

Амоксициллин / сульбактам — новый представитель ингибиторозащищенных бета-лактамов

Р.С. Козлов, А.В. Веселов

НИИ антимикробной химиотерапии, Смоленская государственная медицинская академия Федерального агентства по здравоохранению и социальному развитию, Россия

ФАРМАКОЛОГИЯ И ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА.

Амоксициллин/сульбактам представляет собой комбинацию из амоксициллина и ингибитора бета-лактамаз сульбактама. **АМОКСИЦИЛЛИН** является полусинтетическим пенициллином с расширенным спектром активности из группы аминопенициллинов. Амоксициллин близок по клинико-фармакологическим свойствам к ампициллину, однако имеет ряд особенностей. Кардинальными отличиями амоксициллина от ампициллина являются:

- более высокая биодоступность при приеме внутрь (до 95%);
- более высокие и стабильные концентрации в крови и других биологических жидкостях;
- более высокая активность в отношении *Streptococcus pneumoniae* и *Helicobacter pylori* [10].

СУЛЬБАКТАМ — полусинтетическое производное пеницилловой кислоты. Является необратимым ингибитором и по своим характеристикам удовлетворяет условиям «идеального» ингибитора бета-лактамаз:

- высокая стабильность и активность в жидких средах;
- возможность применения как внутрь, так и парентерально (внутримышечно и внутривенно);
- хорошее проникновение в ткани организма;
- не индуцирует выработку бета-лактамаз;
- проявляет самостоятельную бактерицидную активность в отношении *Neisseria gonorrhoeae* и *Acinetobacter spp.* [8].

В отличие от клавуланата сульбактам более стабилен в водном растворе, обладает самостоятельной антибактериальной активностью и более устойчив к действию большинства плазмидных бета-лактамаз. Сульбактам воздействует на бета-лактамазы II–IV классов, вызывая их необратимую блокаду [8].

АМОКСИЦИЛЛИН/СУЛЬБАКТАМ. Присутствие ингибитора бета-лактамаз обуславливает активность препарата в отношении штаммов, продуцирующих данные ферменты. Наибольший синергизм действия отмечается в отношении штаммов, у которых продукция бета-лактамаз является основным механизмом формирования резистентности — *Staphylococcus aureus*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Bacteroides fragilis*.

ФАРМАКОКИНЕТИКА. Амоксициллин быстро и почти полностью (до 95%) абсорбируется при приеме внутрь. Прием пищи не влияет на полноту и скорость абсорбции. Фармакокинетические параметры сульбактама аналогичны таковым амоксициллина, в связи с чем их совместное применение не оказывает отрицательного влияния на фармакокинетику препарата в целом. Проводились сравнительные исследования фармакокинетики комбинаций аминопенициллинов с ингибиторами бета-лактамаз. В эквивалентных дозах комбинации, содержащие амоксициллин, создают более высокие плазменные концентрации, нежели препараты на основе ампициллина, что является ключевым фактором для реализации бактерицидного эффекта аминопенициллинов [20].

Клинические исследования

При лечении наиболее часто встречающихся амбулаторных инфекций, в частности в ситуациях, когда имеет место проблема резистентности, амоксициллин/сульбактам демонстрирует клиническую эффективность, достигающую 95% [21].

РЕСПИРАТОРНЫЕ ИНФЕКЦИИ. Амоксициллин/сульбактам продемонстрировал клиническую эффективность у пациентов с обострением хронического бронхита (94%) [24]. Амоксициллин/сульбактам к настоящему времени прошел несколько клинических исследований у пациентов с пневмонией, включая как взрослых, так и детей, с высокими показателями клинической эффективности (97%) [26–28].

Эффективность амоксициллина/сульбактама была также показана в клинических исследованиях при остром синусите (92,5–100%) [31].

БЕЗОПАСНОСТЬ. Нежелательные явления при использовании амоксициллина/сульбактама и профиль переносимости этого препарата в целом были оценены в метаанализе, который включил в себя данные более 30 клинических, *in vitro* и *in vivo* исследований. Всего в анализ были включены 1294 пациента. Только у 9,8% (127) больных были зарегистрированы нежелательные явления, среди которых наиболее частыми были диарея, тошнота, рвота, абдоминальный дискомфорт и кожная сыпь. Только в 1% (13) случаев потребовалась отмена терапии в связи с нежелательными лекарственными реакциями при применении амоксициллина/сульбактама [23].

ЗАКЛЮЧЕНИЕ. Большое число клинических исследований подтвердило, что амоксициллин/сульбактам является эффективным препаратом при лечении инфекций дыхательной системы, мочевыводящих путей, инфекций акушерско-гинекологического профиля, кожи и мягких тканей и др. Эффективность препарата доказана как при применении у взрослых, так и у детей разных возрастных групп. Широкий спектр антимикробной активности амоксициллина/сульбактама и наличие разных фармацевтических форм не исключают использование этого препарата в качестве антибиотика выбора по ряду показаний. Другим важнейшим аспектом является хороший профиль переносимости амоксициллина/сульбактама, включая его использование у детей и беременных. Хотелось бы подчеркнуть, что в эпоху антибиотикорезистентности бактерий исключительно важным является наличие в арсенале практического врача препарата, способного преодолеть лекарственную устойчивость большинства клинических штаммов при высоких показателях клинической эффективности и хорошей переносимости препарата у разных категорий пациентов. Этим условиям в полной мере отвечает амоксициллин/сульбактам — новый представитель ингибиторозащищенных бета-лактамов.

Список использованной литературы находится в редакции

ТРИФАМОКС ИБЛ®

амоксициллин + сульбактам (ингибитор бета-лактамаз: ИБЛ)

Препарат выбора для лечения

- ▶ инфекций ЛОР органов;
- ▶ инфекций верхних и нижних дыхательных путей;
- ▶ инфекций кожи и мягких тканей;
- ▶ инфекций мочеполовой системы и органов малого таза;
- ▶ инфекций мочевыводящих путей;
- ▶ инфекций желчевыводящих путей;

и профилактики инфекционных осложнений при хирургических вмешательствах.

Вершина мастерства в единстве партнеров

Представительство компании "Би-Си ФАРМА Б.В." (Нидерланды)
119435, г. Москва, ул. Малая Пироговская, д.16, офис 61. Тел./факс: +7(495) 648-39-47.
www.bcpharma-bv.ru
E-mail: pmd@bago.ru