

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

AMIKACIN /АМИКАЦИН

10x500mg/2ml *расивор за инјектирање/инфузија*

Назив,седиштие и адреса на производителот на леко:

Галеника а.д.
Баџајнички друм б.б. , 11080 Белград, Р.Србија

*Назив,седиштие и адреса на носителот на одобрението за сивавање во
промет :*

Галеника а.д. Претставништво , Скопје
Лермонтова бр.3/4-10 , 1000 Скопје, Р.Македонија

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ , ИНТЕРНАЦИОНАЛНО НЕЗАШТИТЕНО ИМЕ НА ЛЕКОТ (INN)

AMIKACIN
INN: amikacin

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

2 ml раствор за инјектирање/инфузија содржи 500 mg амикацин (500 000 IE)

За ексципиентите да се види 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКИ ОБЛИК

Раствор за инјектирање/инфузија.
Бистар, безбоен до светло жолт раствор.

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1. Терапевтски индикации

Амикацин е лек на избор за тешки инфекции предизвикани од Грам-негативни причинители вклучувајќи *Pseudomonas spp*; *Echerichia coli* ; индол-позитивен и индол-негативен *Proteus spp*; *Klebsiella* – *Enterobacter* – *Serratia spp* , *Minea* – *Herellae* , *Citobacter freundii* и *Providencia spp*.

Многу соеви на Грам-негативни бактерии кои се резистентни на гентамицин и тобрамицин *in vitro* покажуваат осетливост на амикацин.

Од Грам-позитивните причинители кои се осетливи на амикацин на прво место е *Staphylococcus aureus* , вклучувајќи и соеви кои се резистентни на метицилин. Амикацин покажува извесна активност и на други грам-позитивни микроорганизми вклучувајќи и одредени соеви на *Streptococcus pyogenes* , *Enterococci* и *Diplococcus pneumoniae*.

Амикацин се применува кога ќе се потврди осетливоста на причинителот во терапијата на инфекции на респираторниот , гастроинтестиналниот , урогениталниот тракт , кожата , поткожното ткиво , зглобовите и ЦНС. Амикацин може да се применува за лекување на бактериемија , септикемија , неонатална сепса , остеомиелитис , перитонитис , менингитис.

4.2. Дозирање и начин на примена

Интармускулна и интравенска употреба

Интармускулната примена се препорачува за најголем број инфекции. Кај многу тешки инфекции или кај пациенти кај кои интармускулната примена не е можна , може да се користи и интравенски начин на примена во вид на спора интравенска инјекција во траење од 2 до 3 минути или интравенска инфузија во траење од 30 до 60 минути. За помалите деца се препорачува инфузијата да трае 1 до 2 часа. Инфузионит раствор се припрема како 0,25 % раствор на амикацин во физиолошки раствор 0,9 % , 5% декстроза или Рингеров раствор со лактат.

Неkomplицирани инфекции

Кај неkomplицирани инфекции предизвикани со осетливи микроорганизми позитивен одговор би требало да настапи во тек од 24 до 48 часа. Доколку во рок од 3 до 5 дена позитивниот клинички одговор изостане, треба да се размисли за алтернативна антибиотска терапија.

Возрасни и деца

15 mg/kg/ден поделено во две поединечни дози. Ова одговара на доза од 500 mg амикацин 2 пати дневно кај возрасни. Јачината на лекот од 100 mg/ 2 ml се користи најчесто кај деца заради прецизно мерење на адекватната доза. Вообичаено траење на лекувањето е 7 до 10 дена, со тоа што вкупната терапевска доза за возрасни не смее да помине 15 g.

Новородени и предвремено родени деца:

Дозата на амикацин за новородени и предвремено родени деца се движи од почетна доза е 10 mg/kg/ден а потоа се продолжува со терапија од 15 mg/kg/ден поделено во две поединечни дози.

Сшари лица:

Амикацин се излачува преку урината и кај старите пациенти потребно е да се процени бубрежната функција. Доколку бубрежната функција е оштетена, дозата треба да се прилагоди како што е опишано кај пациентите со оштетување на бубрежната функција.

Пациенти со оштетена бубрежна функција:

Кај пациенти со оштетена бубрежна функција дневната доза треба да се намали и /или продолжи интервалот помеѓу дозите за да би се избегнал ефектот на акумулација на лекот.

Предложената метода за пресметување на дозата, кај пациенти со познато оштетување на бубрежната функција или сомневање за оштетување е серумската концентрација на креатинин (изразена во mg/ 100 ml) да се помножи со 9, при што добиениот резултат претставува временски интервал меѓу две дози. Критичната концентрацијата на креатининот во серумот е 1,5 mg/ 100 ml.

Витална загрозеност и / или инфекција предизвикана од *Pseudomonas*:

Дозите за возрасни можат да се зголемат до 500 mg на секои 8 часа. Максималната дневна доза е 1,5 g и должина на терапијата 7- 10 дена. Вкупната терапевтска доза за возрасни изнесува 15 g.

Инфекции на уринарниот тракт (сшсе освен инфекциите предизвикани од *Pseudomonas*):

7,5 mg / kg / ден поделена во две поединечни дози (одговара на доза од 250 mg двапати дневно кај возрасни). Дејството на Амикацин е зголемено со зголемување на pH

вредноста на урината така што супстанциите кои ја зголемуваат алкалноста на урината може да се даваат истовремено со амикацин.

Интраперитонеален пати и други патишта за апликација на лекови

Амикациот може да се користи кај пациенти како раствор за иригација (0,25 %) во апсцесни каверни, плевралениот простор, перитонеумот и мозочните комори .

4.3.Контраиндикации

Алергиски реакции на амикацин или на било која компонента на лекот.

Myasthenia gravis

Интраперитонеална примена на амикацин кај мали деца и кај пациенти под дејство на анестезија или миорелаксанти.

4.4.Посебни предупредувања и мерки на претпазливост при употребата на лекот

Во текот на терапијата со амикацин пациентите би требало да бидат добро хидрирани.

Ототоксичниот и нефротоксичниот ефект е ист како и кај примената на сите аминогликозиди и е во директна врска со вкупната доза на лекот , должината на терапијата и степенот на дехидрација на пациентот. За време и после терапијата со амикацин треба да се следи аудиторната и вестибуларната функција кај пациентот.

Терапијата со амикацин треба внимателно да се разгледа кај пациенти кај кои е утврдена алергија на некој аминогликозиден препарат или кај оние кои имаат субклиничко оштетување на бубрезите или оштетување на осмиот кранијален нерв предизвикано од терапија со некој од нефротоксичните или ототоксичните лекови (стрептомицин, дихидрострептомицин , гентамицин , тобрамицин , канамицин , беканамицин , неомицин , полимиксин Б , колистин , цефалоридин или виомицин) бидејќи токсичноста може да биде адитивна. Кај овие пациенти амикациот се користи само кога терапевтскиот ефект го надминува потенцијалниот ризик од дејството на лекот.

Кај пациенти кои имаат оштетена бубрежна функција , намалена гломеруларна филтрација или кај стари пациенти , амикацин треба да се користи со посебна предострожност. Во вакви случаи потребна е редовна контрола на бубрежната функција со вообичаени методи како пред така и во тек на терапијата. Во согласност со вредностите на серумската концентрација на креатинин треба да се намали дневната доза и /или продолжи интервалот помеѓу дозите за да се избегне ефектот за акумулација на абнормално високи концентрации на лекот во крвта и ототоксичниот ефект. Потребно е да се мери концентрацијата на лекот во крвта да се прекине терапијата ако концентрацијата помине вредност од 4 микрограми во милилитар.

Во тек на терапијата со амикацин нормалната бубрежна функција може да се менува , затоа се препорачува почеста проверка на серумската концентрација на креатининот и по потреба модифицирање на дозниот режим.

Амикациот треба да се користи со голема предострожност кај новородени и предвреме родени деца , бидејќи бубрежната незрелост кај овие пациенти може да предизвика продолжено полувреме на елиминација на лекот во серумот.

Предострожност е неопходна и кај пациенти со невромускулни заболувања.

4.5.Интеракција со други лекови и други врсти на интеракции

Треба да се избегнува истовремена примена на амикацин со други потенцијално ототоксични или нефротоксични лекови.Ризикот за појава на ототоксичен ефект се зголемува кога амикацин се користи со некој од диуретиците со брзо дејство на пр. фуросемид или етакрична киселина , особено во случај кога диуретикот се применува интравенски.Заедничкото дејство на амикацин и некои од овие диуретици може да предизвика иреверзибилно губење на слухот.

Интраперитонеалната апликација на амикацин не се препорачува на пациенти кои се под дејство на анестетик или миорелаксанти (вклучувајќи и етар, халотан, d-тубокурарин, сукцинилхолин и декаметониум) бидејќи може да дојде до невромускулна блокада и последователна респираторна депресија.

Индометацин може да предизвика зголемување на плазма концентрацијата на амикацин кај новороденчиња.

Кај пациенти со многу оштетена функција на бубрезите , намалување на активноста на аминокгликозид се постигнува со истовремена примена на лекови од пеницилински тип.

4.6.Примена во бременоста и доење

Во бременоста не е утврдена безбедната примена на амикацин. Примената на аминокгликозиди во бременоста може да предизвика оштетување на осмиот кранијален нерв.Во период на бременост и доење амикацин може да се употребува само ако лекарот процени дека постои јасна потреба од лекот.Амикацин брзо поминува низ плацентата , но не постигнува значајна концентрација во млекото на доилката.

4.7. Влијание врз психофизичките способности при управување со моторно возило и ракување со машини

Лекот не влијае врз психофизичките способности при управување со моторно возило и ракување со машини.



4.8. Несакани дејства на лекот

Појавата на несакани ефекти како што се тинитус , вертиго , парцијално реверзибилно или иреверзибилно губење на слухот, исип , пурпура , грозница, главоболка , парестезија, зголемено ниво на билирубин , анемија , мачнина и повраќање , се релативно ретки доколку се почитува препорачаниот режим на дозирање.

Препаратот амикацин ретко може да предизвика тешки хиперсензитивни реакции и бронхоспазам бидејќи во неговиот состав се наоѓа натриум метаби сулфит.

Нефротоксичниот ефект е најчест. Како несакани ефекти забележани се и уринарни знаци на бубрежна иритација (албумин , цилиндри , црвени или бели крвни зрна) , азотемија или олигурија.

Аминогликозидите може да доведат до невромускулен блок и респираторна депресија.

Ако лекот се дава интравитреално можна е појава на ретинална токсичност.

4.9. Предозирање

Во случај на предозирање или токсични реакции многу високите концентрации на амикацин во крвта се корелираат со хемодијализа или перитонеална дијализа. Кај новороденчиња се препорачува екссангино трансфузија.

5. ФАРМАКОЛОШКИ ПОДАТОЦИ

5.1. Фармакодинамски податоци

Фармакотераписка група: Антибактериски лекови за системска примена , Аминогликозидни антибактериски лекови , останати аминогликозиди.

АТЦ Код : J01GB06

Амикацин постигнува бактерициден ефект со рушење на нормалната синтеза на протеини во бактеријата. Понекогаш грешка во тек на делбата на бактеријата на 30S субединица, доведува до грешка во процесот на транслација и последователна синтеза на токсично изменетите протеини.

Амикацин е аминогликозиден антибиотик кој дејствува на широк спектар грам-негативни бактерии вклучувајќи : *Pseudomonas spp*; *Echerichia coli* ; индол-позитивен и индол-негативен *Proteus spp*; *Klebsiella* – *Enetrobacter* – *Serratia spp*, *Salmonella* , *Shigella* , *Minea* – *Herellae* , *Citobacter freundii* , *Providencia spp*.

Многу соеви на грам негативни бактерии кои се резистентни на гентамицин и тобрамицин *in vitro* покажуваат осетливост на амикацин.



Од грам-позитивните причинители кои се сензитивни на амикацин на прво место е *Staphylococcus aureus*, вклучувајќи и соеви кои се резистентни на метицилин. Амикацин покажува извесна активност и на други грам-позитивни микроорганизми вклучувајќи и некои соеви на *Streptococcus pyogenes*, *Enterococci* и *Diplococcus pneumoniae*.

5.2. Фармакокинетски податоци

Амикацин многу брзо се апсорбира после интрамускулна инјекција. Пик плазма концентracијата која се постигнува за еден час изнесува 11 mg/l за доза од 250 mg и 23 mg/l за доза од 500 mg. Нивото на плазма концентрацијата која изнесува 0,3 mg/l (250 mg) и 2,1 mg/l (500 mg) се одржува наредните десет часа. 25% или помалку е врзано за плазма протеините и серумската бактерицидна концентрација на лекот за осетливи микроорганизми се одржува 10-12 часа. Амикацинот лесно поминува во екстрацелуларната течност и терапевтска концентрација се постигнува во коските, срцето, жолчното кесе и белодробното ткиво. Амикацинот добро се дистрибуира и во жолчката, спутумот, бронхијалниот секрет и во интерстицијалната, плевралната, и синовијалната течност. Амикацин се детектира во цереброспиналната течност, плевралната течност, амнионската течност и во перитонеалната шуплина, после парентерална апликација.

Амикацинот се излачува непроменет преку урината, примарно со гломеруларна филтрација. Полувремето на елиминација на амикацин кај пациенти со нормална бубрежна функција е 2 до 3 часа. После интрамускулна инјекција од 250 mg околу 65% се излачува со урината во првите 6 часа, а 91% во тек на 24 часа. Средната уринарна концентрација во првите 6 часа изнесува 563 mg/l, а 163 mg/l во наредните 6 до 12 часа.

После интрамускулна доза од 500 mg средната концентрација во урината во првите 6 часа изнесува 832 mg/l.

Кај поединечни дози од 500 mg кои се даваат во вид на бавна интравенска инфузија во тек на 30 минути пик плазма концентрацијата се постигнува на крајот од инфузијата и изнесува 38 mg/l. Повторените инфузии не доведуваат до акумулација на лекот.

5.3. Предклинички податоци за безбедноста на лекот

Студините за репродуктивната токсичност кај глущици и стаорци покажале дека амикацин нема влијание на фертилитетот нити предизвикува оштетувања кај фетусот на животните.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1. Листа на експииенси

AMIKACIN /АМИКАЦИН 500 mg/ 2 ml, раствор за инјектирање/инфузија
содржи: сулфурна киселина; натриум-цитрат; натриум-метабисулфит (E223); вода за
инекции.

6.2. Инкопатибилност

Не е забележана.



6.3. Рок на употреба

3 години

Лекот не смее да се употребува по датумот на истекот на рокот на употреба што е наведен на пакувањето.

Неупотребениот раствор на инјектирање не е за понатамошна употреба.

6.4. Посебни мерки и предупредување при чувањето

Лекови чувајте го на места недосџайни за деца

Да се чува во оригинално пакување.

Лекот не бара посебни услови за чување.

6.5. Природа и содржина на контактната амбалажа

Ампули од 2 мл изработени од безбојно стакло без бариум, I хидролитичка група, со бел керамички прстен.

6.6. Посебни мерки за уништување на неупотребениот лек или остатоци од лекот

Неупотребениот лек се уништува во согласност со важечките прописи.

7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕ ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕК ВО ПРОМЕТ

Галеника а.д. Претставништво, Скопје

„Лермонтова,, бр.3/4-10 1000 Скопје, Р.Македонија, 02/3290636

8. БРОЈ НА ПРВАТА ДОЗВОЛА И ДАТУМ НА ПРВОТО РЕШЕНИЕ / ОБНОВА

9. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Март 2008 год.

