на концентрацию циметидина, эфавиренза, флуконазола, индинавира, мидазолама, триазолама, триметоприма/сульфаметоксазола в крови при совместном использовании, однако не следует исключать возможности таких взаимодействий при назначении азитромицина для приема внутрь.

Азитромицин не влияет на фармакокинетику теофиллина, однако при совместном приеме с

другими макролидами концентрация теофиллина в плазме крови может повышаться. При необходимости совместного применения с циклоспорином, рекомендуется контролировать содержание циклоспорина в крови. Несмотря на то, что данных о влиянии азитромицина на изменение концентрации циклоспорина в крови нет, другие представители класса макролидов способны изменять его уровень в плазме крови. При совместном приеме дигоксина и азитромицина необходимо контролировать уровень дигоксина в крови, так как многие макролиды повышают всасывание дигоксина в кишечнике, увеличивая тем самым его концентрацию в плазме крови. При необходимости совместного приема с варфарином рекомендуется проводить тщательный контроль протромбинового времени.

Было установлено, что одновременный прием терфенадина и антибиотиков класса макролидов вызывает аритмию и удлинение QT интервала. Исходя из этого, нельзя исключить вышеуказанных осложнений при совместном приеме терфенадина и азитромицина.

Поскольку существует возможность ингибирования изофермента CYP3A4 азитромицином в парентеральной форме при совместном назначении с циклоспорином, терфенадином, алкалоидами спорыньи, цизапридом, пимозидом, хинидином, астемизолом и другими препаратами, метаболизм которых происходит с участием этого фермента, следует учитывать возможность такого взаимодействия при назначении азитромицина для приема внутрь.

При совместном приеме азитромицина и зидовудина, азитромицин не влияет на фармакокинетические параметры зидовудина в плазме крови или на выведение почками его и его метаболита глюкуронида. Тем не менее, увеличивается концентрация активного метаболита - фосфорилированного зидовудина в многоядерных клетках периферических сосудов. Клиническое значение данного факта не ясно.

При одновременном приеме макролидов с эрготамином и дигидроэрготамином возможно проявление их токсического действия (вазоспазм, дизестезия).

### **Особые указания**

В случае пропуска приема одной дозы препарата - пропущенную дозу следует принять как можно раньше, а последующие - с интервалом в 24 ч.

Также как при проведении любой антибиотикотерапии, при лечении азитромицином, возможно присоединение суперинфекции (в том числе грибковой).

Азитромицин следует принимать, по крайней мере, за один час до или через два часа после приема антацидных препаратов.

Влияние на способность управлять автотранспортом и механизмами. В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

### **Форма выпуска**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 500 мг

По 3 таблетки в блистер из пленки ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной, один блистер помещен в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

### **Срок годности**

2 года.

Не использовать после окончания срока годности.

### **Условия хранения**

Список Б.

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

Хранить в недоступном для детей месте.

**Условия отпуска из аптек:** по рецепту.