

OXACILLIN 1g

Bột pha tiêm

1. Thành phần: Cho 1 lọ thuốc bột:

Oxacillin (dưới dạng Oxacillin natri)..... 1 g

2. Dạng bào chế: Bột pha tiêm.

3. Dược lực học:

Nhóm dược lý: Kháng sinh penicillin kháng betalactamase

Mã ATC: J01CF04

Dược lý và cơ chế tác dụng:

Oxacillin là một kháng sinh bán tổng hợp, thuộc nhóm các penicillin không bị mất hoạt tính bởi penicillinase (penicillin kháng penicillinase).

Tương tự các penicillin cùng nhóm, oxacillin có khả năng kháng và không bị mất tác dụng bởi men penicillinase của tụ cầu. Oxacillin có tác dụng với nhiều chủng *Staphylococcus aureus* và *S. epidermidis* sinh penicillinase đã kháng lại hầu hết các loại penicillin hiện có. Nồng độ ức chế vi khuẩn của oxacillin là 0,4 – 6 mcg/ml. Thuốc được dùng trong điều trị các trường hợp nhiễm khuẩn do *S. aureus* đã kháng các penicillin. Tuy nhiên, đến nay đã xuất hiện rất nhiều chủng *Staphylococcus aureus* kháng oxacillin.

Đã có báo cáo về tình trạng ngày càng tăng các tụ cầu kháng oxacillin (trước đó đã biết là kháng methicillin). Do vậy, khi bắt đầu điều trị các nhiễm khuẩn do các tụ cầu còn nhạy cảm, nên phối hợp với vancomycin, phòng khi các chủng kháng oxacillin mắc phải ở cộng đồng hoặc bệnh viện. Những trường hợp mắc các bệnh nặng, nằm viện lâu, trẻ thiếu tháng, đái tháo đường, bệnh mạch ngoại vi, các vết thương bỏng hoặc sau phẫu thuật có nguy cơ cao nhiễm tụ cầu kháng oxacillin. Đã phát hiện thấy vi khuẩn kháng oxacillin trong các trường hợp như viêm màng trong tim có lớp van già, đặt ống thông nội mạch, các shunt dịch não tủy nhiễm khuẩn, rối loạn cấu trúc da, bệnh nhân suy giảm miễn dịch (HIV), trẻ em ung thư bị giảm bạch cầu hạt.

Mặc dù các penicillin kháng penicillinase có hiệu quả trong điều trị các nhiễm khuẩn gây ra bởi các vi khuẩn ưa khí Gram dương (*Streptococcus pneumoniae*, *S. pyogenes*), nhưng *in vitro*, thuốc thể hiện kém tác dụng hơn các penicillin tự nhiên trên các vi khuẩn Gram dương này. Do vậy không nên dùng penicillin kháng penicillinase để điều trị các bệnh nhiễm khuẩn gây ra bởi vi khuẩn còn nhạy cảm với các penicillin tự nhiên. Khi điều trị nhiễm khuẩn hỗn hợp toàn thân do liên cầu và tụ cầu, cần sử dụng cả oxacillin và penicillin G liều cao. Nếu chỉ dùng riêng oxacillin sẽ không hiệu quả với các nhiễm khuẩn do liên cầu. Không nên sử dụng các penicillin kháng penicillinase để phòng nhiễm khuẩn.

4. Dược động học:

Với mức liều 500 mg, nồng độ tối đa trong huyết tương đạt khoảng 7 – 10 mcg/ml, 30 phút sau khi tiêm bắp. Oxacillin chuyển hóa một phần trong cơ thể thành các chất chuyển hóa có và không có tác dụng. Thuốc liên kết cao với protein huyết tương (khoảng 90%). Oxacillin phân bố rộng rãi trong cơ thể, tìm thấy trong cả nước ối, bào thai và sữa mẹ.

Oxacillin được chuyển hóa khoảng 45% tại gan.

Oxacillin bài tiết nhanh qua nước tiểu dưới dạng không đổi và chất chuyển hóa có tác dụng, chủ yếu qua ống thận và lọc ở tiểu cầu thận. Thời gian bán thải khoảng 0,3 – 0,8 giờ ở người bệnh có chức năng thận bình thường và kéo dài hơn ở người thiếu năng thận. Oxacillin cũng được thải trừ qua mật.

5. Quy cách đóng gói: Hộp 1 lọ. Hộp 10 lọ.

6. Chỉ định:

Dùng điều trị các nhiễm khuẩn do tụ cầu đã kháng benzyl penicillin. Tuy nhiên, chỉ dùng trong những trường hợp xác định vi khuẩn sinh penicillinase còn nhạy cảm với thuốc. Thuốc được chỉ định điều trị các trường hợp nhiễm khuẩn sau đây:

- Viêm màng trong tim;
- Viêm màng não do nhiễm khuẩn;
- Nhiễm khuẩn ở đường hô hấp trên và dưới;
- Viêm da và cấu trúc da;
- Viêm xương khớp;
- Viêm đường tiết niệu.

Không được dùng oxacillin để điều trị nhiễm khuẩn do các tụ cầu kháng methicillin.

7. Liều lượng và cách dùng:

Cách dùng:

- **Tiêm bắp:** Thêm 5,7 ml nước cất pha tiêm vào lọ bột pha tiêm Oxacillin 1g, lắc kỹ cho tan hoàn toàn. Khi tiêm bắp phải tiêm sâu vào một khối cơ lớn.

- **Tiêm tĩnh mạch trực tiếp:** Thêm 10 ml nước cất pha tiêm hoặc thuốc tiêm NaCl 0,9% vào lọ bột pha tiêm Oxacillin 1g, lắc kỹ cho tan hoàn toàn. Khi tiêm tĩnh mạch phải tiêm chậm trong vòng 10 phút để giảm thiểu kích ứng tĩnh mạch.

- **Truyền tĩnh mạch:** Hòa tan hoàn toàn lọ bột thuốc trong 10 ml nước cất pha tiêm hoặc thuốc tiêm NaCl 0,9%, sau đó pha loãng với dung dịch tiêm truyền tương ứng (dung dịch Dextrose 5%, NaCl 0,9%).

Liều lượng:

Liều lượng được biểu thị theo oxacillin.

Người lớn: Liều thường dùng:

Tiêm bắp, tiêm tĩnh mạch chậm hoặc tiêm truyền: 250 – 500 mg/lần, 4 – 6 giờ/lần. Có thể tăng đến liều 1g/lần khi bệnh nặng.

Trẻ em:

Trẻ đẻ non và sơ sinh: Tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch 6,25 mg/kg thể trọng/lần, 6 giờ/lần.

Trẻ em cân nặng dưới 40 kg: tiêm bắp hoặc tĩnh mạch 12,5 – 25 mg/kg thể trọng/lần, 6 giờ/lần; hoặc 16,7 mg/kg thể trọng, 4 giờ/lần.

Trẻ em cân nặng 40 kg trở lên: Dùng như liều người lớn.

Người suy thận: nếu $Cl_{cr} < 10$ ml/phút, dùng mức thấp của liều thường dùng.

Thời gian điều trị: phụ thuộc vào loại và mức độ nặng nhẹ của nhiễm khuẩn và được xác định tùy theo đáp ứng điều trị lâm sàng và xét nghiệm vi khuẩn. Trong bệnh nhiễm tụ cầu nặng, điều trị với oxacillin trong ít nhất 1 – 2 tuần. Khi điều trị viêm màng trong tim, thời gian điều trị với oxacillin kéo dài hơn.

8. Sử dụng cho phụ nữ có thai và cho con bú:

Thời kỳ mang thai: Dựa trên các dữ liệu sẵn có, có thể dùng oxacillin cho phụ nữ có thai trong suốt thời gian mang thai.

Thời kỳ cho con bú: Các penicillin qua sữa mẹ ít, và lượng hấp thu ít hơn nhiều so với liều điều trị cho trẻ sơ sinh. Do đó, có thể sử dụng oxacillin ở phụ nữ đang cho con bú.

Tuy nhiên, ngừng cho con bú trong trường hợp trẻ bị tiêu chảy, nấm candida hoặc phát ban.

9. Tác động của thuốc khi lái xe và vận hành máy:

Chưa tìm thấy thông tin.

10. Chống chỉ định:

Quá mẫn với oxacillin và các kháng sinh khác thuộc nhóm betalactam hoặc quá mẫn với bất cứ thành phần nào của thuốc.

Dùng thuốc đúng cách để đạt kết quả.

11. Thận trọng:

Khi xuất hiện bất kỳ biểu hiện dị ứng nào cần phải ngưng điều trị và tiến hành điều trị thích hợp.

Các phản ứng quá mẫn nghiêm trọng và đôi khi gây tử vong (sốc phản vệ) đã được quan sát thấy đặc biệt ở những bệnh nhân điều trị với beta-lactam. Do đó việc sử dụng thuốc yêu cầu phải kiểm tra để phát hiện. Khi có tiền sử dị ứng với các thuốc này, bắt buộc phải chống chỉ định dùng.

Có dị ứng chéo giữa penicillin với cephalosporin trong 5-10% trường hợp. Điều này dẫn đến việc cấm dùng penicillin khi bệnh nhân bị dị ứng với cephalosporin.

Viêm đại tràng giả mạc đã được báo cáo với hầu như tất cả các kháng sinh, bao gồm oxacillin. Nên thực hiện chẩn đoán ở bệnh nhân tiêu chảy dai dẳng và/hoặc nghiêm trọng trong hoặc sau khi điều trị kháng sinh. Trong trường hợp này, các biện pháp điều trị đầy đủ phải được bắt đầu ngay lập tức. Cần xem xét ngưng điều trị kháng sinh. Chống chỉ định các thuốc ức chế nhu động trong trường hợp này.

Ở bệnh nhân suy thận, không cần điều chỉnh liều. Tuy nhiên, cần chú ý đặc biệt đến những bệnh nhân suy thận nặng, khi kết hợp với các thuốc khác có thể cản trở sự vận chuyển beta-lactam (các beta-lactam khác ...) và thúc đẩy sự tích tụ của chúng.

Nếu suy giảm chức năng gan có liên quan đến suy thận, cần theo dõi nồng độ của oxacillin trong máu.

Việc sử dụng oxacillin liều cao trong suy thận hoặc ở những bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ như tiền sử động kinh, điều trị động kinh hoặc tổn thương màng não có thể dẫn đến rối loạn thần kinh.

Thận trọng khi sử dụng ở trẻ sơ sinh vì nguy cơ tăng bilirubin máu do sự cạnh tranh liên kết với các protein huyết thanh (vàng da nhân).

Không nên dùng phối hợp bột pha tiêm Oxacillin 1g với methotrexat.

Sản phẩm này có chứa 2,384 mmol (54,8 mg) natri mỗi lọ 1 gam oxacillin. Thận trọng khi sử dụng cho các bệnh nhân có chế độ ăn kiểm soát natri.

12. Tương tác thuốc và các loại tương tác khác:

Kết hợp không được khuyến khích

+ Methotrexat:

Tăng cường tác dụng và độc tính huyết học của methotrexat: các penicillin ức chế sự bài tiết qua ống thận của methotrexat.

Các vấn đề đặc biệt của sự mất cân bằng INR

Nhiều trường hợp tăng hoạt tính của thuốc chống đông đường uống đã được báo cáo ở những bệnh nhân dùng kháng sinh. Tình trạng nhiễm trùng hoặc viêm, tuổi tác và tình trạng chung của bệnh nhân là yếu tố nguy cơ. Trong những trường hợp này, rất khó để phân biệt giữa bệnh lý nhiễm trùng và việc điều trị nhiễm trùng, yếu tố nào ảnh hưởng đến sự xuất hiện mất cân bằng INR. Tuy nhiên, một số loại thuốc kháng sinh có liên quan nhiều hơn: bao gồm các fluoroquinolon, macrolid, tetracyclin, cotrimoxazol và một số cephalosporin.

+ Tetracyclin: Tránh dùng đồng thời bột pha tiêm Oxacillin 1g với tetracyclin (kháng sinh kim khuẩn) vì có thể gây đối kháng với hiệu quả diệt khuẩn của penicillin.

+ Probenecid: Nồng độ oxacillin trong máu có thể tăng lên và kéo dài do dùng đồng thời probenecid, làm tắc nghẽn sự bài tiết penicillin trong ống thận. Probenecid làm giảm thể tích phân bố biểu kiến và làm chậm tốc độ bài tiết do ức chế cạnh tranh bài tiết penicillin trong ống thận.

Liệu pháp oxacillin-probenecid nên được giới hạn trong những trường hợp nhiễm trùng cần nồng độ rất cao oxacillin trong huyết thanh.

13. Tác dụng không mong muốn

Rối loạn hệ thống miễn dịch

Ngứa, nổi mề đay, co thắt phế quản, phù mạch, đặc biệt là sốc phản vệ, tăng bạch cầu ái toan (xem mục Thận trọng).

Rối loạn mô da và mô dưới da

Ban dát sần, đặc biệt là nổi bóng nước, mụn mủ.

Rối loạn tiêu hóa

Buồn nôn, nôn mửa, tiêu chảy, viêm miệng, lưỡi đen, viêm đại tràng giả mạc.

Rối loạn gan mật

Hiếm gặp tăng vừa phải transaminase (ASAT, ALAT), tăng phosphatase kiềm thoáng qua, đặc biệt là viêm gan ứ mật.

Rối loạn hệ thần kinh

Việc sử dụng liều cao oxacillin, đặc biệt ở những bệnh nhân suy thận, có thể dẫn đến các bệnh não, rối loạn tâm thần, nhầm lẫn, cử động bất thường, rung giật cơ, co giật.

Rối loạn thận và tiết niệu

Viêm thận kẽ cấp tính và tổn thương ống kẽ thận.

Rối loạn máu và bạch huyết

Thiếu máu, giảm tiểu cầu, giảm bạch cầu, mất bạch cầu hạt. Ức chế tủy xương đã được quan sát thấy khi sử dụng một số penicillin.

Rối loạn chung

Sốt.

Thông báo cho Bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc

14. Quá liều và cách xử trí:

Các biểu hiện của quá liều như rối loạn thần kinh, tiêu hóa và thận đã được báo cáo với penicillin M.

Các oxacillin không được loại bỏ bằng thẩm tách máu.

15. Các dấu hiệu cần lưu ý và khuyến cáo:

Không áp dụng.

Hạn dùng:

Lọ bột thuốc: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Hạn dùng sau khi pha chế:

Nên dùng ngay sau khi pha. Bỏ phần thuốc còn thừa sau khi dùng.

Nếu không được dùng ngay, có thể bảo quản ở các điều kiện sau:

- Dung dịch sau khi hoàn nguyên ổn định trong 7 ngày nếu bảo quản trong tủ lạnh (2 – 8°C).

- Dung dịch sau khi pha loãng với thuốc tiêm NaCl 0,9% ổn định trong 3 ngày ở nhiệt độ phòng, 7 ngày trong tủ lạnh.

- Dung dịch sau khi pha loãng với thuốc tiêm dextrose 5% ổn định trong 24 giờ ở nhiệt độ phòng.

Bảo quản: Nơi khô, nhiệt độ không quá 30°C, tránh ánh sáng.

Đề xa tầm tay của trẻ em.

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Thuốc này chỉ dùng theo đơn của Bác sĩ.

Nếu cần thêm thông tin, xin hỏi ý kiến Bác sĩ.

Ngày xem xét sửa đổi, cập nhật lại nội dung hướng dẫn sử dụng: **05/07/2018**

Công ty sản xuất

CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC – TBYT BÌNH ĐỊNH (BIDIPHAR)

498 Nguyễn Thái Học, P. Quang Trung, Tp. Quy Nhơn, tỉnh Bình Định, Việt Nam

ĐT: 0256.3846500 - 3846040 * Fax: 0256.3846846