

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНОТО СРЕДСТВО

AMPICILLIN

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Ampicillin твърди капсули 500mg:

Активно вещество: Ampicillin trihydrate 577,4mg, еквивалентно на 500mg Ampicillin.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба №

11-3225/26.03.2001

603/13-02.01

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

ТВЪРДИ КАПСУЛИ

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ПОКАЗАНИЯ

Ампицилин, приложен перорално, се прилага за лечение на леки и умерено тежки инфекции, причинени от чувствителни към антибиотика микроорганизми.

- Инфекции на дихателните пътища - трахеобронхити, бронхити, пневмонии, пертусис.

- Инфекции в оториноларингологията – тонзилити, възпаления на средното ухо и епиглотиса;

- Инфекции в стоматологичната практика – абсцеси и гангрени.

- Инфекции на гастро-интестиналния тракт - кореман тиф и паратиф.

- Инфекции на жлъчните пътища - холецистити, холангити,

- Уро-генитални инфекции - пиелонефрити, пиелити, цистити, уретрити; епидидимити, орхити; гонорея (неусложнена) и гонококов уретрит, обикновено в комбинация с пробенецид;

- Инфекции на женските полови органи - ендо - и параметрити, аднексити, фебрилни аборти;



•Ампицилин капсули е подходящ за последващо перорално лечение след начална парентерална терапия при менингити, ендокардити и листериоза.

•Ампицилин капсули е подходящ за лечение на дуоденална язва и антробулбит в двойни и тройни комбинации с други антибактериални средства.

•4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА ПРИЛОЖЕНИЕ

Ампицилин се приема перорално 30 min преди или 2 часа след хранене.

Обичайната доза за възрастни е 500 mg до 1 g на всеки 6 часа. Дневна доза – 2-4 g, но може да достигне до 6 и повече g.

За деца с тегло над 20 kg се препоръчва доза - 100 mg/kg дневно, разделена на 4 приема. По преценка на лекаря дозата може да се повиши до 200 mg/kg за 24 часа, разделена на 4 приема.

При кърмачета и малки деца се прилага ампицилин под форма на суспензия.

За лечение на неусложнена гонорея се прилага еднократна доза 2 g - 3,5 g ампицилин (може и в комбинация с 1 g пробенецид).

За лечение на дуоденална язва и антробулбит се прилагат - 500 mg 4 пъти дневно в комбинация с други антихеликобактерни средства.

При хронични уринарни или гастро-интестинални инфекции е необходимо бактериологично изследване в продължение на няколко месеца след приключване на лечението.

Лечението с ампицилин, с изключение на гонорея, продължава минимум 48-72 часа след изчезване на болестните симптоми или до получаване на отрицателна бактериална находка (особено при лечение на стрептококови инфекции). Препоръчва се най-малко 10 дневно лечение на всяка инфекция причинена от β -хемолитични стрептококи гр.А (Str.pyogenes) с цел предотвратяване на остър ревматичен пристъп или гломерулонефрит.



При бъбречна недостатъчност интервалите на дозиране се променят според стойностите на креатининовия клирънс.

Креатининов ml/min	клирънс,	Интервал на дозиране
> 50		на 6 часа
10 - 50		на 6 - 12 часа
< 10		на 12 - 24 часа

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Ампицилин е противопоказан при пациенти с установена свръхчувствителност спрямо ампицилин или друг пеницилинов антибиотик; при свръхчувствителност към цефалоспорини, поради кръстосана свръхчувствителност към антибиотици, или свръхчувствителност към някои от помощните вещества.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И ПРЕДПАЗНИ МЕРКИ ПРИ УПОТРЕБА

Възможна е появата на леки форми на алергия - уртикария, ексфолиативен дерматит, повишена температура. При наличие на такива симптоми лечението с ампицилин трябва да се преустанови и ако е необходимо, да се назначи подходяща терапия. При лечение с ампицилин рядко могат да се появят сериозни алергични реакции, включително анафилаксия. Такива реакции обикновено се проявяват у пациенти с установена алергия към пеницилини. При пациенти с алергична диатеза е необходимо особено внимание при прилагането на антибиотика. При поява на анафилаксия или друга животозастрашаваща реакция, болния незабавно се третира с епинефрин, интравенозни стероиди, обдишване с кислород, при нужда - интубация.

Приемането на антибактериални средства продължително време може да доведе до поява на суперинфекция с микотични или резистентни бактериални патогени. Обикновено леките форми



отзвучават след спирането на антибиотика, но при по-сериозните се прилага съответно лечение. При поява на тежка и упорита диария трябва да се мисли за псевдомембранозен колит, провокиран от антибиотика. В тези случаи прилагането на ампицилин се преустановява и назначава адекватно лечение за възстановяване на електролитния баланс и загубата на течности и протеини. Прилага се и специфично лечение срещу *Clostridium difficile*. Не се препоръчва приложение на антиперисталтични средства.

Не се препоръчва приложението на ампицилин при болни с инфекциозна мононуклеоза, лимфатична левкемия или HIV-инфекция поради повишен риск от кожни обриви.

При болни със съмнение за гонококова инфекция е необходимо провеждане на лабораторни тестове за изключване на заболяване от сифилис. След приключване на лечението с ампицилин се провежда серологично изследване на пациента.

При болни с тежка бъбречна недостатъчност и при пациенти в напреднала възраст се удължава времето за елиминиране на ампицилин, което налага да се коригира интервала на приемане според стойностите на креатининовия клирънс. При продължителен курс на лечение трябва да се следят бъбречната, чернодробната и хемопоетична функции.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Ампицилин действа само върху пролифериращи микроорганизми и не трябва да се комбинира с бактериостатични антибиотици. Ако се налага, може да се комбинира с други бактерицидни антибиотици (цефалоспорини, аминоглюкозиди). Съществува синергизъм между ампицилин и аминоглюкозидите, затова са подходящи в комбинация срещу редица микроорганизми, включително ентерококи. Установен е синергизъм между ампицилин и беталактамазо-инхибиторите (клавуланова киселина, сулбактам) а също и между ампицилин и пеницилазо-устойчивите



клоксацилин и флуоклоксацилин спрямо някои беталактамаза-продуциращи микроорганизми. Променлив ефект, включително синергизъм, антагонизъм или индиферентност се наблюдава между ампицилин и други беталактамни антибиотици, бактериостатични антибиотици – рифампицин и хлорнитромицин.

Едновременното лечение с ампицилин и алопуринол може да предизвика кожни обриви, особено при по-чувствителни пациенти.

Приемането на пробенецид забавя тубуларната секреция на ампицилин и води до повишаване на кръвните нива на антибиотика.

Ампицилин може да намали ефекта на пероралните естроген-съдържащи противозачатъчни средства, поради повлияване на чревната флора.

Високи дози ампицилин намаляват плазмените нива на атенолол, поради което се препоръчва да се прилагат отделно, като атенолол предхожда ампицилин.

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Приложението на Ампицилин по време на бременност се счита безопасно. Антибиотикът преминава в малки количества плацентарната бариера и е възможно сенсibiliзиране на плода (през втората половина на бременността). Ампицилин се екскретира в малки количества в майчиното мляко и е възможно да причини диария, обриви и кандидоза у кърмачето. Затова е необходимо да се прилага с внимание при кърмещи майки.

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Ампицилин не оказва влияние върху способността за шофиране и при работа с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Възможни са реакции от страна на гастро-интестиналния тракт - сухота в устата, гадене, повръщане, коремни болки, диария



кандидозен стоматит. Като антибактериален агент ампицилин може да предизвика псевдомембранозен колит, което е резултат от потискане на нормалната чревна флора.

Алергични реакции - уртикария, еритематозен макулопапулозен обрив, ексфолиативен дерматит, повишена температура, по-рядко бронхоспазъм, ангионевротичен оток. Много рядко могат да се появят тежки реакции на свръхчувствителност – анафилактичен шок или серумна болест.

В резултат на прилагането на ампицилин е възможно фалшиво позитивиране на теста за глюкоза в урината.

В случаи на продължително лечение рядко е възможна поява на анемия, тромбоцитопения, еозинофилия, левкопения, агранулоцитоза, които обикновено отзвучават след приключване на лечението.

Рядко се наблюдават случаи на интерстициален нефрит.

Могат да се наблюдават леко и транзиторно покачване на серумните трансаминази, алкалната фосфатаза, лактатдехидрогеназата, уреята и креатинина.

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

В случаи на предозирание могат да се наблюдават гърчове. Могат да се наблюдават и някои от изброените нежелани лекарствени реакции. Не съществува специфичен антидот при предозирание, поради това приемът на препарата се прекратява и се прилагат симптоматично и поддържащо лечение. Може да се приложи хемодиализа.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

АТС код J01C A01. Беталактамни антибактериални препарати, пеницилини. Пеницилини с широк спектър на действие.



Ампицилин е широкоспектърен полусинтетичен пеницилин. Наличието на аминокгрупа в страничната верига подобрява пенетрацията на антибиотика през външната мембрана на някои Грам-отрицателни микроорганизми, което разширява спектъра му. Ампицилин притежава бактерициден тип действие, като инхибира биосинтеза на пептидогликана в клетъчната стена. Действието на антибиотика се осъществява през фазата на пролиферация на микроорганизмите.

Антимикробният спектър на ампицилин обхваща:

Грам-положителни микроорганизми - алфа- и бетаксемолитични стрептококи, пеницилин-чувствителни *Str.pneumoniae*; пеницилиназо-непродуциращи стафилококи; *Bacillus anthracis*; *Clostridium sp.*, *Corynebacterium xerosis*; *Enterococcus faecalis*, *Listeria monocytogenes*, пеницилаза-непродуциращи анаероби. По отношение на ентерокок и листерия, активността на ампицилин превъзхожда тази на пеницилин G.

Грам-отрицателни микроорганизми – чувствителните щамове *Neisseria gonorrhoeae*, *N.meningitidis*, *Bordetella pertussis*, чувствителните *Haemophilus influenzae*, *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Salmonella sp.*, *Shigella sp.*

Ампицилинът е много активен спрямо щамове на *H.pylori*, причиняващи дуоденалната язва и антробулбита.

Ампицилинът притежава сходна на пеницилин G активност спрямо други микроорганизми, включително голям брой анаероби и *Actinomyces sp.* Ампицилин се инактивира от β -лактамазите и е неактивен спрямо беталактамазо-продуциращи микроорганизми, включващи някои щамове *Staphylococcus*, *H.influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Proteus vulgaris*, *Klebsiella pneumoniae*, *Enterobacter aerogenes*, някои щамове *Escherichia coli*.

Ампицилин е неактивен спрямо *Pseudomonas aeruginosa*, групата *Bacteroides fragilis*, *Rickettsia*, *Mycoplasma* и *Chlamydiae*.



5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Ампицилин е стабилен в присъствие на киселия стомашен сок и приет перорално се резорбира 30-35% от гастро-интестиналния тракт. Храната може да повлияе резорбцията на ампицилин, затова е необходимо дозите да се приемат 30 min. преди хранене. Около 20% се свързва с плазмените протеини. Серумното време на полуелиминиране е 1-1,5 часа, но може да бъде удължено при новородени, пациенти в напреднала възраст и пациенти с увредена бъбречна функция. Дифундира добре в повечето телесни тъкани и течности, с изключение на мозъка и цереброспиналната течност, където се концентрира само при възпалени менинги. Ампицилин достига терапевтични концентрации в асцитната, плеврална и синовиалната течности. Премахва плацентата и достига феталното кръвообръщение; в малки количества се екскретира в майчиното мляко. Пикови плазмени концентрации достига 1-2 часа след орален прием като с удвояване на дозата се удвояват и плазмените концентрации.

Незначителна част от антибиотика се метаболизира до пенициланова киселина. Бъбречният клирънс се осъществява чрез гломерулна филтрация и тубуларна секреция; незначителна част се екскретира с фекалиите. Ампицилин се отстранява с хемодиализа.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Ампицилин е практически нетоксичен антибиотик, както след еднократно, така и след многократно прилагане.

Острата токсичност, определена в бели мишки показва висока биологична поносимост ($LD_{50} = 3750\text{mg/kg}$ след i.v. прилагане) и голяма терапевтична ширина.

Хроничното (3-месечно) перорално прилагане на Ампицилин върху бели плъхове в дози, надвишаващи 10 и повече пъти еднократната терапевтична доза, не води до промени в поведението, приръста, биохимичните и хематологични показатели



и в хистологичната структура на основните вътрешни органи, което характеризира този антибиотик като нетоксичен.

Ампицилин, приложен перорално на плъхове в дози 50 и 100mg/kg от началото до края на бременността не предизвиква тератогенен ефект, което се доказва с липсата на мъртвородени плъхчета, пълната преживяемост, отсъствието на макроскопски и хистологични промени в най-важните органи на новородените.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА И ТЕХНИТЕ КОЛИЧЕСТВА в mg в една капсула:

В Ампицилин капсули 500 mg: Magnesium stearate 7,0 mg

Състав на твърдата желатинова капсула: Black iron oxide, Azorubine, Titanium dioxide, Gelatin.

6.2. ФИЗИКО-ХИМИЧНИ НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Не са известни несъвместимости при перорално прилагане на ампицилина.

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

Три години.

6.4. УСЛОВИЕ НА СЪХРАНЕНИЕ

При температура под 25° C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. ДАННИ ЗА ОПАКОВКАТА

20 броя Ampicillin капсули по 500 mg в опаковка.

6.6. ПРЕПОРЪКИ ПРИ УПОТРЕБА

Препаратът се отпуска с рецепта!



7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

"Балканфарма-Разград" АД
бул."Априлско въстание" 68
Разград - 7200
България

8. СТРАНИ, В КОИТО ЛЕКАРСТВЕНОТО СРЕДСТВО Е РЕГИСТРИРАНО

Литва, Украйна, Молдова протокол

9. ДАТА НА ПЪРВОТО РАЗРЕШИТЕЛНО

За AMPICILLIN капсули 500 mg: КЛС протокол - 408/12.07.1976г.

