

vào mức độ nặng và đáp ứng với thuốc, nhưng thường là 3 - 12 tuần với tổng liều 1 - 3 g. Leishmania nội tạng ở trẻ em và người lớn: 0,5 - 1 mg/kg/liều, dùng cách ngày 1 lần với 14 - 20 liều. Điều trị viêm màng não do *Naegleria fowleri*: Người lớn và trẻ em 1 mg/kg/ngày. Chưa xác định được thời gian điều trị.

Amphotericin B dạng thông thường có thể dùng đường uống để điều trị *Candida* quanh miệng hoặc đường tiêu hóa. Liều 100 - 200 mg/lần, 4 lần/ngày. Thuốc nên được giữ tại miệng lâu nhất có thể trước khi nuốt.

Phối hợp amphotericin B cholesteryl sulfat (Amphotec):

Trước khi truyền thuốc, cần truyền liều thử 2 mg trong 20 - 30 phút, theo dõi chặt chẽ bệnh nhân trong vòng 30 phút sau đó.

Người lớn và trẻ em (nấm *Aspergillus*): 3 - 4 mg/kg/lần, ngày 1 lần, liều lên tới 6 mg/kg/ngày có thể dùng trong trường hợp nặng. Nấm *Candida* hoặc *Cryptococcus* lan tỏa: 3 - 6 mg/kg/ngày. Bệnh Leishmania nội tạng: 2 mg/kg/lần, ngày 1 lần trong 7 - 10 ngày.

Phối hợp amphotericin B lipid (Abelcet): Trước khi truyền thuốc, cần truyền liều thử 1 mg trong 15 phút, theo dõi chặt chẽ bệnh nhân trong 30 phút sau đó. Người lớn và trẻ em 5 mg/kg/ngày. Thời gian trung bình điều trị nấm *Aspergillus* là 25 ngày. Người nhiễm HIV bị viêm màng não do *Cryptococcus* 5 mg/kg/lần, ngày 1 lần trong 6 tuần, tiếp theo 12 tuần uống fluconazol. Bệnh Leishmania nội tạng: 1 - 3 mg/kg/lần, ngày 1 lần trong 5 ngày.

Amphotericin B dạng liposom (AmBisome): Người lớn và trẻ em ≥ 1 tháng tuổi (*Aspergillus*, *Candida* hoặc *Cryptococcus*), liều thông thường 5 mg/kg/lần, ngày 1 lần. Thời gian điều trị 15 - 29 ngày, thời gian điều trị trung bình 5 - 7 ngày. Viêm màng não do *Cryptococcus* ở người nhiễm HIV: 6 mg/kg/lần, ngày 1 lần. Điều trị theo kinh nghiệm khi nghi ngờ có nhiễm nấm ở người bệnh có sốt và giảm bạch cầu trung tính: 3 mg/kg/lần, ngày 1 lần. Thời gian điều trị trung bình khoảng 10,8 ngày. Có thể ngừng điều trị nếu sau 2 tuần không phát hiện được tổn thương rõ ràng (âm sàng, X-quang phổi, CT các cơ quan ổ bụng). Bệnh Leishmania nội tạng ở người lớn và trẻ em ≥ 1 tuổi đáp ứng miễn dịch tốt: 3 mg/kg/lần, ngày 1 lần vào các ngày 1 và 5 và các ngày 14 và 21. Một liệu trình thứ hai có thể có ích nếu nhiễm nấm chưa hết sau đợt điều trị duy nhất. Người suy giảm miễn dịch: 4 mg/kg/lần, ngày 1 lần vào các ngày 1 và 5 và các ngày 10, 17, 24, 31 và 38. Tuy vậy, nếu bệnh Leishmania không hoàn toàn dứt điểm hoặc tái phát lại, có thể tham khảo ý kiến chuyên gia để điều trị thêm.

Tương tác thuốc

Thuốc gây độc thận (aminoglycosid, capreomycin, colistin, cisplatin, cyclosporin, methoxyfluran, pentamidin, polymyxin B, vancomycin) phải tránh dùng đồng thời với amphotericin B. Amphotericin B làm giảm kali huyết, dùng đồng thời với glycosid trợ tim sẽ làm tăng độc trên tim; amphotericin B cũng làm tăng tác dụng giãn cơ của các thuốc giãn cơ (tubocurarin).

Thuốc chống nấm: Flucytosin và amphotericin B có tác dụng hiệp đồng ức chế một số nấm, nhưng có thể làm tăng độc tính của flucytosin do tăng hấp thụ tại chỗ của tế bào và/hoặc làm giảm bài tiết thuốc qua thận. Nếu dùng đồng thời 2 thuốc đó ở người nhiễm HIV, phải đo nồng độ flucytosin huyết thanh và đếm tế bào máu. Ngoài ra, liều khởi đầu flucytosin phải thấp (75 - 100 mg/kg/ngày), và điều chỉnh liều về sau dựa theo nồng độ trong huyết thanh của flucytosin. Imidazol và triazol về lý thuyết có tác dụng đối kháng với amphotericin B khi dùng đồng thời, tuy nhiên chưa rõ *in vivo* có đối kháng không. Phải thận trọng khi dùng đồng thời, nhất là ở người bị suy giảm miễn dịch.

Quinolon: Norfloxacin có thể làm tăng tác dụng chống nấm của amphotericin B. Tuy nhiên cần phải nghiên cứu thêm.

Rifabutin: *In vitro*, rifabutin không có tác dụng chống nấm

Aspergillus hoặc *Fusarium* nhưng khi phối hợp với amphotericin B, có tác dụng chống nấm rõ rệt.

Zidovudin: Dùng phối hợp 2 thuốc này trên chó trong 30 ngày thấy tăng độc tính đối với tủy và thận. Tuy chưa rõ trên người, khi phối hợp 2 thuốc này phải thận trọng, giám sát chặt chẽ chức năng thận và huyết học.

Thuốc chống ung thư (như meclorethamin) có thể làm tăng độc tính cho thận, co thắt phế quản và hạ huyết áp ở người bệnh dùng đồng thời với amphotericin B.

Corticosteroid có thể làm tăng mất kali trong cơ thể khi dùng phối hợp với amphotericin B thông thường; tác dụng ức chế miễn dịch của corticosteroid có thể làm nặng thêm tình trạng nhiễm nấm nặng nên không được phối hợp, trừ khi cần thiết để điều trị các ADR của amphotericin B. Nếu phải phối hợp corticosteroid với bất cứ chế phẩm nào của amphotericin B, phải theo dõi sát chức năng tim và điện giải huyết thanh.

Truyền bạch cầu: Phản ứng phổi (khó thở cấp, thở gấp, giảm oxy máu, ho ra máu và thâm nhiễm tổ chức kẽ lan tỏa) đã được báo cáo khi dùng amphotericin B trong vòng 4 giờ đầu sau khi truyền bạch cầu, đặc biệt ở người nhiễm khuẩn huyết vi khuẩn Gram âm.

Tương kỵ

Không hoàn nguyên bột đông khô với dung dịch tiêm dextrose 5% hoặc dung dịch tiêm natri clorid 0,9%. Dung dịch đã hoàn nguyên phải pha loãng với dung dịch tiêm dextrose 5%; không được pha với dung dịch tiêm natri clorid 0,9%, các dung dịch có chứa điện giải, chất kim khuẩn. Không pha lẫn với các thuốc khác.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Quá liều amphotericin B thông thường có thể gây ngừng tim, ngừng hô hấp. Một số trẻ em dùng quá liều thường có những tai biến về tim mạch như hạ huyết áp, nhịp tim chậm và ngừng tim.

Xử trí: Phải theo dõi chặt chẽ người bệnh để ngừng thuốc, điều trị hỗ trợ triệu chứng. Không loại bỏ amphotericin B bằng thẩm tách máu được. Tình trạng bệnh nhân phải ổn định, bao gồm cả điều chỉnh điện giải huyết thanh trước khi cho điều trị lại.

Cập nhật lần cuối: 2016.

AMPICILIN

Tên chung quốc tế: Ampicillin.

Mã ATC: J01CA01, S01AA19.

Loại thuốc: Kháng sinh nhóm beta-lactam, phân nhóm penicilin A.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nang chứa ampicilin trihydrat tương đương 250 mg hoặc 500 mg ampicilin.

Hỗn dịch uống chứa ampicilin trihydrat tương đương 125 mg ampicilin/5 ml hoặc 250 mg ampicilin/5 ml, lọ 100 ml.

Lọ bột pha tiêm tĩnh mạch hoặc tiêm truyền chứa ampicilin natri tương đương với 125 mg, 250 mg, 500 mg, 1 g, 2 g, 10 g ampicilin.

Dược lực học

Tương tự penicilin, ampicilin tác động vào quá trình nhân lên của vi khuẩn, ức chế sự tổng hợp peptidoglycan của thành tế bào vi khuẩn.

Phổ kháng khuẩn

Ampicilin là một kháng sinh aminopenicillin phổ rộng có tác dụng trên các cầu khuẩn Gram dương (*Streptococcus*, *Pneumococcus* và *Staphylococcus* không sinh penicilinase) và Gram âm (*Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae* và *N. meningitidis*). Tuy nhiên, hiệu quả trên *Streptococcus beta tan* huyết và *Pneumococcus*,

Enterococcus faecalis thấp hơn so với benzyl penicilin. Trực khuẩn Gram dương *Listeria monocytogenes* nhạy cảm cao với ampicilin. Ampicilin có tác dụng tốt hơn benzyl penicilin trên một số trực khuẩn Gram âm như *Haemophilus influenzae* và các vi khuẩn đường ruột như *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Shigella*, *Salmonella*.

Ampicilin không tác dụng trên một số chủng vi khuẩn Gram âm như: *Pseudomonas*, *Klebsiella*, *Proteus*. Thuốc cũng không tác dụng đối với *Mycoplasma*, *Rickettsia*, nấm và virus.

Ampicilin tác dụng tốt trên các vi khuẩn kỵ khí Gram dương như *Actinomyces*, *Clostridium perfringens*, *C.tetani*... nhưng không hiệu quả trên vi khuẩn kỵ khí Gram âm như *Bacteroides*.

Kháng thuốc

Ampicilin bị bất hoạt bởi beta lactamase giống benzyl penicilin, mặc dù một số chủng vi khuẩn kháng ampicilin theo cơ chế khác. Hiện nay, hầu hết các chủng staphylococci và nhiều chủng *E.coli*, *H. influenzae*, *M. catarrhalis*, *N. gonorrhoeae*, *Salmonella* và *Shigella* spp. đều đã kháng với ampicilin.

Được động học

Ampicilin trihydrat tương đối bền với acid dịch vị. Sinh khả dụng đường uống là 30 - 55% khi uống thuốc vào lúc đói, bị giảm bởi thức ăn. Uống liều 0,5 g, sau 2 giờ sẽ có nồng độ đỉnh trong huyết thanh khoảng 3 - 6 mg/lít.

Khi tiêm bắp một liều 500 mg ampicilin natri, sau 1 giờ đạt được nồng độ đỉnh trong huyết thanh là 7 - 14 mg/lít. Sau khi truyền tĩnh mạch 2 g trong 20 phút ở người tình nguyện khỏe mạnh, nồng độ trung bình trong huyết thanh của ampicilin là 47,6; 23,3; 10,8; 3,7 microgam/ml tương ứng sau 30 phút, 1 giờ, 2 giờ, 4 giờ.

Ampicilin phân bố rộng rãi và đạt được nồng độ điều trị trong dịch phúc mạc, dịch màng phổi và dịch khớp. Thuốc khuếch tán qua nhau thai vào tuần hoàn của thai nhi và vào nước ối; phân bố một lượng nhỏ vào sữa mẹ. Ở phụ nữ mang thai, nồng độ ampicilin trong huyết thanh chỉ bằng 50% so với ở người không mang thai, do thuốc có thể tích phân bố lớn hơn nhiều. Ampicilin thấm một lượng rất nhỏ qua hàng rào máu - não. Trong viêm màng não mủ, do hàng rào máu - não bị viêm và thay đổi độ thấm, nên ampicilin thâm nhập vào hệ TKTW đủ để có tác dụng và nồng độ thuốc trong dịch não tủy đạt tới 10 - 35% nồng độ thuốc trong huyết thanh.

Thuốc gắn với protein huyết tương với tỷ lệ thấp: Trẻ sơ sinh 10%, người lớn 15 - 18%. Ampicilin được chuyển hóa một phần thành acid peniciloic, chất này sau đó được thải trừ qua thận. Ampicilin thải trừ qua thận nhờ lọc ở cầu thận và bài tiết ở ống thận, probenecid làm giảm thải trừ thuốc. Khoảng 20 - 40% liều uống được thải trừ ở dạng không đổi trong nước tiểu sau 6 giờ. Sau khi uống liều 500 mg, nồng độ thuốc trong nước tiểu khoảng 0,25 - 1 mg/ml. Sau khi tiêm, khoảng 60 - 80% lượng thuốc được thải trừ qua nước tiểu trong vòng 6 giờ. Ampicilin bị loại 40% khi thẩm phân máu. Thuốc đạt được nồng độ cao trong mật, được tái hấp thu theo chu trình gan - ruột và thải một phần qua phân. Nửa đời thải trừ của thuốc là 0,7 - 1,5 giờ ở người lớn có chức năng thận bình thường, kéo dài hơn ở trẻ sơ sinh, người già, người suy giảm chức năng thận. Ở trẻ sơ sinh 2 - 7 ngày, nửa đời thải trừ là 4 giờ; 8 - 14 ngày, nửa đời là 2,8 giờ; 15 - 30 ngày, nửa đời là 1,7 giờ. Ở người suy thận nặng, nửa đời thải trừ của thuốc là 7 - 20 giờ.

Chỉ định

Viêm đường hô hấp trên do *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus pneumoniae*, *Haemophilus influenzae* không sinh penicilinase. Ampicilin điều trị có hiệu quả các bệnh viêm xoang, viêm tai giữa, đợt cấp của viêm phế quản mạn tính và viêm nắp thanh quản do các chủng vi khuẩn nhạy cảm gây ra.

Viêm màng não do *E.coli*, liên cầu nhóm B và các vi khuẩn gram âm khác như *Listeria monocytogenes*, *N.meningitidis*.

Nhiễm khuẩn đường tiêu hóa do *Shigella*, *Salmonella*, *E.coli*, các chủng cầu khuẩn ruột, nhưng không phải là lựa chọn hàng đầu do phát triển đề kháng. Các chủng *Shigella* thường kháng các loại kháng sinh trong đó có ampicilin. Trong những trường hợp này có thể thay ampicilin bằng cotrimoxazol hoặc ciprofloxacin.

Viêm màng trong tim do enterococcus: Kết hợp với gentamicin trong điều trị và sử dụng đơn độc trong dự phòng trên người bệnh có bệnh lý tim mạch (bệnh thấp tim, suy giảm chức năng van tim, van nhân tạo...) có thực hiện các thủ thuật, phẫu thuật về răng, đường tiêu hóa, đường tiết niệu sinh dục.

Dự phòng nhiễm liên cầu B cho trẻ sơ sinh khi mẹ nhiễm liên cầu B. Điều trị nhiễm khuẩn đường tiết niệu do *E.coli*, *P.mirabilis*.

Chống chỉ định

Người bệnh mẫn cảm với bất kỳ loại penicilin nào.

Thận trọng

Dị ứng chéo giữa các penicilin và cephalosporin. Không được dùng hoặc hết sức thận trọng khi dùng ampicilin cho người đã bị mẫn cảm với cephalosporin.

Khi điều trị kéo dài (hơn 2 - 3 tuần) cần kiểm tra chức năng gan, thận và máu. Tránh dùng với người nhiễm virus Epstein-Barr (bệnh tăng bạch cầu đơn nhân do nhiễm) và HIV do nguy cơ bị ban đỏ tăng cao.

Thời kỳ mang thai

Ampicilin được đánh giá là ít nguy cơ đối với thai nhi.

Thời kỳ cho con bú

Ampicilin vào sữa với một lượng nhỏ và hiếm gây những ADR cho trẻ bú mẹ nếu sử dụng với liều điều trị thông thường. Tuy nhiên cần lưu ý nguy cơ bị tiêu chảy hoặc nhiễm *Candida* ở trẻ bú mẹ.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

Thường gặp

Tiêu hóa: tiêu chảy.

Da: mẩn đỏ (ngoại ban).

Ít gặp

Máu: thiếu máu, giảm tiểu cầu, tăng bạch cầu ưa acid, giảm bạch cầu và mất bạch cầu hạt.

Đường tiêu hóa: viêm lưỡi, viêm miệng, buồn nôn, nôn, viêm đại tràng, viêm đại tràng giả mạc.

Da: mày đay.

Hiếm gặp

Toàn thân: phản ứng phản vệ, viêm da tróc vảy và ban đỏ đa dạng.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Cần tìm hiểu kỹ tiền sử người bệnh có từng bị dị ứng với penicilin, cephalosporin hay các tác nhân dị ứng khác không. Nếu phản ứng dị ứng như mày đay, sốc phản vệ, hội chứng Stevens-Johnson xảy ra, phải ngừng ngay liệu pháp ampicilin và chỉ định điều trị lập tức bằng epinephrin (adrenalin) và không bao giờ được điều trị lại bằng penicilin hoặc cephalosporin nữa.

Liều lượng và cách dùng

Liều dùng ampicilin phụ thuộc vào loại bệnh, mức độ nặng nhẹ, tuổi và chức năng thận của người bệnh. Cần giảm liều ở người suy thận nặng.

Ampicilin thường được uống dưới dạng trihydrat và tiêm dưới dạng muối natri. Liều lượng được tính theo ampicilin. Trong những trường hợp nhiễm khuẩn nặng, cần dùng thuốc theo đường tiêm để đạt được nồng độ cao trong máu.

Người lớn: Liều uống thông thường là 250 - 500 mg mỗi 6 giờ. Liều tiêm bắp, tiêm tĩnh mạch: 1 - 2 g mỗi 4 - 6 giờ, hoặc 50 - 250 mg/kg/ngày chia làm nhiều liều. Tối đa 12 g/ngày.

Điều trị viêm màng trong tim do enterococcus: Dùng liều 12 g/ngày (truyền tĩnh mạch liên tục hoặc chia làm 6 liều tiêm tĩnh mạch), phối hợp với gentamicin (1 mg/kg mỗi 8 giờ, tiêm bắp hoặc tĩnh mạch), thường kéo dài 4 - 6 tuần. Bệnh nhân có dấu hiệu nhiễm khuẩn kéo dài hơn 3 tháng trước khi điều trị hoặc có van tim nhân tạo cần điều trị ít nhất 6 tuần.

Dự phòng nhiễm liên cầu B cho trẻ sơ sinh: 2 g tiêm tĩnh mạch cho người mẹ khi bắt đầu chuyển dạ hoặc sau khi vỡ ối, sau đó cứ mỗi 4 giờ tiêm 1 g cho đến khi em bé chào đời.

Dự phòng viêm màng trong tim ở các bệnh nhân phẫu thuật hoặc thủ thuật có nguy cơ cao hoặc trung bình: Liều duy nhất 2 g, tiêm bắp hoặc tĩnh mạch 30 phút trước khi tiến hành thủ thuật, phẫu thuật.

Điều trị nhiễm khuẩn huyết hoặc viêm màng não: 6 - 12 g hoặc 150 - 200 mg/kg, tiêm làm nhiều lần cách nhau 3 - 4 giờ/lần. Cần tiêm tĩnh mạch ít nhất 3 ngày và sau đó có thể tiêm bắp.

Trẻ em

Trẻ em nặng > 40 kg sử dụng liều như người lớn.

Liều thông thường cho trẻ em theo đường uống là 50 - 100 mg/kg/ngày, chia thành 4 liều cách nhau mỗi 6 giờ (tối đa 2 - 4 g/ngày). Liều tiêm bắp hoặc tĩnh mạch là 25 - 200 mg/kg/ngày, chia thành các liều nhỏ cách nhau 3 - 4 giờ (tối đa 12 g/ngày).

Nhiễm khuẩn đường hô hấp hoặc ngoài da: Trẻ em nặng ≤ 40 kg: 25 - 50 mg/kg/ngày chia đều nhau, cách 6 giờ/lần.

Viêm đường tiết niệu: 50 - 100 mg/kg/ngày, cách 6 giờ/lần.

Nhiễm khuẩn huyết hoặc viêm màng não nhiễm khuẩn: 100 - 200 mg/kg/ngày chia thành nhiều liều nhỏ cách 3 - 4 giờ/lần, bắt đầu bằng tiêm tĩnh mạch trong 3 ngày và tiếp tục bằng tiêm bắp.

Trẻ sơ sinh ≤ 1 tuần tuổi: 25 - 50 mg/kg tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch cách 12 giờ/lần (đối với trẻ cân nặng dưới hay bằng 2 kg thể trọng) hoặc 8 giờ/lần (đối với trẻ trên 2 kg thể trọng).

Trẻ sơ sinh trên 1 tuần tuổi: 25 - 50 mg/kg tiêm bắp hoặc tĩnh mạch, cách 8 giờ/lần (đối với trẻ cân nặng dưới hay bằng 2 kg thể trọng) hoặc 6 giờ/lần (đối với trẻ trên 2 kg thể trọng) để điều trị nhiễm khuẩn ngoài viêm màng não.

Đối với viêm màng não ở trẻ dưới 2 tháng tuổi, liều tĩnh mạch: 100 - 300 mg/kg/ngày chia làm nhiều lần phối hợp với gentamicin tiêm bắp.

Dự phòng viêm màng trong tim: Liều duy nhất 50 mg/kg, 30 phút trước thủ thuật.

Người suy thận: Người lớn có Cl_{cr} 10 - 50 ml/phút dùng liều thông thường, cách mỗi 6 - 12 giờ; Cl_{cr} < 10 ml/phút: dùng liều thông thường, cách mỗi 12 - 16 giờ. Người bệnh chạy thận nhân tạo phải dùng thêm liều ampicilin sau mỗi lần thẩm tách.

Tương tác thuốc

Dùng đồng thời ampicilin và alopurinol làm tăng nguy cơ gặp dị ứng hoặc phản ứng phản vệ.

Probenecid làm giảm thải trừ ampicilin, tương tự như với các penicilin khác, cần thận trọng khi sử dụng đồng thời.

Các kháng sinh kìm khuẩn như cloramphenicol, các tetracyclin, erythromycin làm giảm khả năng diệt khuẩn của ampicilin và amoxicilin.

Ampicilin có thể làm sai lệch kết quả test glucose niệu sử dụng đồng sulphat (như thuốc thử Benedict, Clinitest).

Ampicilin, cũng tương tự như các kháng sinh, làm giảm tác dụng của vắc xin tả, vắc xin BCG, nên tránh dùng đồng thời.

Thức ăn làm giảm tốc độ và mức độ hấp thu ampicilin, do vậy nên uống thuốc cách xa bữa ăn (30 phút trước hoặc 2 giờ sau bữa ăn).

Tương kỵ

Ampicilin natri tương kỵ với aminosid, các tetracyclin, các loại kháng sinh khác bao gồm: amphotericin, clindamycin phosphat,

erythromycin lactobionat, lincomycin hydroclorid, metronidazol và polymyxin B sulfat.

Ampicilin tương kỵ hoặc bị mất hoạt tính do các thuốc: acetylcystein, clorpromazin hydroclorid, dopamin hydroclorid, heparin calci hoặc natri, hydralazin hydroclorid, hydrocortison succinat, metoclopramid, prochlorperazin edisylat, procloperazin mesylat và natri bicarbonat.

Quá liều và xử trí

Chưa có thông báo nào về quá liều. Nếu xảy ra, phải ngừng dùng thuốc và dùng các biện pháp hỗ trợ điều trị triệu chứng.

Cập nhật lần cuối: 2017.

AMPICILIN VÀ SULBACTAM

Tên chung quốc tế: Ampicillin and sulbactam.

Mã ATC: J01CR01.

Loại thuốc: Kháng sinh nhóm beta-lactam (phân nhóm penicilin A) và chất ức chế beta-lactamase.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 375 mg.

Bột vô trùng pha tiêm: 1,5 g hoặc 3 g.

Mỗi dạng thuốc đều chứa ampicilin và sulbactam. Trong dạng uống, ampicilin và sulbactam liên kết với nhau bằng cầu nối methylen, tạo ra sultamicilin. Sultamicilin là một ester oxymethylpenicilinat sulfon của ampicilin. Mỗi viên có chứa dạng muối tosylat tương đương với 375 mg sultamicilin (147 mg sulbactam và 220 mg ampicilin). Dạng tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch chứa sulbactam và ampicilin tương ứng là 500 mg và 1 000 mg (cho ống tiêm 1,5 g) hoặc 1 g và 2 g (cho ống tiêm 3 g).

Dược lực học

Natri ampicilin và natri sulbactam (ampicilin/sulbactam) là một thuốc phối hợp cố định theo tỷ lệ 2 : 1 của ampicilin và sulbactam. Hàm lượng của thuốc được tính theo tổng lượng ampicilin và sulbactam. Mỗi mg hỗn hợp có chứa không ít hơn 563 microgam ampicilin và 280 microgam sulbactam dạng khan.

Ampicilin là kháng sinh bán tổng hợp có phổ tác dụng rộng với hoạt tính kháng khuẩn tác dụng trên nhiều vi khuẩn Gram dương và Gram âm do khả năng ức chế sinh tổng hợp peptidoglycan của thành tế bào vi khuẩn. Tuy vậy, ampicilin bị beta-lactamase phá vỡ vòng beta-lactam, nên bình thường phổ tác dụng không bao gồm các vi khuẩn tạo ra enzym này.

Sulbactam là một acid sulfon penicilamic, chất ức chế không thuận nghịch beta-lactamase. Sulbactam chỉ có hoạt tính kháng khuẩn yếu khi sử dụng đơn độc. Sulbactam có hoạt tính ức chế tốt cả 2 loại beta-lactamase qua trung gian plasmid và nhiễm sắc thể.

Do sulbactam có ái lực cao và gắn với một số beta-lactamase là những enzym làm bất hoạt ampicilin bằng cách thủy phân vòng beta-lactam, nên phối hợp sulbactam với ampicilin tạo ra một tác dụng hiệp đồng diệt khuẩn, giúp mở rộng phổ kháng khuẩn của ampicilin đối với nhiều loại vi khuẩn sinh beta-lactamase đã kháng lại ampicilin dùng đơn độc.

Phổ tác dụng

Vi khuẩn Gram dương hiếu khí: Tác dụng lên hầu hết cầu khuẩn ưa khí như *Staphylococcus aureus* (cả loại sinh beta-lactamase và không sinh beta-lactamase), *Staphylococcus epidermidis* (cả loại sinh beta-lactamase và không sinh beta-lactamase), *Streptococcus faecalis* (*Enterococcus*), *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus viridans*. Ampicillin/sulbactam có phổ tác dụng trên trực khuẩn ưa khí *Listeria monocytogenes*.