

[Инструкция Лорикацин раствор для инъекций, 50 мг/мл по 2 мл в ампуле. №10](#)

ВНИМАНИЕ! Вся информация взята из открытых источников и предоставляется исключительно в ознакомительных целях.

## Лорикацин раствор для инъекций, 50 мг/мл по 2 мл в ампуле. №10



**Действующее вещество:** Амикацин

**Лекарственная форма:** Растворы для внутреннего применения

**Фармакотерапевтическая группа:** Антибактериальные средства для системного применения. Аминогликозиды. Амикацин.

### Состав

*действующее вещество:* amikacin;

1 мл раствора содержит амикацина сульфат в количестве, что соответствует амикацина 50 мг или 250 мг;

*вспомогательные вещества:* натрия цитрат, натрия метабисульфит (Е 223), кислота серная, вода для инъекций.

### Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный раствор, от бесцветного до желтоватого цвета, без запаха.

### Фармакотерапевтическая группа

Антибактериальные средства для системного применения. Аминогликозидные антибактериальные средства. Другие аминогликозиды. Амикацин.

Код АТХ J01GB06.

## Фармакологические свойства

### Фармакодинамика.

Амикацин - полусинтетический антибиотик группы аминогликозидов широкого спектра действия. Проявляет бактерицидное действие. Активно проникая через мембрану бактерий, необратимо связывается с 30S субъединицей рибосом, подавляет синтез белка возбудителя.

Высокоактивен в отношении аэробных грамотрицательных бактерий: *Pseudomonas aeruginosa*, *Escherichia coli*, *Shigella spp.*, *Salmonella spp.*, *Klebsiella spp.*, *Enterobacter spp.*, *Serratia spp.*, *Providencia stuartii*.

Активен также в отношении некоторых грамположительных бактерий: *Staphylococcus spp.*, (в т.ч. штаммов, устойчивых к пенициллину, метициллину, некоторым цефалоспорином), некоторых штаммов *Streptococcus spp.*

Неактивен в отношении анаэробных бактерий.

### Фармакокинетика.

#### Всасывания.

После внутримышечного введения всасывается быстро и полностью. Максимальная концентрация (C<sub>max</sub>) в плазме крови при внутримышечном введении препарата в дозе

7,5 мг/кг - 21 мг/мл, после в/в инфузии в дозе 7,5 мг/кг в течение 30 мин - 38 мкг/мл. Время достижения максимальной (C<sub>max</sub>) концентрации в плазме крови после внутримышечного введения - приблизительно 1,5 часа.

#### Распределение.

Равномерно распределяется во внеклеточном веществе (содержимое абсцессов, плевральный выпот, асцитична, перикардальная, синовиальная, лимфатическая и перитонеальная жидкость); в высоких концентрациях обнаруживается в моче; в низких - в желчи, грудном молоке, водянистой влаге глаза, бронхиальном секрете, мокроте и спинномозговой жидкости. Легко проникает во все ткани организма, где накапливается внутриклеточно. Высокие концентрации обнаруживаются в органах с интенсивным кровоснабжением: легких, печени, миокарде, селезенке и особенно в корковом веществе почек; более низкие концентрации - в мышцах, жировой ткани и костях.

У взрослых пациентов в средних терапевтических дозах (в норме) амикацин не проникает через гематоэнцефалический барьер, при воспалении мозговых оболочек - проникновение резко увеличивается. У новорожденных достигаются более высокие концентрации в спинномозговой жидкости, чем у взрослых.

Амикацин проникает через плацентарный барьер - обнаруживается в крови плода и амниотической жидкости.

Объем распределения (V<sub>d</sub>) у взрослых - 0,26 л/кг, у детей - 0,2-0,4 л/кг, у новорожденных в возрасте менее недели с массой тела менее 1,5 кг - до 0,68 л/кг, в возрасте менее недели и массой тела более 1,5 кг - до 0,58 л/кг, у больных муковисцидозом - 0,3-0,39 л/кг.

Средняя терапевтическая концентрация при внутривенном или внутримышечном введении

сохраняется в течение 10-12 часов.

### Метаболизм.

Не метаболизируется.

### Вывод.

Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) в терминальной (b) фазе у взрослых – 2-4 часа, у новорожденных

- 5-8 часов, у детей – 2,5-4 часа. Конечная величина  $T_{1/2}$  – более 100 часов

(высвобождается из внутриклеточных депо).

Выводится почками путем клубочковой фильтрации (65-94%) преимущественно в неизменном виде. Почечный клиренс – 79-100 мл/мин.

### Фармакокинетика в особых клинических случаях.

При нарушении функции почек у взрослых  $T_{1/2}$  варьирует в зависимости от степени нарушения – до 100 часов, у больных с муковисцидозом – 1-2 часа. У больных с ожогами и гипертермией  $T_{1/2}$  может быть короче со средними показателями вследствие повышенного клиренса.

Выводится при гемодиализе (50 % за 4-6 часов) и перитонеальном диализе (25 % за 48-72 часа).

## **Показания**

Инфекции, вызванные чувствительными к амикацину штаммами микроорганизмов, резистентными к другим аминогликозидам.

## **Противопоказания**

- Почечная недостаточность;
- неврит слухового нерва;
- повышенная чувствительность к амикацину или до любого другого антибиотика аминогликозидной группы и их производных;
- повышенная чувствительность к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата;
- *myasthenia gravis*;
- нарушения функции вестибулярного аппарата;
- азотемия (остаточный азот выше 150 мг %);
- предшествующее лечение ото- или нефротоксичными препаратами.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Фармацевтически несовместим с пенициллинами, гепарином, цефалоспорином, капреомицином, амфотерицином В, гидрохлоротиазидом, эритромицином, нитрофурантоином, витаминами группы В и С, калия хлоридом.

Амикацин проявляет синергизм при взаимодействии с карбеницилином, бензилпенициллином,

цефалоспорины (у больных с тяжелой хронической почечной недостаточностью при одновременном применении с бета-лактамами антибиотиками возможно снижение эффективности аминогликозидов).

Налидиксовая кислота, полимиксин В, цисплатин и ванкомицин увеличивают риск развития ото- и нефротоксичности.

При одновременном применении с пенициллином, цефалоспорины, сульфаниламидами, ванкомицинами, метоксифлураном, энфлураном, нестероидными противовоспалительными средствами (НПВС), рентгеноконтрастными средствами, циклоспорином, цисплатином, амфотерицином В, цефалотином, полимиксином и диуретиками (особенно фуросемидом) повышается риск развития нефротоксического действия.

Индометацин, фенилбутазон и другие НПВС, нарушающие почечный кровоток, могут замедлять скорость выведения амикацина. Если амикацин применять одновременно с внутривенным введением индометацина недоношенным младенцам, происходит повышение концентрации препарата в плазме крови и возникает риск развития токсичности.

Усиливает миорелаксирующее действие курареподобных препаратов.

Метоксифлуран, полимиксин для парентерального введения, капреомицин и другие лекарственные средства, блокирующие нервно-мышечную передачу (галогенизованные углеводные препараты в качестве препаратов для ингаляционной анестезии, опиоидные анальгетики), переливание большого объема крови из цитратными консервантами – повышают риск остановки дыхания.

Парентеральное введение индометацина повышает риск развития токсического действия аминогликозидов (увеличение  $T_{1/2}$  и снижение клиренса).

Амикацин уменьшает эффективность лекарственных средств, применяемых при *myastheniagravis*.

При одновременном применении с эфиром этиловым и блокаторами нервно-мышечной передачи повышается риск угнетения дыхания.

Риск развития ототоксического действия повышается при одновременном применении амикацина с фуросемидом и этакриновой кислотой.

Комбинация антибиотикам – амикацин+цефтазидим и амикацин+цефотаксим проявляют наиболее аддитивный и синергический эффект по отношению к *Pseudomonas aeruginosa*.

## **Особенности применения**

Перед применением препарата следует определить чувствительность выделенных возбудителей.

Не следует применять амикацин больным с повышенной чувствительностью к другим аминогликозидам из-за опасности перекрестной аллергии.

С осторожностью следует применять препарат при паркинсонизме, миастении (кроме *M. gravis*, при которой применение противопоказано), ботулизме (аминогликозиды могут вызывать нарушение нервно-мышечной передачи, что приводит к дальнейшему ослаблению скелетной мускулатуры), дегидратации, новорожденным (особенно недоношенным), больным

пожилого возраста.

В период лечения необходимо не реже 1 раза в неделю контролировать функцию почек, слухового нерва и вестибулярного аппарата.

Вероятность развития нефротоксического воздействия выше у больных с нарушением функции почек, а также при применении препарата в высоких дозах или в течение длительного времени (этой категории пациентов нужен ежедневный контроль функции почек).

При неудовлетворительных аудиометрических тестах дозу препарата следует уменьшить или прекратить лечение.

Пациентам с инфекционно-воспалительными заболеваниями мочевыводящих путей рекомендуется употреблять много жидкости.

Основным токсическим эффектом препарата при парентеральном введении является его действие на

VIII пару черепно-мозговых нервов, что проявляется вначале глухотой в диапазоне звуков высокой частоты. У больных с нарушением функции почек риск развития ототоксических осложнений значительно выше. До начала лечения необходимо провести коррекцию водно-электролитного баланса у пациента. В период лечения амикацина сульфатом необходимо употреблять достаточное количество жидкости, часто определять концентрацию креатинина в плазме крови и при необходимости корректировать схему дозирования.

Пациентам пожилого возраста следует уменьшать дозу амикацина в связи со снижением функциональной активности почек и возможным снижением массы тела. Следует регулярно оценивать функциональную активность почек. Нужен анализ мочи до или во время лечения.

Применение амикацина может изменить следующие лабораторные показатели: сывороточная аланинаминотрансфераза, аспартатаминотрансфераза, билирубин, лактатдегидрогеназа, алкалинфосфат, мочевого азот, креатинин, ионы кальция, магния, калия, натрия.

У пациентов с нарушением функции почек суточная доза должна быть сниженной и/или интервал между дозами увеличен соответственно до концентрации креатинина в сыворотке крови для предотвращения накопления препарата в крови и сведения к минимуму риска ототоксичности. Если появляются признаки раздражения почек (например, альбуминурия, микрогематурия, лейкоцитурия), гидратация должна быть увеличена и снижена дозировка. Эти проявления обычно исчезают после завершения лечения. Если появляются признаки ототоксичности (например, головокружение, звон, шум в ушах или снижение слуха) или нефротоксичности (например, снижение клиренса креатинина, олигурия), применение амикацина следует прекратить или уменьшить дозу. Если возникают проявления азотемии или нарастает олигурия, лечение следует остановить.

Одновременное применение амикацина сульфата и диуретиков быстрого действия, например, производных этиакриновой кислоты, фуросемида, маннита (особенно если вводить внутривенно диуретик), может привести к развитию невозобновляемой глухоты.

Нельзя назначать одновременно два аминокликозиды или заменять один препарат другим, если первый аминокликозид астосовуovali в течение 7-10 дней. Повторный курс можно проводить не ранее чем через 4-6 недель.

При отсутствии положительной клинической динамики следует помнить о возможности

развития резистентных микроорганизмов. В подобных случаях необходимо отменить лечение и начать соответствующую терапию.

*Применение в период беременности или кормления грудью.*

В связи с тем, что амикацин проникает через плаценту и может оказывать нефротоксическое действие на плод, препарат противопоказан для применения в период беременности.

Во время применения препарата кормление грудью следует прекратить, поскольку амикацин в низких концентрациях проникает в грудное молоко и может влиять на микрофлору кишечника ребенка, находящегося на грудном вскармливании.

*Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.*

Препарат в целом не влияет на скорость реакции, но следует учитывать вероятность развития таких побочных эффектов со стороны центральной нервной системы и органов чувств, как сонливость, нарушение нервно-мышечной передачи, дискоординация движений, головокружение.

## **Способ применения и дозы**

Применять амикацин внутримышечно или внутривенно. Обычно доза детям в возрасте от 12 лет и взрослым – по 5 мг/кг массы тела каждые 8 часов или по 7,5 мг/кг массы тела каждые 12 часов. Максимальная доза для взрослых – 15 мг/кг массы тела в сутки. В тяжелых случаях и при инфекциях, вызванных *Pseudomonas*, суточную дозу следует распределять на 3 введения. Максимальная суточная доза – 1,5 г. Максимальная курсовая доза не должна превышать 15 г. Продолжительность лечения обычно составляет 3-7 дней при внутривенном введении и 7-10 дней – при внутримышечном.

Недоношенным новорожденным назначать в начальной дозе 10 мг/кг массы тела, а затем каждые 18-24 часов по 7,5 мг/кг массы тела в течение 7-10 дней. Доношенным новорожденным и детям в возрасте до 12 лет сначала назначать 10 мг/кг массы тела, затем 7,5 мг/кг массы тела каждые 12 часов в течение 7-10 дней.

При лечении больных с нарушенной функцией почек суточную дозу следует уменьшить и/или увеличить интервалы между введениями. Дозу уменьшать в зависимости от содержания креатинина в плазме крови и массы тела пациента. Интервал между введениями антибиотика рассчитать путем умножения значения уровня креатинина в плазме крови на 9; например, если уровень креатинина 2 мг, препарат назначать через каждые 18 часов.

Вводить амикацин путем внутривенной инфузии взрослым и детям нужно, используя объем жидкости, достаточный для капельного вливания, в течение

60-90 минут (со скоростью 50 капель в 1 мин), а новорожденным – в течение 1-2 часов.

Концентрация раствора амикацина при внутривенном введении не должна превышать 5 мг/мл. Внутривенную инъекцию амикацина нужно осуществлять очень медленно (в течение 2-7 мин). Раствор для парентерального введения готовить непосредственно перед введением и использовать сразу после приготовления.

Для внутривенного введения можно применять следующие растворители: 0,9 % раствор натрия хлорида, 5 % раствор глюкозы, лактатный раствор Рингера для инъекций, содержащий глюкозу (5 %).

*Дети.*

Амикацин применять с осторожностью для лечения недоношенных и доношенных младенцев, поскольку из-за недоразвития выделительной системы выведение аминогликозидов может удлиниться, вызывая явления токсичности.

## **Передозировка**

Возможно появление ото- и нефротоксического действия препарата и признаков нейромышечной блокады: шум в ушах, слуховые расстройства, кожные высыпания, головная боль, головокружение, лихорадка, парестезии, снижение функции почек (почечной недостаточности), угнетение или паралич дыхания, токсические реакции (атаксия, расстройства мочеиспускания, жажда, снижение аппетита, тошнота, рвота).

*Лечение:* для снятия блокады нервно-мышечной передачи и ее последствий – гемодиализ или перитонеальный диализ; антихолинэстеразные средства, соли кальция, искусственная вентиляция легких, другая симптоматическая и поддерживающая терапия. Снижать уровень амикацина следует непрерывной артериовенозной гемофильтрацией.

## **Побочные реакции**

*Со стороны пищеварительного тракта:* тошнота, рвота, диарея, нарушение функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия).

*Со стороны системы кроветворения:* анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* васкулит, артериальная гипотензия.

*Со стороны центральной и периферической нервных систем:* головная боль, сонливость, нейротоксическое действие (подрывание мышц, ощущение онемения, покалывания, эпилептические припадки), нарушение нервно-мышечной передачи (остановка дыхания).

*Со стороны органов чувств:* ототоксичность (снижение слуха, шум в ушах, вестибулярные лабиринтные нарушения, обратимая глухота), токсическое действие на вестибулярный аппарат (дискоординация движений, головокружение, тошнота, рвота).

*Со стороны мочевыделительной системы:* нефротоксичность – нарушение функции почек (олигурия, протеинурия, микрогематурия, альбуминурия, цилиндрурия, гиперазотемия, гематурия), почечная недостаточность.

*Со стороны иммунной системы:* аллергические реакции, включая кожные высыпания, зуд, лихорадку, гиперемию кожи, лихорадка, отек Квинке.

*Прочие:* реакции в месте введения инъекции, боль в месте введения, парестезии, тремор.

Натрия метабисульфит, что входит в состав препарата, может вызывать развитие тяжелых реакций гиперчувствительности и бронхоспазм.

## **Срок годности**

3 года.

## **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 30°C в оригинальной упаковке. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

## **Несовместимость**

Раствор амикацина сульфата не следует непосредственно смешивать с другими аминокликозидами, пенициллинами, гепарином, цефалоспоринами, капреомицином, амфотерицином В, тиопенталом, гидрохлоротиазидом, эритромицином, нитрофурантоином, витаминами группы В и С, калия хлоридом. При необходимости два препарата вводить отдельно, последовательно. В случае применения нескольких антибиотиков амикацин нельзя смешивать в одном шприце или флаконе с другими антибактериальными агентами.

## **Упаковка**

по 2 мл в ампулах №10 в картонной коробке.

## **Категория отпуска**

По рецепту.

## **Производитель**

Ексир Фармасьютикал Компани, Иран.

Exir Pharmaceutical Company, Iran.

## **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

2-ой км Ринг Роуд, Боруджерд 69189, Иран.

2nd Km Ring Road, Boroujerd 69189, Iran.

Внимание! Текст описания препарата "Лорикацин раствор для инъекций, 50 мг/мл по 2 мл в ампуле. №10" предоставлен для общей информации и ознакомления и является упрощённым вариантом официальной аннотации к лекарству. Перед приобретением и использованием препарата обязательно обратитесь к врачу и получите профессиональные рекомендации. Данный текст размещён на портале сугубо для ознакомительных целей и не может служить основанием для самолечения. Только врач может выносить решение о назначении того или иного лекарства, определять дозу и график приёма.