

БД РБ 7805 - 2015

к 2 от 26.02.15

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
АМПИЦИЛЛИН
(AMPICILLIN)

Общая характеристика:

международное и химическое названия: ampicillin;

натрия ((2S, 5R, 6R)-6-[[[(2R)-2-амино-2-фенилацетил]амино]-3,3-диметил-7-оксо-4-тиа-1-азабицикло[3.2.0]гептан-2-карбоксилат);

основные физико-химические свойства: порошок белого цвета, гигроскопичен;

состав: 1 флакон содержит ампициллина натриевой соли стерильной в пересчете на ампициллин 0,5 г или 1 г.

Форма выпуска. Порошок для приготовления раствора для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа. Бета-лактамы антибиотики, пенициллины. Пенициллины широкого спектра действия. Код АТС J01C A01.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Ампициллин обладает широким спектром антибактериального (бактерицидного) действия. Активен в отношении *грамположительных микроорганизмов* (Staphylococcus spp., за исключением штаммов, продуцирующих пенициллиназу; Streptococcus spp., в том числе S. Pneumoniae, S. agalactiae, S. pyogenes, Listeria monocytogenes; Corynebacterium diphtheriae, Bacillus anthracis, Clostridium spp., Enterococcus faecalis; Staphylococcus aureus) и *грамотрицательных* (Bacteroides spp., Fusobacterium spp., Peptostreptococci, Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Neisseria meningitidis, N. gonorrhoeae, Proteus mirabilis, некоторые штаммы Klebsiella pneumoniae, Haemophilus influenzae, H. Parainfluenzae; Moraxella catarrhalis) микроорганизмов. По своей природе резистентные микроорганизмы Acinetobacter spp., Citrobacter spp., Enterobacter spp., Klebsiella spp., Pseudomonas spp., Serratia spp., Chlamydia, Mycoplasma, Legionella).

Препарат разрушается пенициллиназой и поэтому не действует на пенициллиназообразующие штаммы бактерий. Препарат ингибирует полимеразу пептидогликана и транспептидазу, препятствует образованию пептидных связей и нарушает поздние этапы синтеза клеточной стенки делящихся микроорганизмов. Возникающие дефекты оболочки снижают осмотическую устойчивость бактериальной клетки, что приводит ее к гибели (лизису).

Фармакокинетика. При внутримышечном или внутривенном введении циркулирует в высоких концентрациях в крови. Максимальная концентрация в крови обнаруживается через 15 минут при внутривенном введении и через 0,5-1,0 час – после внутримышечного. При внутримышечном введении 0,5-1 г ампициллина с интервалом между введениями 4-6 часов в крови поддерживается терапевтическая концентрация.

Хорошо проникает в ткани и жидкости организма, обнаруживается в терапевтических концентрациях в плевральной, перитонеальной и синовиальной жидкости. В желчи может обнаруживаться в концентрациях в 4-100 раз выше, чем в крови. Относительно небольшая часть (10-30 %) связывается с белками плазмы. Сквозь гематоэнцефалический барьер не проникает. Почти не подвергается биотрансформации. Выделяется в основном почками, частично – с желчью, у женщин, кормящих грудью, экскретируется в молоко. В течение 12 часов с мочой экскретируется 45-70 % введенной дозы. При нарушении выделительной

функции почек повышается уровень препарата в крови и замедляется его выведение. При клиренсе креатинина менее 10 мл/мин уровень антибиотика в крови может быть в 10 раз выше, чем у больных с нормальной функцией почек. Период полувыведения увеличивается с 1-2 часов в норме до 10-12 часов. Ампициллин при повторных введениях не кумулирует, что дает возможность применять его в больших дозах и длительно.

Показания к применению.

Инфекции, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами: инфекции дыхательных путей (пневмония, бронхит); менингиты; гастроэнтериты, вызванные шигеллами или сальмонеллами, брюшной тиф и паратиф; бактериальный эндокардит; инфекции мочеполовой системы (пиелит, пиелонефрит, цистит, уретрит); септицемия; инфекции кожи и мягких тканей.

Способ применения и дозы.

Препарат принимают по назначению врача.

Перед применением следует сделать кожную пробу на переносимость. Ампициллин вводят внутримышечно или внутривенно (струйно или капельно). Продолжительность лечения Ампициллином устанавливается индивидуально, в зависимости от течения заболевания, возраста пациента, эффективности терапии и состояния функции почек. После исчезновения клинических признаков заболевания Ампициллин необходимо принимать еще 2-3 дня.

Рекомендуемая стартовая доза для взрослых, пожилых людей и детей старше 14 лет составляет 0,5 г каждые 4-6 часов. Режим дозирования устанавливает врач. При тяжелых инфекциях суточную дозу можно увеличить до 10 г и более. Новорожденным детям препарат назначают в дозе 50-100 мг/кг/сутки; детям старше 1 месяца – 100 мг/кг/сутки. При тяжелом течении инфекции суточные дозы могут быть удвоены. Суточную дозу вводят в 4-6 приемов с интервалом между приемами 4-6 часов.

Эндокардиты: 0,5 г 4-6 раз в день внутривенно или внутримышечно от одной до шести недель.

Перитониты: 0,5 г 4 раза в день внутривенно или внутримышечно.

Менингиты: *взрослые* – 2 г каждые 6 часов внутривенно, *дети* – 150 мг/кг в сутки внутривенно в несколько приемов.

Применение у детей (младше 10 лет)

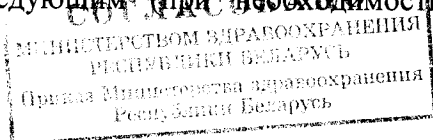
Рекомендуемая доза составляет половину дозы для взрослых.

Окончательный выбор дозы и длительность применения определяется врачом индивидуально в каждом конкретном случае. Для лечения тяжелых заболеваний вышеуказанные дозы могут быть увеличены.

Внутривенное введение. Раствор для внутривенного струйного введения готовят ex tempore, разовую дозу препарата (не более 2 г) растворяют в 5-10 мл стерильной воды для инъекций или 0,9 % раствора натрия хлорида и вводят медленно в течение 3-5 минут. При разовой дозе, превышающей 2 г, препарат вводят внутривенно капельно.

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

При капельном введении детям в качестве растворителя используют 5-10 % раствор глюкозы (30-50 мл в зависимости от возраста). Растворы вводят сразу после приготовления. Суточную дозу распределяют на 3-4 введения. Продолжительность лечения составляет 5-7 дней с последующим (при необходимости) переходом на внутримышечное введение.



Внутримышечное введение. Раствор для внутримышечного введения готовят ex tempore, добавляя к содержимому флакона 2 мл (0,5 г) или 4 мл (1,0 г) стерильной воды для инъекций.

Пациентам с тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) необходима коррекция режима дозирования: необходимо уменьшить дозу препарата или увеличить интервал между введениями.

Побочное действие.

Побочные реакции, которые могут наблюдаться при применении препарата, указаны ниже за классами систем и органов. Частота определена как: очень часто ($\geq 1/10$), очень часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко от ($< 1/1000$).

Реакции гиперчувствительности:

При возникновении реакции гиперчувствительности прием препарата необходимо прекратить.

Часто – кожная сыпь, зуд, крапивница. Вероятность возникновения данных реакций выше у пациентов с инфекционным мононуклеозом и острой или хронической лейкемией лимфоидного происхождения. Сообщалось также о возникновении пурпуры. Нечасто поступали сообщения о полиморфной эритеме, синдроме Стивенса-Джонсона и эпидермальном некролизе.

В редких случаях возникали анафилактические реакции.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто – возникновение интерстициального нефрита.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота, рвота, диарея. Редко сообщалось о возникновении псевдомембранозного и геморрагического колита.

Со стороны гепатобилиарной системы: о случаях возникновения гепатита, холестатической желтухи сообщалось нечасто. Возможно умеренное транзиторное повышение активности «печеночных» трансаминаз.

Лабораторные показатели: нечасто сообщалось о временной лейкопении, тромбоцитопении и гемолитической анемии, увеличении времени кровотечения и протромбинового времени.

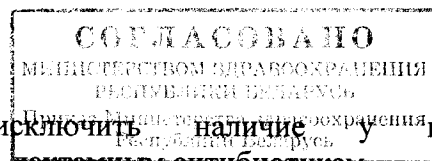
Противопоказания. Повышенная чувствительность к ампициллину и к другим β -лактамам антибиотикам (пенициллинам, цефалоспоринам, карбапенемам); тяжелые нарушения функции печени и почек; инфекционный мононуклеоз; лейкемия; ВИЧ-инфекции; заболевания желудочно-кишечного тракта/колит, связанный с применением антибиотиков; период кормления грудью.

Передозировка. При передозировке возможно токсическое воздействие на центральную нервную систему (головокружение, головная боль), диспептические явления (тошнота, рвота, жидкий стул), аллергические реакции в виде кожной сыпи. В случае возникновения симптомов передозировки препарат следует немедленно отменить и при необходимости провести симптоматическое лечение: промывание желудка, применение активированного угля, солевых слабительных, коррекция водно-электролитного баланса, гемодиализ. При аллергии показаны антигистаминные и десенсибилизирующие средства.

Меры предосторожности.

Перед началом терапии необходимо **исключить наличие** у пациента гиперчувствительности к ампициллину и другим β -лактамам антибиотикам.

В процессе лечения необходим систематический контроль функции почек, печени и картины периферической крови. При бронхиальной астме, сенной лихорадке и других



аллергических заболеваниях препарат применяют одновременно с десенсибилизирующими средствами.

При применении высоких доз у больных с почечной недостаточностью возможно токсическое действие на ЦНС.

Следует избегать приема лекарственного средства при наличии подозрений на инфекционный мононуклеоз и/или острую или хроническую лейкемию лимфоидного происхождения. При применении ампициллина при указанных состояниях были случаи возникновения кожной сыпи.

При длительном применении ампициллина возможно развитие суперинфекции за счет роста нечувствительной к лекарственному средству микрофлоры, что требует соответствующего изменения антибактериальной терапии.

У пациентов с почечной недостаточностью необходима коррекция дозы лекарственного средства.

При курсовом лечении необходимо проводить контроль состояния функции органов кровотока, печени и почек. При назначении больным с сепсисом возможно развитие реакции бактериолиза (реакция Яриша-Герксгеймера).

Пациенты с почечной недостаточностью

При наличии у пациента тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) следует рассмотреть необходимость уменьшения дозы или увеличения интервала времени между приемами препарата. После процедуры диализа необходимо назначение дополнительной дозы лекарственного средства.

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы не требуется, кроме случаев, связанных с почечной недостаточностью.

Применение в период беременности или кормления грудью. Тератогенный эффект Ампициллина не выявлен. Однако применение Ампициллина при беременности возможно только в том случае, когда ожидаемая польза для женщины превышает потенциальный риск для плода.

Ампициллин проникает в грудное молоко в низких концентрациях. Во время лечения препаратом следует прекратить кормление грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. Во время лечения препаратом у некоторых пациентов возможно возникновение побочных реакций со стороны центральной нервной системы (см. раздел «Побочные реакции»), поэтому необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Дети. Следует соблюдать осторожность при применении препарата детям, особенно если в анамнезе матери есть ссылка на повышенную чувствительность к β -лактамам антибиотикам.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. Ампициллин увеличивает эффект антикоагулянтов, антибиотиков аминогликозидного ряда, снижает эффект пероральных контрацептивов. При одновременном применении Ампициллина с пероральными эстрогенсодержащими препаратами отмечается снижение их эффективности за счет ослабления печеночной циркуляции эстрогенов.

Пробенецид снижает канальцевую секрецию Ампициллина, в результате чего возрастает риск развития его токсического действия.

Вероятность появления кожной сыпи повышает аллопуринол.

Высокие дозы Ампициллина снижают уровень атенолола в плазме крови, поэтому рекомендуется применять эти препараты отдельно, сначала принимать атенолол, а после него - Ампициллин.

СОГЛАСОВАНО

Министерства здравоохранения

Республики Беларусь

Ампициллин снижает клиренс и увеличивает токсичность метотрексата, усиливает всасывание дигоксина.

При взаимодействии ампициллина с макролидами, паромомицином, тетрациклинами, хлорамфениколом снижается эффект обоих препаратов. Ампициллин может снижать эффект натрия бензоата.

При одновременном применении с блокаторами β -адренорецепторов возрастает вероятность возникновения анафилактических реакций.

Несовместимость. Ампициллин недопустимо смешивать в одной емкости с другими медикаментозными средствами. Препарат фармацевтически несовместим с тетрациклином, хлорамфениколом (левомицетином), амфотерицином, клиндамицином, эритромицином, линкомицином, метронидазолом, полимиксином В, ацетилцистеином, хлорпромазином, гидралазином, допамином, гепарином, метоклопрамидом.

Условия и срок хранения. 2 года.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном месте.

Условия отпуска. По рецепту.

Упаковка. По 0,5 г и 1,0 г в флаконах, герметически укупоренные пробками резиновыми и обжатые колпачками алюминиевыми. По 40 флаконов вместе с 5-10 инструкциями для медицинского применения помещают в коробку. Для стационара.

Производитель. ПАО «Киевмедпрепарат».

Местонахождение. Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

