Фактив



Код АТХ:

- J01MA15

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Гемифлоксацин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, без риски.

	1 таб.
гемифлоксацин (в форме мезилата сесквигидрата)	160 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 21.95 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 7.35 мг, кросповидон (полипласдон Икс Эл-10) - 11.7 мг, магния стеарат - 3.9 мг.

Состав оболочки: опадрай II (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), лактозы моногидрат, макрогол (полиэтиленгликоль), титана диоксид) - 6.5 мг.

5 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
5 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
7 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон.

	1 таб.
гемифлоксацин (в форме мезилата сесквигидрата)	320 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 43.9 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 14.7 мг, кросповидон (полипласдон Икс Эл-10) - 23.4 мг, магния стеарат - 7.8 мг.

Состав оболочки: опадрай II (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), лактозы моногидрат, макрогол (полиэтиленгликоль), титана диоксид) - 13 мг.

5 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — антибактериальное.

Фармакодинамика

Обладает широким спектром бактерицидного действия на грамположительные и грамотрицательные микроорганизмы. Нарушает процессы репликации, репарации и транскрипции бактериальной ДНК посредством ингибирования ферментов ДНК-гиразы (топоизомеразы II) и топоизомеразы IV, необходимых для роста бактерий. Гемифлоксацин отличается высокой степенью сродства с бактериальными топоизомеразами II (ДНК-гираза) и IV.

Штаммы *Streptococcus pneumonia,* с мутациями в генах, кодирующих эти ферменты, резистентны к большинству фторхинолонов. Однако в терапевтически значимых концентрациях гемифлоксацин способен ингибировать измененные ферменты. Таким образом, некоторые из штаммов *Streptococcus pneumonia,* резистентные к фторхинолонам, могут быть чувствительны к гемифлоксацину. Механизм действия фторхинолонов, включая гемифлоксацин, отличается от такового у бета-лактамных антибиотиков, макролидов, аминогликозидов и тетрациклинов. Не отмечено перекрестной резистентности между гемифлоксацином и этими группами антибиотиков. Основным механизмом развития резистентности к фторхинолонам являются мутации в генах ДНК-гиразы и топоизомеразы IV, частота возникновения которых составляет ≤10^{-7}–10^{-10}. Гемифлоксацин активен в отношении большинства штаммов микроорганизмов как *in vitro,* так и *in vivo*, таких как:

Аэробные грамположительные микроорганизмы — *Streptococcus pneumoniae* (включая устойчивые к пенициллину, макролидам и большинство устойчивых к офлоксацину/левофлоксацину и MDRSP*), *Streptococcus pyogenes* (включая устойчивые к макролидам), *Streptococcus viridans, Streptococcus agalactiae, Streptococcus milleri, Streptococcus anginosus, Streptococcus constellatus, Streptococcus mitis* и др.

Staphylococcus aureus (восприимчивые к метициллину), *Staphylococcus epidermidis, Staphylococcus saprophyticus, Staphylococcus haemolyticus* и др.; *Enterococcus faecalis, Enterococcus faecium* и др.

*MDRSP — группа штаммов *Streptococcus pneumoniae,* включающая подвид ранее известный как PRSP *(Streptococcus pneumoniae* устойчивые к пенициллину), и объединяющая штаммы, устойчивые к двум или более из нижеперечисленных антибиотиков: пенициллины, цефалоспорины II-го поколения, макролиды, тетрациклины и триметоприм/сульфаметоксазол.

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Haemophilus influenzae* (в т.ч. с наличием бета-лактамазы), *Haemophilus parainfluenzae* и другие виды *Haemophilus*; *Moraxella catarrhalis* (с отрицательной и положительной бета-лактамазой) и другие виды *Moraxella; Klebsiella pneumoniae, Klebsiella oxytoca* и другие виды *Klebsiella*; *Escherichia coli; Neisseria gonorrhoeae; Acinetobacter iwoffi, Acinetobacter anitratus, Acinetobacter calcoaceticus, Acinetobacter haemolyticus* и другие виды *Acinetobacter; Citrobacter freundii, Citrobacter koseri* и другие виды *Citrobacter; Salmonella, Shigella; Enterobacter aerogenes* и другие виды *Enterobacter; Serratia marcescens* и другие виды *Serratia; Proteus mirabilis, Proteus vulgaris* и другие виды *Proteus; Providencia; Morganella morganii* и другие виды *Morganella; Yersinia; Pseudomonas aeruginosa* и другие виды *Pseudomonas; Bordetella pertussis* и другие виды *Bordetella.*

Атипичные: *Coxiella burnetii* и другие виды *Coxiella; Mycoplasma pneumoniae* и другие виды *Mycoplasma; Legionella pneumophila* и другие виды *Legionella; Chlamydia (Chlamydophila) pneumoniae* и другие виды *Chlamydia.*

Анаэробные: *Peptostreptococcus, Clostridium non-perfringens, Clostridium perfringens* и другие виды *Clostridium; Fusobacterium, Porphyromonas, Prevotella.*

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь гемифлоксацин быстро абсорбируется из ЖКТ. После однократного приема препарата в дозе 320 мг C_{max} в плазме крови достигается в течение 0.5-2 ч. После повторного приема 320 мг C_{max} в плазме крови составляет 1.61 ± 0.51 мкг/мл (0.70-2.62 /мкг/мл), а AUC - 9.93 ±3.07 мкг х ч/мл (4.71-20.1 мкг х ч/мл). Прием пищи практически не изменяет фармакокинетику гемифлоксацина, поэтому препарат можно принимать вне зависимости от приема пищи. Фармакокинетика гемифлоксацина имеет линейный характер в интервале доз 40-640 мг. Препарат

практически не кумулирует (менее 30% при дозе 640 мг в течение 7 дней).

Распределение

При курсовом приеме 320 мг гемифлоксацина 1 раз/сут C_{max} достигается на третий день. При повторном приеме 55-73% препарата связывается с белками плазмы, доля связанной фракции не зависит от возраста.

Гемифлоксацин хорошо проникает в ткани легкого. Концентрация гемифлоксацина в бронхоальвеолярном лаваже выше таковой в плазме.

Метаболизм

В небольшом количестве гемифлоксацин метаболизируется в печени. Спустя 4 ч после приема неизмененный гемифлоксацин преобладает среди метаболитов препарата (65%) в плазме крови.

Гемифлоксацин не подвергается биотрансформации микросомальными печеночными ферментами системы цитохрома P_{450}.

Выведение

У здоровых лиц 61.0±9.5% дозы гемифлоксацина выводится через кишечник, а 36.0±9.3% с мочой в виде неизмененного препарата и продуктов метаболизма.

При гемодиализе из плазмы выводится 20-30% дозы гемифлоксацина.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика препарата у детей не изучена.

У взрослых пациентов возраст не влияет на фармакокинетику гемифлоксацина.

При печеночной недостаточности возможно незначительное увеличение C_{max} гемифлоксацина в плазме крови, не требующее коррекции дозы.

При почечной недостаточности отмечается небольшое увеличение времени элиминации гемифлоксацина из плазмы без изменения C_{max}.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

— обострение хронического бронхита;

— внебольничная пневмония (в т.ч. вызванная полирезистентными штаммами);

— острый синусит.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Пневмония
- Синусит

Противопоказания:

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— удлинение интервала QT на ЭКГ (в т.ч. врожденное);

— поражения сухожилий, перенесенные ранее вследствие применения фторхинолонов;

— индивидуальная непереносимость гемифлоксацина и других фторхинолонов.

С *осторожностью* следует назначать препарат при повышенном риске развития аритмий (включая клинически значимую брадикардию и острую ишемию миокарда), при дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (риск развития

гемолитической реакции), пациентам, особенно пожилого возраста, получающим ГКС (ввиду повышенного риска поражения сухожилий), при эпилепсии и склонности к судорогам, при одновременном приеме с препаратами, удлиняющими интервал QT (антиаритмические препараты I А класса (хинидин, прокаинамид) и III класса (амиодарон, соталол), при нарушениях водно-электролитного баланса (гипокалиемия, гипомагниемия).

Способ применения и дозы:

Назначают по 320 мг 1 раз/сут. При *обострении хронического бронхита* курс лечения составляет 5 дней, при *внебольничной пневмонии* - 7 дней, при *остром синусите* - 5 дней.

При **легких и умеренных нарушениях функции почек (КК более 40 мл/мин)** коррекции доз не требуется. При **выраженных нарушениях функции почек (КК менее 40 мл/мин),** а также пациентам, находящимся на непрерывном гемодиализе и длительном амбулаторном перитонеальном диализе, рекомендуемая доза составляет 160 мг 1 раз/сут.

Пациентам пожилого возраста, пациентам с **нарушениями функции печени** изменений режима дозирования не требуется.

Таблетки следует принимать внутрь, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды, независимо от приема пищи.

Побочное действие:

Аллергические реакции: иногда - кожный зуд, крапивница; в отдельных случаях - синдром Стивенса-Джонсона (злокачественная экссудативная эритема), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), повышенная фоточувствительность, аллергический пневмонит.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, диарея; иногда - рвота, боли в животе, метеоризм, анорексия; редко - острая печеночная недостаточность, гепатит, повышение активности печеночных трансаминаз, уровня общего билирубина.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: редко - тремор, беспокойство, тревожность, спутанность сознания, галлюцинации, параноидный синдром, депрессия, сонливость (при появлении симптомов поражения ЦНС прием гемифлоксацина прекращают); в отдельных случаях - сенсорная или сенсомоторная аксональная полиневропатия, проявляющаяся парестезиями, гипестезиями и другими нарушениями чувствительности, слабостью.

Со стороны органов чувств: редко - нарушения вкуса и обоняния, нарушение зрения (диплопия, изменение цветовосприятия), шум в ушах, головокружение, снижение слуха.

Со стороны кроветворной системы: иногда - лейкопения; редко - тромбоцитопения; в отдельных случаях - панцитопения, тромбоцитопеническая пурпура, агранулоцитоз, анемия (включая гемолитическую и апластическую).

Со стороны мочевыделительной системы: редко - кристаллурия; в отдельных случаях - интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, артрит, тендовагинит, миалгия, разрывы сухожилий плеча, руки, ахиллова сухожилия и других сухожилий.

Со стороны лабораторных показателей: редко - повышения содержание натрия, снижение уровня калия, снижение уровня кальция, изменение гематокрита, повышение активности КФК.

Прочие: редко - васкулиты, суперинфекция (кандидоз, псевдомембранозный колит).

Передозировка:

Лечение: промывание желудка, искусственная рвота, обильное питье, при необходимости проводят симптоматическую терапию. Специфический антидот неизвестен. При гемодиализе из плазмы крови выводится 20-30% дозы гемифлоксацина.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении Фактива с антацидами, содержащими алюминий и магний или с сульфатом железа биодоступность гемифлоксацина снижается. Антациды следует принимать не менее чем за 3 ч до или не ранее чем через 2 ч после приема гемифлоксацина.

Сукральфат при одновременном применении снижает биодоступность гемифлоксацина. Сукральфат следует принимать не ранее чем через 2 ч после приема гемифлоксацина.

Эстроген-гестагенные пероральные контрацептивы незначительно уменьшают биодоступность гемифлоксацина.

Курсовой прием гемифлоксацина не влияет на фармакокинетику пероральных противозачаточных препаратов, содержащих этинилэстрадиол/левоноргестрел.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения гемифлоксацином необходимо обеспечить поступление достаточного количества жидкости при соблюдении нормального диуреза.

При приеме препарата (как и при применении других фторхинолонов), могут возникнуть реакции фотосенсибилизации, поэтому рекомендуется избегать контакта с прямыми солнечными лучами. Лечение следует прекратить, если наблюдаются симптомы фотосенсибилизации (например, изменение кожных покровов напоминает солнечные ожоги).

Риск поражения сухожилий может возрастать у пациентов, получающих ГКС, особенно пациентов пожилого возраста. При первых признаках тендинита (боль и отек в области сухожилий) применение препарата следует прекратить, исключить физические нагрузки и проконсультироваться с врачом.

У пациентов с диареей, развившейся после начала лечения Фактивом, можно предположить развитие псевдомембранозного колита. Наиболее частым возбудителем колита является Clostridium difficile. В большинстве случаев прекращения приема препарата достаточно для исчезновения симптомов колита (в редких случаях может потребоваться назначение антибактериальных препаратов, активных в отношении Clostridium difficile).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, особенно при одновременном употреблении этанола.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Faktiv