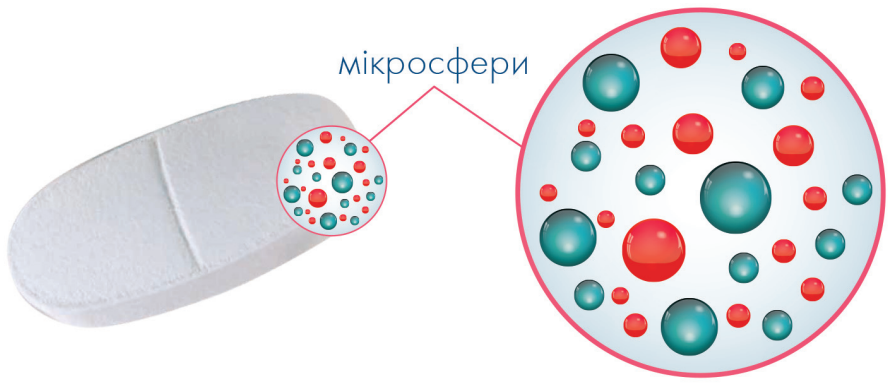
САНДОЗ – світовий лідер у виробництві антибіотиків*

ДИСПЕРГОВАНІ ТАБЛЕТКИ

Особливості лікарської форми:



ЕФЕКТИВНІСТЬ

Висока біодоступність препарату[1, 2]

БЕЗПЕКА

Мінімізація небажаних реакцій за рахунок максимально повного всмоктування препарату в тонкому кишечнику[3]

ЗРУЧНІСТЬ ПРИЙОМУ

Можливість розчинити таблетку та вжити у вигляді розчину[2]

Амоксиклав® Квіктаб
амоксицилін+клавуланова кислота

Оспамокс ДТ
амоксицилін 500мг №12, 1000мг №12

ЄВРОПЕЙСЬКА ЯКІСТЬ

1. HU Guoxin, Journal of Huazhong University of Science and Technolog, 22 (3): 224-227, 2002. 2. Інструкція для медичного застосування препарату. 3. І. О. Гучєв, Р. С. Козлов. Безпечність і ефективність різних лікарських форм амоксициліну клавуланової кислоти при ІНДШ у дорослих: відкрите проспективне рандомізоване дослідження //Пульмонологія. — 2008. — №2.
*www.sandoz.com
РП МОЗ України: АМОКСИКЛАВ® КВІКТАБ UA/3011/04/02, UA/3011/04/01. РП МОЗ України: ОСПАМОКС ДТ UA/3975/04/01, UA/3975/04/03
Відпускається за рецептом. Інформація для спеціалістів охорони здоров'я. Лікарські засоби мають побічні реакції. Для докладної інформації дивись інструкцію для медичного застосування препарату. Ви можете повідомити про побічні реакції та/або відсутність ефективності лікарського засобу представнику заявника за адресою або телефоном: вул. Амосова, 12, м. Київ, 03680, тел. +380 (44) 495-28-66. www.sandoz.ua
4-36-АИГ-РЕЦ-1215

SANDOZ
a Novartis company

Как повысить эффективность и безопасность антибиотикотерапии инфекций дыхательных путей?

Л.В. Юдина

Все реже и реже ученые радуют медицинское сообщество известиями о появлении инновационных лекарственных молекул. Дефицит новых антибактериальных средств, умноженный на возрастающую проблему резистентности патогенов, вынуждает трактовать ситуацию как довольно драматичную. Вместе с тем частота неоправданного применения антибиотиков уверенно растет, и не последнюю роль в этом играют необоснованные предписания с целью лечения респираторных инфекций.

О том, когда, кому и как следует назначать антибактериальные препараты (АБП), и возможных точках приложения их диспергируемых форм мы беседовали с **доцентом кафедры фтизиатрии и пульмонологии Национальной медицинской академии последипломного образования им. П.Л. Шупика (г. Киев), кандидатом медицинских наук Людмилой Владимировной Юдиной.**

? Невозможно выбрать правильный путь, не зная конечной цели. Говоря о рациональности назначения того или иного АБП, врачи в первую очередь подразумевают активность в отношении предполагаемых возбудителей. Какие микроорганизмы наиболее часто провоцируют возникновение бактериальных инфекций дыхательных путей?

– К основным бактериальным патогенам, «специализирующимся» в области респираторных инфекций, относят пневмококк (*Streptococcus pneumoniae*), гемофильную палочку (*Haemophilus influenzae*), лидирующие в рейтинге причин отита и синусита бактериальной этиологии, а также *Moraxella catarrhalis* и *Streptococcus pyogenes.*

Острый бронхит имеет бактериальную природу менее чем в 10% случаев: в 45% случаев выявляются типичные возбудители (*S. pneumoniae*, *H. influenzae*, *M. catarrhalis*, *Staphylococcus aureus)*; в 25% – атипичные патогены (*Mycoplasma pneumoniae*, *Chlamydophila pneumoniae*, *Bordetella pertussis)*.

При остром бактериальном тонзиллофарингите и его осложнениях ключевую роль играет β-гемолитический стрептококк группы А (БГСА) – *S. pyogenes.*

Что касается негоспитальной пневмонии (НП), во всех клинических группах сохраняет актуальность *S. pneumoniae.* У лиц пожилого и старческого возраста, страдающих данным заболеванием, курильщиков и пациентов с хроническим обструктивным заболеванием легких (ХОЗЛ) часто обнаруживают *H. influenzae* (включая штаммы, продуцирующие β-лактамазы), *M. catarrhalis*, *M. pneumoniae*, *C. pneumoniae*, *S. aureus*, *Enterobacteriaceae spp.*

? В настоящее время крайне актуальна стратегия разумного назначения АБП, суть которой можно отразить в двух положениях: использовать антибиотики при наличии подтвержденных показаний и действовать в рамках протоколов, учитывающих локальную резистентность. Какие средства оптимальны в качестве стартовой терапии?

– АБП показаны при бактериальных инфекциях верхних и нижних дыхательных путей, это обязательный компонент схем лечения НП.

Подавляющее большинство респираторных патогенов демонстрируют высокую чувствительность к амоксициллину, что предопределяет его ведущую роль как АБП первой линии.

При инфекциях, вызванных штаммами *H. influenzae*, *M. catarrhalis*, продуцирующими β-лактамазы, на первый план выходит назначение защищенных аминопенициллинов (в частности, амоксициллина/клавулановой кислоты).

? Амоксициллин – бесспорный лидер среди антибактериальных средств в лечении инфекций дыхательных путей в целом и в амбулаторном ведении нетяжелой НП в частности. Чем объясняются столь высокая популярность и широкая известность данного препарата?

– Полусинтетический пенициллин амоксициллин стал лидером продаж среди рецептурных лекарственных препаратов в США еще в начале 90-х г. XX века. В списке его многочисленных достоинств – бактерицидная активность в отношении ряда клинически значимых патогенов, низкая токсичность и доступная стоимость. Механизм действия амоксициллина заключается в его способности нарушать синтез пептидогликана – основного компонента клеточной мембраны микроорганизмов – путем влияния на пенициллинсвязывающие белки, участвующие в завершающей стадии синтеза пептидогликана. За счет разрушения структуры клеточной стенки наступает гибель бактерий.

В то же время в связи с отсутствием пептидогликана и пенициллинсвязывающих белков в организме млекопитающих препарат не оказывает системного токсического действия.

При пероральном применении амоксициллин быстро абсорбируется в тонком кишечнике, а его абсолютная биодоступность колеблется в пределах от 75 до 90% (в зависимости от принятой дозы). В настоящее время указанный АБП используется в качестве средства первой линии терапии респираторных инфекций бактериальной этиологии.

? Казалось бы, обеспечить результативность АБТ респираторных инфекций довольно просто: достаточно выбрать препарат в соответствии с согласительными документами и назначить его в адекватной дозе. Почему же желаемый результат достигается далеко не всегда?

– Увы, есть и «подводные камни». Считается, что пероральные формы амоксициллина (таблетки, капсулы) обладают не только преимуществами, но и определенными недостатками. Что именно имеется ввиду? Это, во-первых, значительная вариабельность абсорбции (неравномерное всасывание лекарственного средства), в связи с чем при приеме таблетированных форм, покрытых пленочной оболочкой, в организме пациента «полезно работает» не более 70% амоксициллина; во-вторых, риск раздражения слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта, который реализуется в виде диспептических расстройств.

Значительно недооценены клиницистами трудности, ассоциированные с глотанием таблеток.

! Ученые из департамента клинической фармакологии и фармакоэпидемиологии Университета Гейдельберга (Германия) под руководством J.T. Schiele оценили частоту встречаемости трудностей при глотании твердых пероральных лекарственных форм среди пациентов, ведением которых занимаются врачи общей практики, и изучили причины данного явления. В ходе анкетирования (n=1051) 37,4% участников сообщили, что испытывают сложности при глотании таблеток и капсул. Чаще подобные проблемы возникали у женщин, пациентов молодого возраста, больных, имеющих дисфагию и/или психические нарушения.

Нетрудно догадаться, что в таких случаях делают больные. Как правило, для облегчения проглатывания дробят таблетки на части или измельчают в порошок. То же самое происходит при приеме капсул: большинство людей просто открывают их и употребляют без оболочки.

Следует помнить, что в отношении АБП нарушение целостности лекарственной формы является недопустимым! В отчете PSA QLD Pharmacy Research Trust указано, что измельчение и дробление таблеток и капсул делает их непригодными для лечения, сопряжено с изменением/потерей присущих им фармакологических свойств и резко повышает потенциальную опасность использования. Терапевтический эффект препарата после бессмысленной и беспощадной механической обработки становится неожиданным для всех участников процесса: клинициста, больного и производителя. Кроме того, не исключен риск вдыхания содержимого капсул или проглатывания кусочков таблетки, что ассоциируется с угрозой их попадания в трахею или пищевод и последующей травматизацией слизистых оболочек.

? Очевидно, что побочные эффекты (как, например, диспепсия, диарея) и дискомфорт при приеме АБП совершенно не способствуют повышению комплайенса. Существуют ли простые способы минимизировать негативные явления, ассоциированные с приемом амоксициллина и амоксициллина/клавуланата?

– Среди широкого ассортимента пероральных форм амоксициллина и амоксициллина/клавуланата особое внимание клиницистов привлекают диспергируемые таблетки Оспамокс ДТ и Амоксиклав® Квиктаб компанией «Сандоз». Принципиальное отличие диспергируемых форм – заключение активного вещества в микросферы, что защищает их от неблагоприятного воздействия желудочного сока. Отсроченное во времени попадание воды в каждую микрочастицу замедляет высвобождение действующего вещества в желудке и обеспечивает его доставку в зону «окна абсорбции» – двенадцатиперстную кишку и верхний отдел тощей кишки. Щелочная среда последних способствует высвобождению активного вещества из микросфер.

Более полное и предсказуемое всасывание действующего вещества гарантирует высокую эффективность АБП и улучшает его переносимость (благодаря уменьшению остаточной концентрации в кишечнике влияние на микрофлору желудочно-кишечного тракта и раздражающее действие на слизистую оболочку кишечника минимальны). С клинической точки зрения это реализуется снижением частоты возникновения диареи и диспепсических расстройств.

По данным В.Ф. Жерносек (2009 р.), биодоступность амоксициллина в форме диспергируемых таблеток значительно выше (93-94%), чем таковая ампициллина (50%) и амоксициллина в капсулах (70%), не зависит от способа приема препарата (проглатывание целиком или растворение в воде перед употреблением). Благодаря высокой биодоступности Оспамокса ДТ удается создавать в крови уровни амоксициллина, близкие к таковым при парентеральном введении, что обеспечивает высокую и прогнозируемую концентрацию препарата в очаге инфекции.

Амоксиклав® Квиктаб – диспергируемая форма амоксициллина/клавуланата – более мощный «игрок». Он широко используется в борьбе с *H. influenzae* и *M. catarrhalis*, продуцирующими β-лактамазы, в отношении которых амоксициллин недостаточно эффективен. Это особенно актуально при лечении пациентов с факторами риска развития антибиотикорезистентности, больных НП в стационарных условиях или инфекционным обострением ХОЗЛ, при необходимости назначения ступенчатой терапии.

Амоксиклав® Квиктаб содержит дозу действующего вещества, эквивалентную обычной таблетированной форме амоксициллина/клавуланата (т. е. не уступает ему в эффективности), но при этом:

- всасывается быстрее;
- обладает приятным вкусом тропических фруктов;
- более удобен в использовании.

Для получения суспензии достаточно растворить таблетку в 1/2 стакана воды, сока или чая, тщательно перемешать перед приемом. Также можно рассасывать ее в ротовой полости без предварительного растворения. Блистер рассчитан на 2 таблетки, что соответствует суточному приему, выполнен в формате упрощенного доступа.

При высокой эффективности, несомненном удобстве приема и дозирования Оспамокс ДТ и Амоксиклав® Квиктаб («Сандоз») обладают дополнительными плюсами в виде улучшенных фармакокинетических свойств и благоприятного профиля безопасности.

! Частота диареи на фоне приема препарата Амоксиклав® Квиктаб в 3 раза ниже, а побочные эффекты возникают вдвое реже, чем в случае использования обычных таблетированных форм амоксициллина/клавуланата (Гучев И.А., Козлов Р.С., 2008).

? О том, что в отношении АБП «форма имеет значение», неоднократно говорили эксперты, писали специализированные СМИ. У каких категорий пациентов с инфекциями дыхательных путей назначение диспергируемых форм β-лактамов обеспечивает максимальные преимущества?

– В первую очередь, это пациенты с гастроинтестинальной патологией или факторами риска, предрасполагающими к ее появлению; больные, испытывающие трудности при глотании таблеток и капсул; лица, нуждающиеся в переходе на ступенчатую терапию и др.

Хочу напомнить, что оптимальный срок перехода с парентеральной на пероральную терапию – 48-72 ч. Как правило, в качестве следующей ступени назначают пероральную форму используемого антибиотика. Если таковая на фармацевтическом рынке отсутствует, возможно применение антибактериального средства, близкого по структуре и свойствам к парентерально вводимому АБП.

! Биодоступность препарата Амоксиклав® Квиктаб составляет 95,6% (Guoxin H.U., 2002), что сопоставимо с таковой инъекционных форм амоксициллина/клавуланата.

Кроме того, он является одним из наиболее перспективных препаратов в профилактике появления антибиотикорезистентных штаммов: благодаря стабильной плазменной концентрации клавуланата обеспечивается более быстрая и полная эрадикация патогенов.

Антибиотикотерапию бактериальных инфекций дыхательных путей можно сравнить со спортивным поединком. Удачный старт обеспечивает амоксициллин (Оспамокс ДТ), разрешенный к применению на всех этапах жизни, а при тяжелом течении инфекций в «игру» вступает амоксициллин/клавуланат (Амоксиклав® Квиктаб).

Использование диспергируемых форм этих АБП – отличный способ повысить приверженность больных к терапии и, следовательно, их шансы на победу в противостоянии с болезнями.

Подготовила ***Ольга Радучич***

4–38–АИГ-РЕЦ–1215