

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Ампициллин

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Ампициллин.

Международное непатентованное название: ампициллин.

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения.

Состав.

активное вещество: ампициллин натрия в пересчете на ампициллин 500 мг.

Описание: порошок белого или почти белого цвета; гигроскопичен.

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик-пенициллин полусинтетический.

Код АТХ: [J01CA01].

Фармакологическое действие

Фармакодинамика. Ампициллин – бактерицидный антибиотик широкого спектра действия. Бактерицидное действие ампициллина обусловлено необратимым связыванием с бактериальными транспептидазами, участвующими в биосинтезе пептидогликанов - основного компонента клеточной стенки бактерий.

Активен в отношении грамположительных аэробных бактерий: Staphylococcus spp. (кроме штаммов, продуцирующих пенициллиназы), Enterococcus spp., в т.ч. Enterococcus faecalis, Streptococcus pneumoniae (кроме штаммов, продуцирующих пенициллиназы), Streptococcus pyogenes, Streptococcus spp. группы viridans, Listeria monocytogenes, Bacillus anthracis, Corynebacterium diphtheriae, Erysipelothrix rhusiopathiae; *грамотрицательных аэробных бактерий:* Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Bordetella pertussis, некоторых штаммов Haemophilus influenzae, Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Helicobacter pylori; *некоторых анаэробов:* Clostridium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Prevotella melaninogenica.

Ампициллин разрушается пенициллиназами, вырабатываемыми микроорганизмами.

Неактивен в отношении пенициллиназопродуцирующих штаммов: Staphylococcus spp., Streptococcus pneumoniae, всех штаммов Pseudomonas aeruginosa, Clostridium difficile, большинства штаммов Klebsiella spp. и Enterobacter spp., большинства штаммов

Bacteroides spp., в т.ч. Bacteroides fragilis.

Фармакокинетика. Максимальные концентрации (С_{max}) ампициллина после внутривенного (в/в) введения 1 г и 2 г препарата составляют от 40 мкг/мл до 71 мкг/мл и от 109 мкг/мл до 150 мкг/мл соответственно. После внутримышечной (в/м) инъекции 1 г ампициллина С_{max} варьирует от 8 мкг/мл до 37 мкг/мл. Связь с белками плазмы составляет 28 %.

Ампициллин хорошо проникает и равномерно распределяется в органах и тканях организма, обнаруживается в терапевтических концентрациях в плевральной, перитонеальной, амниотической и синовиальной жидкостях, ликворе, коже и подкожной клетчатке, моче (высокие концентрации), слизистой оболочке кишечника, костях, желчном пузыре, легких, тканях женских половых органов, желчи, в бронхиальном секрете, придаточных пазухах носа, жидкости среднего уха (при его воспалении), слюне. Практически не проникает через неповрежденный гематоэнцефалический барьер, проницаемость через который возрастает при воспалении мозговых оболочек.

Период полувыведения (Т_{1/2}) – около 1 ч. Ампициллин экскретируется преимущественно почками в неизменном виде, частично через кишечник. От 75% до 85% выделяется почками в течение первых 8 ч, при этом в моче создаются очень высокие концентрации неизменного антибиотика. При повторных введениях не кумулирует. Удаляется при гемодиализе.

Показания к применению. Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к ампициллину микроорганизмами:

- *ЛОР-органов*: синусит, тонзиллит, фарингит, средний отит;
- *дыхательных путей*: острый и обострение хронического бронхита, пневмония, абсцесс легкого;
- *желчевыводящих путей*: холангит, холецистит;
- *почек и мочевыводящих путей*: пиелонефрит, пиелит, цистит, уретрит;
- *органов малого таза у женщин*: цервицит, сальпингит, эндометрит, пельвоперитонит, tuboовариальный абсцесс;
- *кожи и мягких тканей*: рожа, импетиго, инфицированные дерматозы;
- *костей и суставов*: ревматизм;
- *желудочно-кишечного тракта*: брюшной тиф и паратиф, шигеллез, сальмонеллез;
- *интраабдоминальные инфекции*: перитонит;
- инфекционный эндокардит (профилактика и лечение);
- бактериальный менингит;
- сепсис;

- пастереллез;
- листериоз;
- гонорея.

Противопоказания. Повышенная чувствительность к ампициллину, (в т.ч. к другим пенициллинам, цефалоспорином, карбапенемам), инфекционный мононуклеоз, лимфолейкоз, печеночная недостаточность, заболевания толстой кишки в анамнезе (особенно колит, связанный с применением антибиотиков).

С осторожностью. Бронхиальная астма, поллиноз и другие аллергические заболевания, тяжелые нарушения функции почек, детский возраст до 1 мес, кровотечения в анамнезе.

Применение при беременности и в период лактации. Применение при беременности возможно, если ожидаемая польза от лечения для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости применения препарата в период лактации на время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы. Внутривенно (в/в) (струйно, капельно), внутримышечно (в/м). Дозы и режим дозирования выбирают индивидуально в зависимости от тяжести течения, локализации инфекции и чувствительности возбудителя. При инфекциях средне-тяжелого течения взрослым внутримышечно – 250-500 мг каждые 6-8 ч. При тяжелом течении инфекции 1-2 г 3-4 раза в сутки или внутривенно по 500 мг каждые 6 ч.

Листериоз – по 50 мг/кг каждые 6 ч внутримышечно или внутривенно.

При менингите – 14 г/сутки; кратность введения – 6-8 раз.

Взрослым при гонококковом уретрите – внутримышечно 0,5 г 2 раза в течение одного дня; при гонорейном неосложненном уретрите – однократно 0,5 г.

Для профилактики бактериального эндокардита у больных из группы высокого риска, подвергающихся стоматологическим, эндоскопическим вмешательствам, «малым» операциям на ЛОР-органах, а также операциям на органах желудочно-кишечного тракта или желчевыводящих путях – 2 г в/в или в/м за 30 мин до процедуры или операции; при необходимости, через 6 ч вводят повторно в дозе 1 г.

Детям при тяжелых и средне-тяжелых инфекциях – внутримышечно 25-50 мг/кг 4 раза в сутки; при менингите суточная доза составляет 100-200 мг/кг за 6-8 введений.

Детям старше 4 лет назначают по 1-2 г/сутки; до 1 года – из расчета 100 мг/кг; 1-4 лет – 100-150 мг/кг. Суточную дозу делят на 4-6 приемов.

Новорожденным с массой тела до 2 кг – по 25-50 мг/кг каждые 12 ч в первую неделю жизни, затем 50 мг/кг каждые 8 ч; новорожденным с массой тела 2 кг и выше – 50 мг/кг каждые 8 ч в первую неделю жизни, затем 50 мг/кг каждые 6 ч.

Детям для профилактики бактериального эндокардита – 50 мг/кг за 30 мин до начала про-

цедуры; при необходимости, через 6 ч вводят повторно в дозе 25 мг/кг.

Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания (7-14 дней и более).

Приготовление растворов и введение. Растворы готовят *ex tempore*.

Для в/м введения – к содержимому флакона (500 мг) добавляют 2 мл воды для инъекций.

Для в/в струйного введения – к содержимому флакона (500 мг) добавляют 5 мл воды для инъекций, вводят в/в медленно в течение 3-5 мин.

При разовой дозе, превышающей 2 г, препарат вводят в/в капельно. Для этого к содержимому флакона (500 мг) добавляют 5 мл воды для инъекции, полученный раствор добавляют к 125-250 мл 0,9% раствора натрия хлорида или 5% раствора декстрозы, вводят со скоростью 60-80 капель в мин.

Растворы используют сразу после приготовления, недопустимо добавление к ним других медикаментов.

Побочное действие. *Аллергические реакции:* зуд и шелушение кожи, крапивница, ринит, конъюнктивит, ангионевротический отек, лихорадка, артралгия, эозинофилия, эритематозная и макулопапулезная сыпь, эксфолиативный дерматит, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), реакции, сходные с сывороточной болезнью, анафилактический шок.

Со стороны пищеварительной системы: дисбактериоз, гастрит, сухость во рту, изменение вкуса, боль в животе, рвота, тошнота, диарея, стоматит, глоссит, повышение активности «печеночных» трансаминаз, псевдомембранозный колит.

Со стороны центральной нервной системы (ЦНС): головная боль, тремор, судороги (при терапии высокими дозами), агитация, агрессивность, тревожность, спутанность сознания, изменение поведения, депрессия.

Со стороны системы крови: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, анемия.

Местные реакции: боль и инфильтраты в местах в/м введения, флебиты при в/в введении в больших дозах.

Прочие: интерстициальный нефрит, нефропатия, суперинфекция, кандидоз влагалища; неаллергическая «ампициллиновая» сыпь, может исчезнуть без отмены препарата.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка. *Симптомы:* проявления токсического действия на ЦНС (особенно у больных с почечной недостаточностью); тошнота, рвота, диарея, нарушение водно-электролитного баланса (как следствие рвоты и диареи).

Лечение: поддержание водно-электролитного баланса, симптоматическая терапия. В тяжелых случаях: гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами. В растворе фармацевтически несовместим с аминогликозидами. При одновременном применении не следует смешивать их в одном шприце или одной инфузионной среде; при в/м введении вводить в разные участки тела; при в/в введении вводить отдельно, соблюдая определенную последовательность, с как можно большим временным интервалом между инъекциями (инфузиями), либо использовать отдельные внутривенные катетеры.

Другие бактерицидные антибиотики (в т.ч. аминогликозиды, ванкомицин, рифампицин) при совместном применении оказывают синергидное действие.

Бактериостатические лекарственные средства (макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины, сульфаниламиды) – оказывают антагонистическое действие.

Уменьшает эффективность лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется пара-аминобензойная кислота, этинилэстрадиола (в последнем случае повышается риск развития кровотечений «прорыва», поэтому во время терапии ампициллином рекомендуется использовать дополнительные методы контрацепции).

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, диуретики, аллопуринол, оксифенбутазон, фенилбутазон, нестероидные противовоспалительные препараты повышают концентрацию ампициллина в плазме за счет снижения его канальцевой секреции.

Повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (подавляя кишечную микрофлору, снижает синтез витамина К и протромбиновый индекс).

Аллопуринол повышает риск развития «ампициллиновой» кожной сыпи. Уменьшает клиренс и повышает токсичность метотрексата.

Если Вы принимаете другие препараты, проконсультируйтесь с врачом.

Особые указания. При курсовом лечении необходимо проводить контроль состояния функции органов кроветворения, печени и почек. При применении препарата в высоких дозах у пациентов с почечной недостаточностью возможно токсическое действие на центральную нервную систему. Возможно развитие суперинфекции за счет роста нечувствительной к ампициллину микрофлоры, что требует соответствующего изменения антибактериальной терапии. При назначении больным с сепсисом возможно развитие реакции бактериолиза (реакция Яриша-Герксгеймера). У пациентов, имеющих повышенную чувствительность к пенициллинам, возможны перекрестные аллергические реакции с другими бета-лактамами антибиотиками.

При возникновении диареи во время лечения ампициллином, следует проявлять осторожность ввиду возможного развития псевдомембранозного колита, вызванного

С. 6

clostridium difficile. Если диагноз антибиотик-ассоциированной диареи или псевдомембранозного колита, вызванного clostridium difficile, установлен, следует немедленно прекратить введение ампициллина и назначить соответствующее лечение.

По истечении срока годности препарата неиспользованные флаконы осторожно вскрыть, содержимое растворить в большом количестве воды и слить в канализацию.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами.

Следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска. Порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения 500 мг активного вещества во флаконах вместимостью 10 мл.

1 флакон с инструкцией по применению в пачке из картона.

10 флаконов с инструкцией по применению в коробке из картона.

Для стационаров:

- 50 флаконов с равным количеством инструкций по применению в коробке из картона;
- 1 флакон с инструкцией по применению (от 1 до 50 флаконов с равным количеством инструкций по применению) в коробке из картона.

Срок годности: 2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения. В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска: отпускают по рецепту.

Претензии от потребителей принимает предприятие-производитель

ОАО «Красфарма», Россия, 660042, г. Красноярск, ул. 60 лет Октября, д. 2.

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

Генеральный директор
ОАО «Красфарма»



Новикова Н.В.