

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
М А К Р О Т У С И Н
(Macrotussin)

Загальна характеристика:

основні фізико-хімічні властивості: препарат після перемішування є суспензією жовтого або жовто-оранжевого кольору зі специфічним запахом;

склад: 5 мл суспензії містять 125 мг еритроміцину стеарату в перерахуванні на еритроміцин і 75 мг гуайфенезину;

допоміжні речовини: натрій карбоксиметилцелюлоза, ароматизатор харчовий фруктовий, метилпарагідроксibenзоат, тартазин або барвник євросерт «Сонячний захід», натрію сахаринат, цукор, вода очищена.

Форма випуску. Суспензія для орального застосування.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при кашлі та застудних захворюваннях. Код АТС R05CA10.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Комбінований препарат, дія якого обумовлена ефектами компонентів, що входять до його складу. Еритроміцин належить до антибіотиків із групи макролідів. Механізм дії обумовлений уповільненням біосинтезу білків чутливих до нього мікроорганізмів внаслідок зв'язування з 50S-субодинаміями рибосом, що призводить до сповільнення росту та розмноження бактерій. Еритроміцин виявляє бактеріостатичну дію. Спектр антибактеріальної дії включає: *Streptococcus spp.*, *Staphylococcus spp.*, в тому числі штами, що продукують пеніциліназу, крім MRSA-штамів, *Corynebacterium diphtheriae*, *Listeria monocytogenes*, *Clostridium spp.*, *Bordetella spp.*, *Legionella spp.*, *Neisseria spp.*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *C.jejuni*. Еритроміцин також виявляє високу активність щодо внутрішньоклітинних збудників, в тому числі *Mycoplasma spp.*, *Treponema pallidum*, *Chlamydia spp.*, *Rickettsia spp.* Еритроміцин не діє на грамнегативні палички (*E.coli*, *Pseudomonas spp.*, *Shigella spp.* тощо).

Гуайфенезин належить до відхаркувальних засобів. Стимулює секрецію компонентів бронхіального слизу з низькою в'язкістю, деполімеризує кислі мукополісахариди й підвищує активність війок миготливого епітелію дихальних шляхів. Зменшує поверхневий натяг і адгезивні властивості мокротиння, що знижує його в'язкість і полегшує евакуацію з дихальних шляхів. Може виявляти легку седативну дію.

Фармакокінетика. Після застосування внутрішньо еритроміцину стеарат проходить через шлунок у дванадцятипалу кишку в незміненому вигляді, при цьому стеариновий залишок захищає основу еритроміцину від дії соляної кислоти. У дванадцятипалій кишці еритроміцину стеарат гідролізується з утворенням основи еритроміцину та стеаринової кислоти. Всмоктується еритроміцин у кишечнику. Системна біодоступність еритроміцину під час застосування еритроміцину стеарату вища, ніж під час застосування еритроміцину основи, пікова концентрація у крові еритроміцину складає 2,4 мкг/мл після прийому 500 мг, час досягнення пікової концентрації становить 2-4 год. Період напіввиведення еритроміцину становить 1,9-2,4 год, при цьому терапевтичні концентрації у крові утримуються протягом 6-8 годин. Еритроміцин на 40-90 % зв'язується з α_1 -глікопротеїнами плазми крові. Препарат добре проникає у всі органи і тканини організму, крім тканин ЦНС. Для еритроміцину, як і для інших макролідних антибіотиків, характерний високий ступінь внутрішньоклітинного проникнення, при цьому концентрація антибіотика всередині клітини може перевищувати плазмову в 4-24 рази. Еритроміцин частково метаболізується в печінці шляхом N-деметилування. Виводиться переважно з жовчю, із сечею в незміненому вигляді виводиться лише 2,5-4,5 % препарату. Еритроміцин проникає через плацентарний бар'єр, але його концентрація в плазмі крові плода дуже низька, активно екскретується з материнським молоком, концентрація антибіотика в молоці може перевищувати

плазмому в 5 разів.

Гуайфенезин швидко (через 30 хв) абсорбується зі шлунково-кишкового тракту. Переважно проникає в тканини, що містять кислі мукополісахариди. Після перорального введення максимальна концентрація досягається через 1–2 год, а терапевтична концентрація зберігається протягом 6 год. Період напіввиведення гуайфенезину становить близько 1 год. Екскретується з мокротинням та виводиться нирками у вигляді метаболітів, а також у незміненому стані. Може забарвлювати сечу в рожевий колір.

Показання для застосування. Інфекційно-запальні захворювання органів дихання, що спричинені чутливими до еритроміцину мікроорганізмами і супроводжуються кашлем: гострий ларингіт, трахеїт, бронхіт, пневмонія, загострення хронічного бронхіту та інфекційне загострення хронічного обструктивного захворювання легень, інфекційні ускладнення при муковісцидозі, дифтерія (також для санації бактеріоносіїв), коклюш та паракоклюш; гнійний синусит, санація носіїв *B. pertussis*.

Спосіб застосування та дози. Перед кожним застосуванням суспензію Макротусину необхідно ретельно збовтати. Макротусин необхідно застосовувати не раніше, ніж за 30 хв. до прийому їжі або через 2 год після прийому їжі. Доза препарату встановлюється відповідно до віку і тяжкості стану хворого. Макротусин приймають 4 рази на добу. Дозування препарату здійснюють за допомогою мірної ложки, вкладеної в упаковку. При легкому та помірної тяжкості перебігу захворювання разова доза складає:

Вік, років	Доза препарату, мл	Спосіб дозування
2-3	7,5	1,5 мірні ложки
4-6	10	2 мірні ложки
7-8	12,5	2,5 мірні ложки
9 і старші, дорослі	15	3 мірні ложки

Середня тривалість курсу лікування становить від 7 до 10 днів. Корекція дозування препарату при нирковій недостатності не проводиться, при тяжких порушеннях функції печінки дозу необхідно зменшити.

Побічна дія. У поодиноких випадках, як правило, при перевищенні рекомендованих доз, можуть спостерігатися нудота, блювання, біль у животі, пронос, порушення функції печінки у вигляді підвищення рівня сироваткових трансаміназ. У хворих із гіперчутливістю до макролідних антибіотиків та гуайфенезину можливий розвиток алергічних реакцій. У поодиноких випадках при застосуванні Макротусину, як і інших макролідів, можливий розвиток тяжких реакцій гіперчутливості, у тому числі ангіоневротичного набряку та анафілактичного шоку. У такому разі необхідно призначити адреналін та глюкокортикоїди, внутрішньовенну інфузію рідини, забезпечити прохідність дихальних шляхів.

Протипоказання. Підвищена чутливість до еритроміцину, гуайфенезину та інших компонентів препарату, вік до 2 років, вроджені та набуті синдроми подовженого інтервалу QT на ЕКГ.

Передозування. Можливий розвиток нудоти, блювання, проносу, які усуваються після відміни препарату, а також транзиторне зниження слуху, порушення серцевого ритму. Специфічного антидоту немає, лікування симптоматичне. Еритроміцин не видаляється з організму при гемодіалізі чи перитонеальному діалізі.

Особливості застосування. Не слід перевищувати рекомендовані дози препарату. Через високий вміст сахарози препарат слід з обережністю застосовувати особам, котрі хворіють на цукровий діабет. Не рекомендується запивати суспензію молоком і молочними продуктами, а також фруктовими соками або кислими напоями. Препарат з обережністю призначають особам із порушенням функції

печінки.

Застосування в період вагітності та годування груддю. Препарат призначають вагітним жінкам тільки тоді, коли наявна користь для матері перевищує потенційний ризик для плода. При застосуванні в період лактації годування груддю необхідно припинити на весь термін лікування Макротусином.

Вплив на здатність керувати автомобілем та роботу з механізмами. У терапевтичних дозах препарат не впливає на здатність керувати транспортними засобами та працювати з механізмами, що рухаються.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Макротусин не слід застосовувати одночасно з іматинібом, колхіцином, інгібіторами ГМГ-КоА-редуктази (статинами), циклоспорином, похідними ерготаміну через сповільнення печінкового метаболізму вищевказаних лікарських засобів, що спричиняє різке підвищення їх плазмової концентрації та токсичної дії. Також не слід застосовувати Макротусин одночасно з антиаритмічними препаратами ІА та ІІІ класу, терфенадином, астемізолом, цизапридом, пімозидом, фторхінолоновими антибактеріальними засобами через ще більше подовження інтервалу QT на ЕКГ, що може спричинити шлуночкову тахікардію torsades de pointes та смерть. Не можна поєднувати лікування Макротусином із інгібіторами зворотнього захоплення серотоніну (пароксетин, флуоксетин, сертралін) внаслідок значного збільшення плазмової концентрації останніх, що може призвести до розвитку серотонінового синдрому. З обережністю призначають Макротусин хворим, які застосовують глікозиди наперстянки, пероральні антикоагулянти, карбамазепін, буспірон, клозапін, вальпроати, похідні бензодіазепіну, міфепристон, фелодипін, ісрадипін, нікардипін, похідні ксантину, в тому числі теофілін, а також силденафіл через збільшення плазмової концентрації останніх. Якщо такі комбінації є необхідними, то дозу лікарського засобу відповідно зменшують, а лікування проводять, контролюючи плазмову концентрацію. У лабораторних умовах доведено існування антагонізму між еритроміцином, лінкоміцином і кліндамицином, тому ці препарати не слід застосовувати одночасно. Наповнювач препарату, тартазин, може спричинити алергічні реакції в осіб із непереносимістю ацетилсаліцилової кислоти.

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі від +15⁰С до +25⁰С. Зберігати в недоступному для дітей місці. Термін придатності – 2 роки. Кінцевий термін придатності зазначений на упаковці після слів: «Використати до...»

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Флакони по 120 мл та 180 мл.

Виробник. Спільне українсько-іспанське підприємство "Сперко Україна".

Адреса. 21027, Україна, м. Вінниця, вул. 600-річчя, 25.

Тел. + 38(0432)52-30-36. E-mail: trade@sperco.com.ua