

**ЗАТВЕРДЖЕНО**  
**Наказ Міністерства охорони**  
**здоров'я України**

22.02.10 № 155

Ресстраційне посвідчення

№ UA/2510/01/01

UA/2510/01/02

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**

**ЛОРИКАЦИН**  
**(LORIKASIN®)**

**Склад:**

*діюча речовина:* амікацин;

1 мл розчину містить амікацину сульфат у перерахуванні на амікацин 50 мг або 250 мг;

*допоміжні речовини:* натрію цитрат, натрію мета бісульфіт (Е 223), кислота сірчана 30 %, вода для ін'єкцій.

**Лікарська форма.** Розчин для ін'єкцій.

**Фармакотерапевтична група.** Антибактеріальні засоби для системного застосування. Аміноглікозиди. Код АТС J01G B06.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

Інфекції, спричинені чутливими до амікацину штамми мікроорганізмів, резистентних до інших аміноглікозидів.

**Противоказання.**

- Ниркова недостатність;
- неврит слухового нерва;
- вагітність;
- період годування груддю;
- підвищена чутливість до амікацину або будь-якого іншого антибіотика аміноглікозидної групи та їх похідних;
- міастенія гравіс;
- порушення функції вестибулярного апарату;
- азотемія (залишковий азот вище 150мг %);
- попереднє лікування ото- або нефротоксичними препаратами.

**Спосіб застосування та дози.**

Застосовують Лорікацин внутрішньом'язово або внутрішньовенно. Звичайні дози для дітей від 12 років і дорослих по 5 мг/кг кожні 8 год або по 7,5 мг/кг кожні 12 год. Максимальна доза для дорослих – 15 мг/кг на добу. У тяжких випадках та при інфекціях, спричинених *Pseudomonas*, добову дозу розподіляють на 3 введення. Максимальна добова доза – 1,5 г. Максимальна курсова доза не повинна перевищувати 15 г. Тривалість

лікування зазвичай становить 3-7 днів при внутрішньовенному введенні та 7-10 днів – при внутрішньом'язовому.

Недоношеним новонародженим призначають у початковій дозі насичення 10 мг/кг, а потім кожні 18-24 год по 7,5 мг/кг протягом 7-10 днів. Доношеним новонародженим і дітям до 12 років спочатку призначають 10 мг/кг, потім 7,5 мг/кг кожні 12 год протягом 7-10 днів.

При лікуванні хворих з порушеною функцією нирок добову дозу потрібно знизити та/або збільшити інтервали між введеннями. Дозу знижують залежно від вмісту креатиніну в плазмі крові та маси тіла пацієнта. Інтервал між введеннями антибіотика розраховують шляхом множення значення рівня креатиніну в плазмі крові на 9; наприклад, якщо рівень креатиніну 2 мг, препарат призначають через кожні 18 год.

Вводити Лорікацин шляхом внутрішньовенної інфузії дорослим і дітям потрібно, використовуючи об'єм рідини, достатній для краплинного вливання, протягом 60-90 хв (зі швидкістю 50 крапель за 1 хв), а новонародженим – протягом 1-2 год. Концентрація розчину Лорікацину при внутрішньовенному введенні не повинна перевищувати 5 мг/мл. Внутрішньовенну ін'єкцію Лорікацину потрібно робити дуже повільно (протягом 2-7 хв). Розчин для парентерального введення готують безпосередньо перед введенням та використовують одразу після приготування.

Для внутрішньовенного введення можна застосовувати наступні розчинники: 0,9 % розчин натрію хлориду, 5 % розчин глюкози, лактатний розчин Рінгера для ін'єкцій, що містить глюкозу (5 %).

#### **Побічні реакції.**

**З боку сечовидільної системи:** нефротоксичність – порушення функції нирок (олігурія, альбумінурія, циліндрурія, гіперазотемія, протеїнурія, мікрогематурія), рідко – ниркова недостатність.

**З боку органів слуху:** частково відновлювальна або невідновлювальна глухота, шум у вухах.

**З боку серцево-судинної системи:** васкуліт, артеріальна гіпотензія.

**З боку центральної нервової системи:** головний біль, сонливість, вестибулярні розлади.

**З боку шлунково-кишкового тракту:** нудота, блювання, діарея.

**З боку системи кровотворення:** анемія, лейкопенія, гранулоцитопенія, гематурія, тромбоцитопенія

**Алергічні реакції:** шкірні висипання, свербіж, пропасниця, рідко – набряк Квінке.

**Місцеві реакції:** у поодиноких випадках - порушення нейром'язової провідності, можливе виникнення нервово-м'язової блокади.

**Інші:** біль у місці введення ін'єкції, парестезії, тремор.

**Передозування.** При передозуванні можлива поява токсичних реакцій у вигляді головного болю, сонливості.

При необхідності препарат виводять з організму шляхом парентерального діалізу чи гемодіалізу. Знижують рівень амікацину безперервною артеріовенною гемофільтрацією. Також застосовують обмінну гемотрансфузію для виведення препарату з організму у новонароджених дітей.

При перших ознаках блокади нервово-м'язової провідності необхідно припинити введення амікацину сульфату та негайно ввести внутрішньовенно розчин кальцію хлориду або підшкірно розчин прозерину та атропіну. При необхідності хворого переводять на кероване дихання.

#### **Застосування у період вагітності або годування груддю.**

У зв'язку з тим, що амікацин проникає крізь плаценту та може здійснювати нефротоксичну дію на плід, препарат протипоказаний для застосування під час вагітності.

Під час застосування Лорікацину годування груддю треба припинити у зв'язку з тим, що амікацин у низьких концентраціях проникає у грудне молоко та може впливати на мікрофлору кишечника дитини, яка знаходиться на грудному вигодовуванні.

**Діти.** Лорікацин застосовують з обережністю для лікування недоношених і доношених немовлят, оскільки через недорозвинення видільної системи виведення аміноглікозидів може подовжуватись, спричиняючи явища токсичності.

#### **Особливості застосування.**

Не рекомендується призначати Лорікацин хворим з підвищеною чутливістю до інших аміноглікозидів через небезпеку перехресної алергії. З обережністю слід приймати хворим на міастенію та паркінсонізм, а також людям літнього віку, пацієнтам які мають порушення нервово-м'язової провідності у зв'язку з можливістю виникнення курареподібного ефекту.

Хворим з порушеною функцією нирок необхідно коригувати режим дозування залежно від кліренсу креатиніну. Ризик розвитку ототоксичної та нефротоксичної дії підвищується при введенні великих доз препарату. Для профілактики ото- та нефротоксичних ускладнень та зменшення кількості їх розвитку препарат рекомендується застосовувати під контролем функції нирок, слуху та вестибулярного апарату, який необхідно проводити не рідше 1 разу на тиждень.

Основним токсичним ефектом препарату при парентеральному введенні є його дія на VIII пару черепно-мозкових нервів, яка проявляється спочатку глухотою у діапазоні звуків високої частоти. У хворих із порушеннями функції нирок ризик розвитку ототоксичних ускладнень значно вищий. До початку лікування необхідно провести корекцію водно-електролітного балансу у пацієнта. В період лікування амікацину сульфатом необхідно вживати достатню кількість рідини, часто визначати концентрацію креатиніну в плазмі крові та при необхідності коригувати схему дозування.

Пацієнтам похилого віку треба зменшувати дозу Лорікацину у зв'язку зі зниженням функціональної активності нирок і можливим зниженням маси тіла. Слід регулярно оцінювати функціональну активність нирок. Потрібен аналіз сечі до або під час лікування. Необхідне періодичне обстеження та запис аудіограми, визначення вестибулярної функції. Якщо спостерігається ниркова, вестибулярна або слухова недостатність, слід зменшити дозу або припинити прийом Лорікацину.

Застосування Лорікацину може змінити такі лабораторні показники: сироваткова аланінамінотрансфераза, аспартатамінотрансфераза, білірубін, лактатдегідрогеназа, алкалінфосфат, сечовий азот, креатинін, іони кальцію, магнію, калію, натрію.

У пацієнтів з порушенням функції нирок добова доза має бути зниженою та/або інтервал між дозами збільшено, відповідно до концентрації креатиніну у сироватці, для запобігання накопиченню препарату у крові та зведення до мінімуму ризику ототоксичності. Якщо з'являються ознаки подразнення нирок (наприклад, альбумінурія, мікрогематурія, лейкоцитурія), гідратація має бути збільшена та знижено дозування. Ці прояви, зазвичай, зникають після завершення лікування. Якщо з'являються ознаки ототоксичності (наприклад, запаморочення, дзвін, шум у вухах або зниження слуху) або нефротоксичності (наприклад, зниження кліренсу креатиніну, олігурія), застосування Лорікацину має бути припинено або зменшено дозу. Однак, якщо виникають прояви азотемії або наростає олігурія, лікування має бути зупинено.

Одночасне застосування амікацину сульфату та діуретиків швидкої дії, наприклад, похідних етакринової кислоти, фуросеміду, маніту (особливо якщо діуретик вводять внутрішньовенно), може призвести до розвитку невідновлювальної глухоти.

Не можна призначати одночасно два аміноглікозиди або замінювати один препарат іншим, якщо перший аміноглікозид застосовувався протягом 7-10 днів. Повторний курс можна проводити не раніше як за 4-6 тижнів.

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.** Препарат загалом не впливає на швидкість реакції, але слід враховувати імовірність таких побічних ефектів з боку центральної нервової системи, як сонливість, порушення нервово-м'язової передачі.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

Амікацин виявляє синергізм при взаємодії з карбеніциліном, бензилпеніциліном, цефалоспоринами.

В разі застосування декількох антибіотиків Лорікацин не можна змішувати в одному шприці або флаконі з іншими антибактеріальними агентами.

Одночасне введення Лорікацину з анестетиками і міорелаксантами може спричинити блокування нейром'язової передачі та параліч дихальних м'язів.

Також посилення нервово-м'язового блокування відзначається при одночасному застосуванні з засобами для інгаляційного наркозу, опіїдних анальгетиків, магнію сульфату та при переливанні великої кількості крові з цитратними консервантами.

Індометацин, фенілбутазон та інші НПЗС, які порушують нирковий кровотік, можуть сповільнювати швидкість виведення Лорікацину. Коли Лорікацин застосовується одночасно з внутрішньовенним введенням індометацину недоношеним немовлятам, відбувається підвищення концентрації препарату в плазмі крові і виникає ризик розвитку токсичності.

При одночасному застосуванні з ванкоміцином, метоксифлураном, енфлураном, НПЗС, рентгенконтрастними засобами, циклоспорином, цисплатином, амфотерицином В, цефалотином, поліміксином і фуросемідом підвищується ризик розвитку нефротоксичної дії.

При одночасному застосуванні з ефіром етиловим і блокаторами нервово-м'язової передачі підвищується ризик пригнічення дихання.

Ризик розвитку ототоксичної дії зростає при одночасному застосуванні Лорікацину з фуросемідом і етакриновою кислотою.

Комбінації антибіотиків – амікацин+цефтазидим та амікацин+цефотаксим виявляють найбільш адитивний та синергістичний ефект по відношенню до *Pseudomonas aeruginosa*.

**Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.** Амікацин - напівсинтетичний аміноглікозидний антибіотик широкого спектра дії. Амікацин активно проникає крізь мембрану бактеріальної клітини. Зв'язуючись з 30S субодиницею рибосом, заважає утворенню комплексу транспортної та матричної РНК, блокує синтез білка, а також порушує синтез цитоплазматичної мембрани бактерії.

Активний відносно аеробних грамотригативних мікроорганізмів: *Pseudomonas aeruginosa*, *Escherichia coli*, *Shigella* spp., *Salmonella* spp., *Klebsiella* spp., *Enterobacter* spp., *Providencia* spp., *Proteus* spp. (індолпозитивні та індолнегативні штами), *Serratia* spp., *Acinetobacter species*, *Citrobacter freundii*.

Активний відносно деяких грампозитивних мікроорганізмів: *Staphylococcus* spp., у т.ч. стафілококів, стійких до пеніциліну, метициліну, деяких цефалоспоринів і деяких штамів *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus pneumoniae*, *Enterococcus*. Амікацин за деяких умов можна застосовувати як базову терапію при встановленому діагнозі або при підозрі на хворобу, яка спричиняється чутливими штамми стафілококів у пацієнтів з алергією на інші антибіотики, та при змішаних стафілококово-грамотригативних інфекціях.

Амікацин неактивний щодо анаеробних збудників.

**Фармакокінетика.** Після внутрішньом'язового введення Амікацин всмоктується швидко та повністю. Максимальна концентрація досягається через 0,5-1,5 години після внутрішньом'язового введення та через 0,5 години після внутрішньовенного введення. Терапевтична концентрація амікацину зберігається протягом 10-12 год.

### *Розподіл.*

Зв'язування з білками крові становить 4-11%. Амікацин добре розподіляється у позаклітинній речовині (вмісті абсцесів, плевральному випоті, асцитичній, перикардиальній, синовіальній, лімфатичній та перитонеальній рідині). Амікацин у високих концентраціях знаходиться у сечі, в низьких – у жовчі, грудному молоці, водянистій волозі ока, бронхіальному секреті, мокротинні та спинномозковій рідині. Амікацин добре проникає у всі тканини організму, де накопичується внутрішньоклітинно. Високі концентрації Амікацину відзначаються в органах з посиленням кровопостачання: легенях, печінці, міокарді, селезінці і особливо у нирках, де накопичується у корковому шарі; менші концентрації - у м'язах, жировій тканині та кістках.

У дорослих в середніх терапевтичних дозах Амікацин практично не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр, при запаленні мозкових оболонок - проникнення різко збільшується. У новонароджених досягаються більш високі концентрації у спинномозковій рідині, ніж у дорослих.

Амікацин проникає крізь плацентарний бар'єр і виявляється в крові плода та амніотичній рідині.

### *Виведення.*

Амікацин не метаболізується, виводиться нирками шляхом клубочкової фільтрації (65-94 %) в незмінному стані, утворюючи високі концентрації у сечі. Нирковий кліренс – 79-100 мл/хв. Швидкість екскреції залежить від віку, функції нирок та супутньої патології пацієнта. У хворих з лихоманкою вона збільшується, при зниженні функції нирок та у літніх людей - значно уповільнюється.

Період напіввиведення у дорослих з нормальною функцією нирок становить 2-4 години, у новонароджених – 5-8 годин, у старших дітей – 2,5-4 години. При нирковій недостатності період напіввиведення може досягати 70 годин і більше; при муковісцидозі – 1-2 години.

Кінцева величина періоду напіввиведення – більше 100 годин (звільнення з внутрішньоклітинних депо).

Виводиться при гемодіалізі 50 % за 4-6 годин, перитонеальному діалізі - 25 % за 48-72 години.

### **Фармацевтичні характеристики.**

**Основні фізико-хімічні властивості:** прозорий, від безбарвного до жовтуватого кольору, без запаху розчин.

### **Несумісність.**

Розчин амікацину сульфату не слід безпосередньо змішувати з іншими аміноглікозидами, з пеніцилінами, гепарином, цефалоспоринами, капреоміцином, амфотерицином В, тіопенталом, гідрохлоротіазидом, еритроміцином, нітрофурантоїном, вітамінами групи В та С, калію хлоридом. При необхідності два препарати вводять окремо, послідовно.

**Термін придатності.** 3 роки.

**Умови зберігання.** Зберігати в темному, недоступному для дітей місці при температурі від 15 до 25 °С. Не допускати заморозування!

**Упаковка.** Ампули по 2 мл, що містять 100 мг або 500 мг амікацину у вигляді амікацину сульфату, вкладені у картонну коробку по 10 ампул.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** Ексір Фармасьютикал Ко., Іран.

**Місцезнаходження.** 2-ий км Рінг Роуд, Боруджерд 69189, Іран.

**Дата останнього перегляду.**

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє та достовірно  
відомими даними щодо застосування  
лікарського засобу