

**Дәрілік заттың медицинада
қолданылуы жөніндегі
нұсқаулық
Амикацин**

Саудалық атауы

Амикацин

Халықаралық патенттелмеген атауы

Амикацин

Дәрілік түрі

Көктамыр ішіне және бұлшықет ішіне енгізу үшін ерітінді дайындауға арналған ұнтақ, 500 мг

Құрамы

Бір құтының ішінде

белсенді зат: амикацинге шаққанда амикацин сульфаты - 500 мг

Сипаттамасы

Ақ немесе сарғыш реңді ақ түсті ұнтақ. Гигроскопиялы.

Фармакотерапиялық тобы

Бактерияларға қарсы жүйелік қолдануға арналған препараттар. Бактерияларға қарсы аминогликозидтік препараттар. Амикацин.

АТХ коды J01GB06

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Бұлшықет ішіне (б/і) енгізгеннен кейін тез және толық сіңеді. Б/і 7,5 мг/кг дозада енгізгенде ең жоғары концентрациясы (C_{max}) - 21 мг/мл. Ең жоғары концентрацияға жету уақыты (TC_{max}) - б/і енгізгеннен кейін 1,5 сағатқа жуық. Плазма ауыздарымен байланысуы - 4-11%.

Жасушадан тыс сұйықтықтарға (абсцесс ішіндегісіне, плевральді жалқы, асциттік, перикардальді, синовиальді, лимфатикалық және перитонеальді сұйықтық); несепте жоғары концентрацияларда байқалады; төмен концентрациялары - өтте, емшек сүтінде, көздің сулы ылғалында, бронх секретінде, қақырықта және жұлын-ми сұйықтығында (ЖМС). Организмнің барлық тіңдеріне өтуі жақсы, онда жасушаішілі жиналады; жоғары концентрациялары қанмен жақсы жабдықталған мына ағзаларда байқалады: өкпе, бауыр, миокард, көкбауыр, және өсіресе бүйректерде, онда қыртысты қабатта жиналады, өте төмен концентрациялар - бұлшықетте, май тіңдерінде және сүйектерде.

Ересектерге орташа емдік дозаларда (қалыптағыдай) тағайындағанда амикацин гематознефалдық бөгет (ГЭБ) арқылы өтпейді, ми қабықтары қабынғанда өткізгіштігі біршама артады. Жаңа туған нәрестелерде, ересектерге қарағанда, ЖМС-те өте жоғары концентрацияларға жетеді; плацента арқылы өтеді - ұрықтың қанынан және амниотикалық сұйықтықтан табылады. Ересектерде таралу көлемі - 0,26 л/кг; балаларда - 0,2-0,4 л/кг; жасы 1 апталыққа толмаған және дене салмағы 1,5 кг-нан төмен жаңа туған нәрестелерде - дене салмағының әр кг-на шаққанда 0,68 л, жасы 1 апталыққа толмаған және дене салмағы 1,5 кг-нан асатын жаңа туған нәрестелерде - дене салмағының әр кг-на шаққанда 0,58 л-ге дейін, мукровисцидозы бар науқастарда - 0,3-0,39 л/кг. Көктамыр ішіне немесе бұлшықет ішіне енгізгенде орташа емдік концентрация 10-12 сағат бойы сақталады.

Метаболизденбейді. Ересектерде жартылай шығарылу кезеңі ($T_{1/2}$) - 2-4 сағат, жаңа туған нәрестелерде - 5-8 сағат, жасы үлкендеу балаларда - 2,5-4 сағат. Ақырғы $T_{1/2}$ шамасы - 10 сағаттан асады (жасушаішілік қордан босап шығуы).

Шұмартық сүзілу жолымен бүйректер арқылы (65-94 %) көбіне өзгермеген күйінде шығарылады. Бүйректік клиренсі - минутына 79-100 мл.

Ересектерде бүйрек қызметі бұзылғанда $T_{1/2}$ бұзылу дәрежесіне байланысты 100 сағатқа дейін өзгеріп отырады, мукровисцидозы бар науқастарда - 1-2 сағат, күйігі және гипертермиясы бар науқастарда, клиренсінің жоғарылауы салдарынан болатын орташа көрсеткіштермен салыстырғанда, $T_{1/2}$ қысқалау болуы мүмкін.

Гемодиализбен (4-6 сағат ішінде 50%) шығарылады, перитонеальді диализдің тиімділігі аз (48-72 сағат ішінде 25%).

Фармакодинамикасы

Әсер ету ауқымы кең жартылай синтетикалық антибиотик, бактерицидтік белсенділігі бар. Рибосоманың 30S суббірлігімен байланысып, тасымалдаушы және матрицалық РНҚ кешенінің түзілуіне кедергі жасайды, ауқыз синтезін бөгейді, сондай-ақ бактериялардың цитоплазмалық мембранасын бұзады.

Аэробтық грамтеріс микроорганизмдерге - *Pseudomonas aeruginosa*, *Escherichia coli*, *Klebsiella spp.*, *Serratia spp.*, *Providencia spp.*, *Enterobacter spp.*, *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*; кейбір грамоң микроорганизмдерге - *Staphylococcus spp.* қатысты белсенділігі жоғары (оның ішінде пенициллинге, кейбір цефалоспориңдерге тәзімді); *Streptococcus spp.* қатысты белсенділігі орташа.

Бензилпенициллинмен бір мезгілде тағайындағанда *Enterococcus faecalis* штаммдарына қатысты синергидтік әсер береді.

Анаэробтық микроорганизмдерге әсер етпейді.

Басқа аминогликозидтердің белсенділігін жоғатын ферменттердің әсер етуімен амикацин белсенділігі жойылмайды, және тобрамицинге, гентамицинге және нетилимицинге тәзімді *Pseudomonas aeruginosa* штаммдарына қатысты белсенді күйінде қалады.

Қолданылуы

Амикацинге сезімтал микроорганизмдер әсерінен туындаған мына жұқпалы-қабыну ауруларында (грамтеріс - гентамицинге, сизомицинге және канамицинге тәзімді; грамоң және грамтеріс микроорганизмдердің астасуымен):

- тыныс жолдарының (бронхит, пневмония, плевра эмпиемасы, өкпе абсцесі)
- сепсис
- септикалық эндокардит
- орталық жүйке жүйесінің (менингитті қоса есептегенде)
- құрсақ қуысының (соның ішінде перитонит)
- несепжыныс жолдарының (пиелонефрит, цистит, уретрит, простатит, соз)
- тері мен жұмсақ тіңдердің іріңді жұқпалары (соның ішінде жұқпа жұққан күйіктер, жұқпаланған ойық жаралар және генезі әртүрлі ойылулар)
- өт шығару жолдарының
- сүйектер мен буындардың (соның ішінде остеомиелит)
- жара жұқпасы
- операциядан кейінгі жұқпалар

Қолдану тәсілі және дозалары

Көктамыр ішіне (к/і) (2 минут ішінде сорғалатып немесе тамшылатып), бұлшықет ішіне (б/і). Ересектерге және 6 жастан асқан балаларға әрбір 8 сағат сайын дене салмағының әр кг-на шаққанда 5 мг немесе әрбір 12 сағат сайын дене салмағының әр кг-на шаққанда 7,5 мг-нан; несеп шығару жолдарының бактериялық жұқпаларында (асқынбаған) - әрбір 12 сағат сайын 250 мг; гемодиализ сеансынан кейін қосымша доза 3-5 мг/кг тағайындалуы мүмкін.

Ересектер үшін ең жоғары доза тәулігіне дене салмағының әр кг-на шаққанда 15 мг-ға дейін, бірақ 10 күн бойы тәулігіне 1,5 г-нан асырмайды.

К/і енгізгенде емдеу ұзақтығы - 3-7 күн, б/і енгізгенде - 7-10 күн.

1 айлықтан 6 жасқа дейінгі балаларға бастапқы доза 10 мг/кг, содан кейін 7-10 күн бойы әрбір 12 сағат сайын дене салмағының әр кг-на шаққанда 7,5 мг-нан.

Күйген науқастарға әрбір 4-6 сағат сайын 5-7,5 мг/кг доза қажет болуы мүмкін, өйткені бұл науқастарда $T_{1/2}$ өте қысқа (1-1,5 сағат).

Бүйрек жеткіліксіздігінде қолданылуы

Бүйректің бөліп шығару функциясы бұзылғанда дозаны төмендету немесе енгізу арасындағы аралықтарды арттыру қажет.

Енгізу арасындағы аралықтарды арттыруды (креатинин клиренсі белгісіз, ал емделушінің жағдайы тұрақты) былайша анықтайды:

Аралық (сағ.) = қан сарысуындағы креатинин концентрациясы x 9.

Егер сарысудағы креатинин концентрациясы 2 мг/100 мл болса, онда ұсынылатын бір реттік дозаны (7,5 мг/кг) әрбір 18 сағат сайын енгізу қажет.

Аралықты арттырған кезде бір реттік дозаны өзгертпейді.

Енгізу арасындағы аралықты өзгертпегенде бір реттік дозаны төмендету:

Бүйрек қызметінің жеткіліксіздігі бар науқастарда алғашқы доза 7,5 мг/кг құрайды.

Кейінгі дозаларды есептеу (әрбір 12 сағат сайын енгізіледі):

*науқаста байқалған
креатинин клиренсі,
(мл/мин)*

кейінгі доза (мг) = _____ x бастапқы доза (мг).

қалыпты креатинин клиренсі (мл/мин)

Б/І енгізу үшін ех tempore дайындалған ерітіндіні пайдаланып, құтының ішіндегі затқа инъекцияға арналған 2-3 мл су қосады.

К/І енгізу үшін алдын ала 200 мл 5% декстроза ерітіндісінде немесе 0,9% натрий хлориді ерітіндісінде сұйылтылған б/І арналған ерітінді қолданылады. К/І енгізуге арналған ерітіндідегі амикациннің концентрациясы 5 мг/мл-ден аспауы тиіс.

Жағымсыз әсерлері

Жиі

- ісінушілік, б/І инъекция орнының ауыруы, дерматит
- аллергиялық реакциялар: тері бөртпесі, қышыну, тері гиперемиясы

Сирек

- жүректің айнуы, құсу, бауыр функциясының бұзылуы (бауыр трансаминазалары белсенділігінің жоғарылауы, гипербилирубинемия)
- анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения
- бас ауыру, ұйқышылдық, нейрориттік әсер (бұлшықеттердің тартылуы, ұю сезімі, шаншулар, эпилепсия ұстамалары), жүйке-бұлшықет берілімінің бұзылуы (тыныстың тоқтап қалуы)

Өте сирек

- отоуыттылық (естудің нашарлауы, вестибулярлы және лабиринттік бұзылулар, қайтымсыз көреңдік), вестибулярлы аппаратқа ұятты әсер (қимыл үйлесімінің бұзылуы, бас айналу)

- нефроуыттылық - бүйрек функциясының бұзылуы (олигурия, протеинурия, микрогематурия)

- қызба

- Квинке ісінуі

- эпилепсия ұстамалары

- жүйке-бұлшықет берілімінің бұзылуы (тыныстың тоқтап қалуы)

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- асқын сезімталдық (соның ішінде сыртартқыда басқа аминогликозидтерге)

- есту жүйкесінің невриті

- азотемиямен және уремиямен ауыр созылмалы бүйрек жеткіліксіздігі

- жүктілік және лактация кезеңі

- жаңа туу кезеңі (1 айлық өміріне дейін)

- балалардың шала тууы

Сақтықпен

- миастения

- паркинсонизм

- ботулизм (аминогликозидтер жүйке-бұлшықет берілімін бұзылуын туындатуы мүмкін, бұл қаңқа бұлшықетінің әрі қарай әлсізденуіне әкел соғады)

- дегидратация

- бүйрек қызметінің жеңіл және орташа дәрежелі жеткіліксіздігі

- өгде жас

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Пенициллиндермен, гепаринмен, цефалоспориндермен, капреомицинмен, амфотерицин В, гидрохлоро-тизидпен, эритромицинмен, нитрофурантоинмен, В және С тобының витаминдерімен, калий хлориді-мен фармацевтикалық тұрғыдан үйлеспейді (еккіште, тамызғышта араластырмау керек).

Карбенциллимен, бензилпенициллинмен, цефалоспориндермен синергизм білдіреді (бүйрек қызметінің созылмалы жеткіліксіздігі бар науқастарда бета-лактамдық антибиотиктер аминогликозидтердің әсерін төмендетуі мүмкін).

Налидикс қышқылы, полимиксин В, цисплатин және ванкомицин ото- және нефроуыттылықтың пайда болу қаупін арттырады.

Диуретиктер (әсіресе фуросемид), цефалоспориндер, пенициллиндер, сульфаниламидтер және қабы-нуға қарсы стероидтық емес препараттар (индометацин), нефрон өзекшелерінде белсенді секреция үшін бөсекелесіп, аминогликозидтердің элиминациясын бөгейді, қан сарысуында олардың концентрациясын арттырып, нефро-және нейрориттік күшейтеді.

Деполаризацияланбайтын миелорелаксанттар: атракуриум, панкурониум, тубокурарин, галаммин-три-этиоид амикацинмен біріккенде тыныстың тоқтап қалуына әкел соғуы мүмкін.

Амикацин курагеге ұқсас дәрілік заттардың бұлшықетті босаңсытатын әсерін күшейтеді.

Метоксифлуран, парентеральді енгізуге арналған полимиксиндер; капреомицин және жүйке-бұлшықет берілімін бөгейтін басқа да дәрілік заттар (ингляциялық анестезияға арналған дәрілік заттар ретінде галогенделген көмірсулар, есірткілік анальгетиктер), цитраттық консерванттары бар қанның көп мөлше-рін құю тыныстың тоқтап қалу қаупін арттырады.

Индометацинді парентеральді түрде енгізу аминогликозидтердің уыттық әсерінің пайда болу қаупін арттырады (жартылай шығарылу кезеңінің артуы және клиренсінің төмендеуі).

Миастенияға қарсы дәрілік заттардың әсерін төмендетеді.

Айрықша нұсқаулар

Бактериологиялық зертханаларда құрамында 30 мкг амикацин бар дискілерді пайдалана отырып, бөлініп шыққан қоздырғыштардың сезімталдығын анықтайды. Өсу аймағынан бос 17 мм және одан астам диа-метрде микроорганизм сезімтал, 15 мм-ден 16 мм-ге дейін орташа сезімтал, 14 мм-ден төмен болғанда тұрақты деп есептеледі.

Амикациннің плазмадағы концентрациясы 25 мкг/мл аспауы тиіс (15-25 мкг/мл концентрация емдік деп саналады).

Емдеу кезеңінде аптасына кем дегенде бір рет бүйрек функциясын, есту жүйкесін және вестибулярлы аппаратты тексеріп отыру қажет.

Бүйрек функциясы бұзылған науқастарда, сондай-ақ жоғары дозаларда немесе ұзақ уақыт бойы тағайын-дағанда нефроуыттылықтың пайда болу ықтималдылығы жоғары (науқастардың осы тобында бүйрек қызметі күн сайын бақылап отыруды қажет етеді).

Аудиометриялық тесттер қанағаттанарлықтай болмаса, препарат дозасын төмендетеді немесе емдеуді тоқтатады.

Несеп шығару жолдарының жұқпалы-қабыну аурулары бар емделушілер диурез талапқа сай болғанда сұйықтықтың мол мөлшерін қабылдауы керек.

Клиникалық оң динамика жоқ болғанда тәзімді микроорганизмдердің пайда болуы мүмкін екендігін ұмытпа-ған жөн. Осындай жағдайларда емдеуді тоқтату және тиісті ем жүргізу қажет.

Ампулалардағы натрий бисульфитті науқастарда, әсіресе аллергиялық сыртартқысы бар науқастарда, жа-ғымсыз асқынуларға (анафилактикалық реакцияларға дейін) себеп болуы мүмкін.

Жүктілік және лактация кезеңі

Жүктілік кезеңінде қолдануға болмайды. Препаратты лактация кезеңінде қолдану қажет болғанда емдеу кезеңінде емшек емізуді тоқтатқан жөн.

Дәрілік заттың көлік құралдарын немесе аса қауіпті механизмдерді басқару қабілетіне ықпал ету ерекшеліктері

Препаратты қолдану кезеңінде автотөкіл жүргізгенде және зейінді жұмылдыруды және психомоторлы реакциялардың шапшаңдығын қажет ететін қызмет түрлерімен айналысқанда сақ болу қажет.

Артық дозалануы

Симптомдары: уыты реакциялар (естімей қалу, атаксия, бас айналу, несептің шығарудың бұзылуы, шөлдеу, төбеттің төмендеуі, жүректің айнуы, құсу, құлақтың шыңылдауы немесе бітелуі, тыныс алудың нашарлауы).

Емі: жүйке-бұлшықет берілімі блокадасын және оның зардабын жою үшін - гемодиализ немесе пери-тоналды диализ; антихолинэстеразальді дәрілік заттар, жасанды жасанды желдету (ӨЖЖ), басқа да симптоматикалық және көмеуші ем.

Шығарылу түрі және қаптамасы

Көктамыр үшін және бұлшықет ішіне енгізу үшін ерітінді дайындауға арналған 500 мг ұнтақ.

Резеңке тығынмен тығындалған, алюминий немесе біріктірілген қалпақшамен қаусырылған, сыйымды-лығы 10 мл шыны құтыларда 500 мг белсенді зат бар.

1-50 құты медицинада қолданылуы жөнінде мемлекеттік және орыс тілдеріндегі 1-5 нұсқаулықпен бірге картон қорапқа салынған.

Сақтау шарттары

Жарықтан қорғалған жерде, 25°C-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Сақтау мерзімі

2 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды!

Препараттың жарамдылық мерзімі өткеннен кейін, пайдаланылмаған құтыны абайлап ашып, ішінде-гісін судың мол мөлшерімен ерітіп, құбырға төгіп тастау керек.

Деріханадан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші

«Красфарма» ААҚ, Ресей.

660042, Красноярск қ-сы, 60 лет Октября к-сі, үй 2.

Тел./ факс (391) 261-25-90 / 261-17-44.

Тіркеу куәлігінің иесі

«Красфарма» ААҚ, Ресей.

Тұтынушылардан препараттың сапасы жөнінде шағымдарды Қазақстан Республикасы аумағында қабылдайтын ұйымның мекенжайы:

«Медлайн Фармацевтика» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050054, Алматы қ-сы, Сүйінбай к-сі, 162 А.

Тел. (727) 225-00-36, 225-00-37.