

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Ампициллин**Регистрационный номер:****Торговое наименование препарата:** Ампициллин**Международное непатентованное или группировочное наименование:** ампициллин**Лекарственная форма:** порошок для приготовления раствора для внутримышечного введения.**Состав на 1 флакон***Действующее вещество:* ампициллин натрия (в пересчете на ампициллин) – 250 мг, 500 мг, 1000 мг.**Описание.** Порошок белого или почти белого цвета. Гигроскопичен.**Фармакотерапевтическая группа:** антибактериальные средства системного действия; бета-лактамы антибактериальные средства, пенициллины; пенициллины широкого спектра действия.**Код АТХ:** J01CA01.**Фармакологические свойства****Фармакодинамика**

Антибактериальное бактерицидное средство из группы полусинтетических пенициллинов, получаемое путем ацелирования 6-аминопенициллановой кислоты остатком аминофенилуксусной кислоты, кислотоустойчив. Ингибирует полимеразу пептидогликана и транспептидазу, препятствует образованию пептидных связей и нарушает поздние этапы синтеза клеточной стенки делящегося микроорганизма, что приводит к снижению осмотической устойчивости бактериальной клетки и вызывает ее лизис (гибель).

Активен в отношении грамположительных (альфа- и бета-гемолитические стрептококки, *Streptococcus pneumoniae*, *Staphylococcus spp.*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium spp.*, умеренно активен против большинства энтерококков, в том числе *Enterococcus faecalis*) и грамотрицательных (*Haemophilus influenzae*, *Neisseria meningitidis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Proteus mirabilis*, *Yersinia multocida [Pasteurella]*, многие виды *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*, *Escherichia coli*) микроорганизмов, аэробных неспорообразующих бактерий (*Listeria spp.*).

Неэффективен в отношении пенициллиназопродуцирующих штаммов *Staphylococcus spp.*, всех штаммов *Pseudomonas aeruginosa*, большинства штаммов *Klebsiella spp.* и *Enterobacter spp.*

Фармакокинетика

Абсорбция

При парентеральном введении (внутривенно, внутримышечно) концентрация ампициллина в крови превышает создаваемую при приеме внутрь.

Распределение

Степень связывания ампициллина с белками плазмы крови составляет 20 %. Ампициллин равномерно распределяется в органах и тканях организма, обнаруживается в терапевтических концентрациях в плевральной, перитонеальной, амниотической и синовиальной жидкостях, ликворе, содержимом волдырей, моче (высокие концентрации), слизистой оболочке кишечника, костях, желчном пузыре, легких, тканях женских половых органов, желчи, в бронхиальном секрете (в гнойном бронхиальном секрете накопление слабое), придаточных пазухах носа, жидкости среднего уха (при его воспалении), слюне, тканях плода. Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, но его проницаемость увеличивается при воспалении мозговых оболочек.

Элиминация

Период полувыведения ($t_{1/2}$) ампициллина составляет в среднем 1–2 ч.

Выводится преимущественно почками (70–80 %), в моче создаются очень высокие концентрации неизмененного антибиотика; частично выводится с желчью, у кормящих матерей – с молоком. Не кумулирует. Удаляется при гемодиализе.

Показания к применению

Препарат Ампициллин показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 0 месяцев для лечения следующих инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к ампициллину микроорганизмами:

- инфекции дыхательных путей (бронхит, пневмония, абсцесс легкого);
- инфекции ЛОР-органов (синусит, тонзиллит, фарингит, средний отит);
- инфекции желчевыводящих путей (холецистит, холангит);
- инфекции мочевыводящих путей (пиелит, пиелонефрит, уретрит, цистит);
- инфекции желудочно-кишечного тракта (брюшной тиф и паратиф, дизентерия, сальмонеллез);
- гинекологические инфекции (цервицит);
- инфекции кожи и мягких тканей (рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы);

- инфекции опорно-двигательного аппарата;
- перитонит;
- сепсис;
- эндокардит (профилактика и лечение);
- менингит;
- листериоз;
- гонорея.

Противопоказания

Гиперчувствительность к ампициллину, а также к другим бета-лактамным антибиотикам (пенициллинам, цефалоспорином, карбапенемам), инфекционный мононуклеоз, лимфолейкоз, нарушение функции печени, заболевания желудочно-кишечного тракта в анамнезе (особенно колит, связанный с применением антибиотиков).

С осторожностью

Бронхиальная астма, поллиноз и другие аллергические заболевания, почечная недостаточность, кровотечения в анамнезе, беременность, детский возраст до 1 месяца.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение ампициллина во время беременности возможно только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Ампициллин выделяется с грудным молоком в низких концентрациях. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутримышечно (в/м).

Дозы и длительность лечения устанавливают индивидуально в зависимости от тяжести течения, локализации инфекции и чувствительности возбудителя инфекции.

При инфекциях среднетяжелого течения взрослым и детям с массой тела свыше 20 кг вводят в/м – 250–500 мг каждые 6 ч; при тяжелом течении – 1000–2000 мг каждые 3–4 ч.

Листериоз – по 50 мг/кг каждые 6 ч.

Тифозная лихорадка – по 25 мг/кг каждые 6 ч.

При гонококковом уретрите – 3,5 г однократно.

Максимальная суточная доза 14 г/сут.

Детям (при менингите): новорожденным с массой тела до 2 кг – в/м 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.

При других показаниях в/м детям с массой тела до 20 кг – 12,5–25 мг/кг каждые 6 ч.

Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания (от 5–10 дней до 2–3 нед, а при хронических процессах – в течение нескольких месяцев).

Раствор для внутримышечного введения готовят, добавляя к содержимому флакона воду для инъекций в количестве: 2 мл на флакон 250 мг или 500 мг; 4 мл – на флакон 1000 мг.

Растворы используют сразу после приготовления.

Перед назначением ампициллина следует определять чувствительность возбудителя заболевания к препарату.

Побочное действие

Инфекции и инвазии: суперинфекция (особенно у пациентов с хроническими заболеваниями или сниженной резистентностью организма), кандидоз влагалища.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, анемия.

Нарушения со стороны иммунной системы: шелушение кожи, зуд, крапивница, ринит, конъюнктивит, отек Квинке, 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, неаллергическая ампициллиновая сыпь (может исчезнуть без отмены препарата).

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

Желудочно-кишечные нарушения: дисбактериоз, стоматит, гастрит, сухость во рту, изменение вкуса, боль в животе, рвота, тошнота, диарея, глоссит, нарушение функции печени, умеренное повышение активности «печеночных» трансаминаз, псевдомембранозный колит.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: интерстициальный нефрит, нефропатия.

Общие нарушения и реакции в месте введения: боль в месте введения, инфильтраты при в/м введении.

Передозировка

Симптомы: проявление токсического действия на центральную нервную систему (особенно у больных с почечной недостаточностью); тошнота, рвота, диарея, нарушение водно-электролитного баланса (как следствие рвоты и диареи).

Лечение симптоматическое. Выводится с помощью гемодиализа.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Бактерицидные антибиотики (в т. ч. аминогликозиды, цефалоспорины, циклосерин, ванкомицин, рифампицин) оказывают синергидное действие; бактериостатические лекарственные средства (в т. ч. макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины, сульфаниламиды) – антагонистическое.

Повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (подавляя кишечную микрофлору, снижает синтез витамина К и протромбиновый индекс); уменьшает эффективность эстрогенсодержащих пероральных контрацептивов (необходимо использовать дополнительные методы контрацепции), лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется парааминобензойная кислота, этинилэстрадиола (в последнем случае повышается риск развития кровотечений «прорыва»).

Диуретики, пробенецид, аллопуринол, оксифенбутазон, фенилбутазон, нестероидные противовоспалительные препараты и другие лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, повышают концентрацию ампициллина в плазме крови (за счет снижения канальцевой секреции ампициллина).

Одновременное применение с аллопуринолом увеличивает риск развития кожной сыпи.

Ампициллин уменьшает клиренс и повышает токсичность метотрексата.

Особые указания

Перед началом терапии должен быть собран тщательный анамнез на предмет предшествующих реакций гиперчувствительности на бета-лактамы антибиотики. Сообщалось о серьезных и иногда заканчивавшихся смертельным исходом перекрестных аллергических реакциях у пациентов, получавших бета-лактамы антибиотики. Хотя анафилаксия чаще возникает после парентерального введения, у пациентов, принимавших пенициллины перорально, она также была зарегистрирована. Развитие данных реакций более вероятно у лиц с гиперчувствительностью к бета-лактамам в анамнезе и у лиц с атопией. При возникновении аллергической реакции необходимо прекратить терапию ампициллином и назначить соответствующую альтернативную терапию.

При применении препарата в высоких дозах у пациентов с почечной недостаточностью возможно токсическое действие на центральную нервную систему.

При курсовом лечении необходимо проводить контроль состояния функции органов кроветворения, печени и почек.

Возможно развитие суперинфекции за счет роста нечувствительной к препарату микрофлоры, что требует соответствующего изменения антибактериальной терапии.

При лечении больных с бактериемией (сепсис) возможно развитие реакции бактериолиза (реакция Яриша – Герксгеймера).

При лечении легкой диареи, вызванной *Clostridium difficile*, на фоне курсового лечения следует избегать противодиарейных препаратов, снижающих перистальтику кишечника; можно использовать каолин- или аттапульгитсодержащие противодиарейные средства. При тяжелой диарее необходимо обратиться к врачу. Лечение должно обязательно продолжаться на протяжении еще 48–72 ч после исчезновения клинических признаков заболевания.

При одновременном применении эстрогенсодержащих пероральных контрацептивов и ампициллина, следует по возможности использовать другие или дополнительные методы контрацепции (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»).

Ампициллин следует с осторожностью применять у пациентов с кровотечениями в анамнезе (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»).

Ампициллин следует с осторожностью применять у беременных пациенток (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

Ампициллин следует с осторожностью применять у детей в возрасте до 1 месяца.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для внутримышечного введения 250 мг, 500 мг, 1000 мг.

По 250 мг, 500 мг, 1000 мг ампициллина во флаконы вместимостью 10 мл или 20 мл, герметично закупоренные пробками резиновыми, обжатыми колпачками алюминиевыми или колпачками комбинированными алюминиевыми с пластмассовыми крышками.

1, 5, 10 флаконов с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

50 флаконов с инструкцией по применению помещают в коробку из картона для поставки в стационары.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 20 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»), Россия

Курганская обл., г.о. г. Курган, г. Курган, проспект Конституции, д. 7, стр. 6.

Выпускающий контроль качества

Курганская обл., г.о. г. Курган, г. Курган, проспект Конституции, стр. 7/32.

Держатель регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии потребителей

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»), Россия

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: +7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru