Флексид (раствор)



Код АТХ:

- J01MA12

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Левофлоксацин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 250 мг и 500 мг. По 5, 7 или 10 табл. в блистере; по 1, 2, 3 или 5 блистеров в картонной пачке.

Состав:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
левофлоксацин (в форме гемигидрата)	256,23 мг
	512,46 мг
(эквивалентно 250 и 500 мг левофлоксацина соответственно)	
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат — 13,27/26,54 мг; повидон — 17,5/35 мг; карбоксиметилкрахмал натрия — 12/24 мг; тальк — 9/18 мг; кремния диоксид коллоидный безводный — 6,5/13 мг; кроскармеллоза натрия — 4,5/9 мг; глицерил дибегенат — 6/12 мг	
оболочка пленочная: гипромеллоза — 4,962/9,924 мг; гипролоза — 1,238/2,476 мг; макрогол 6000 — 1/2 мг; железа оксид желтый — 0,069/0,138 мг; железа оксид красный — 0,069/0,138 мг; титана диоксид — 2,162/4,324 мг; тальк — 0,5/1 мг	

Описание:

Светлые оранжево-розовые восьмиугольные, двояковыпуклые таблетки с риской на обеих сторонах (дозировка 250 мг) или на одной стороне (дозировка 500 мг).

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — бактерицидное широкого спектра, противомикробное.

Фармакодинамика

Левофлоксацин является противомикробным бактерицидным препаратом широкого спектра действия, блокирует ДНК-гиразу и топоизомеразу IV, подавляет синтез ДНК.

Левофлоксацин активен в отношении большинства штаммов микроорганизмов, как в условиях *in vitro* так и *in vivo*.

In vitro

Чувствительные микроорганизмы (МПК — минимальная подавляющая концентрация — ≤2 мг/мл)

Аэробные грамположительные микроорганизмы — *Corynebacterium diphtheriae, Corynebacterium striatum, Enterococcus faecalis, Enterococcus spp., Listeria monocytogenes, Staphylococcus coagulase-negative methi-S(I)* (метициллино-чувствительные/-умеренно чувствительные), *Staphylococcus aureus methi-S, Staphylococcus epidermidis methi-S, Staphylococcus spp. (CNS), Streptococci* группы *C и G, Streptococcus agalactiae, Streptococcus pneumoniae peni I/S/R* (пенициллино-чувствительные/-умеренно чувствительные/резистентные), *Streptococcus pyogenes, Viridans streptococci peni-S/R.*

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Acinetobacter baumannii, Acinetobacter spp., Actinobacillus actinomycetemcomitans, Citrobacter freundii, Eikenella corrodens, Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter cloacae, Enterobacter spp., Escherichia coli, Gardnerella vaginalis, Haemophilus ducreyi, Haemophilus influenzae ampi-S/R* (ампициллино-чувствительные/-резистентные), *Haemophilus parainfluenzae, Helicobacter pylori, Klebsiella oxytoca, Klebsiella pneumoniae, Klebsiella spp., Moraxella catarrhalis β+/β-, Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae non PPNG/PPNG, Neisseria meningitidis, Pasteurella canis, Pasteurella dagmatis, Pasteurella multocida, Pasteurella spp., Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Providencia rettgeri, Providencia stuartii, Providencia spp., Pseudomonas aeruginosa* (госпитальные инфекции, вызванные *Pseudomonas aeruginosa*, могут потребовать комбинированного лечения), *Pseudomonas spp., Salmonella spp., Serratia marcescens, Serratia spp.*

Анаэробные микроорганизмы: *Bacteroides fragilis, Bifidobacterium spp., Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Peptostreptococcus, Propionibacterium spp., Veilonella spp.*

Другие микроорганизмы: *Bartonella spp., Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Chlamydia trachomatis, Legionella pneumophila, Legionella spp., Mycobacterium spp., Mycobacterium leprae, Micobacterium tuberculosis, Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneumoniae, Ricketsia spp., Ureaplasma urealyticum.*

Умеренно чувствительные микроорганизмы (МПК = 4 мг/л)

Аэробные грамположительные микроорганизмы: *Corynebacterium urealiticum, Corynebacterium xerosis, Enterococcus faecium, Staphylococcus epidermidis methi-R (метициллино-резистентные), Staphylococcus haemolyticus methi-R.*

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Burkholderia cepacia, Campilobacter jejuni/coli.*

Анаэробные микроорганизмы: *Bacteroides thetaiotaomicron, Bacteroides vulgatus, Bacteroides ovatus, Prevotella spp., Porphyromonas spp.*

Устойчивые к левофлоксацину микроорганизмы (МПК >8 мг/л)

Аэробные грамположительные микроорганизмы: *Corynebacterium jeikeium, Staphylococcus aureus methi-R, Staphylococcus coagulase-negative methi-R.*

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Alcaligenes xylosoxidans.*

Аэробные микроорганизмы: *Bacteroides thetaiotaomicron.*

Другие микроорганизмы: *Mycobacterium avium.*

Клиническая эффективность (эффективность в клинических исследованиях при лечении инфекций, вызываемых перечисленными ниже микроорганизмами)

Аэробные грамположительные микроорганизмы: *Enterococcus faecalis, Staphylococcus aureus, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes.*

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Citrobacter freundii, Enterobacter cloacae, Escherichia coli, Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Klebsiella pneumoniae, Moraxella (Branhamella) catarrhalis, Morganella morganii, Proteus mirabilis, Pseudomonas aeruginosa, Serratia marcescens.*

Другие: *Chlamydia pneumoniae, Legionella pneumophila, Mycoplasma pneumoniae.*

В связи с особенностями механизма действия левофлоксацина обычно не наблюдается перекрестной резистентности между левофлоксацином и другими противомикробными средствами.

Фармакокинетика

При приеме *внутрь* абсорбируется из ЖКТ быстро и практически полностью. Прием пищи мало влияет на скорость и полноту абсорбции. Биодоступность составляет 99%. C_{max} достигается через 1-2 ч и при приеме 250 мг и 500 мг составляет 2.8 и 5.2 мкг/мл соответственно. Связывание с белками плазмы - 30-40%.

Хорошо проникает в органы и ткани: легкие, слизистую оболочку бронхов, мокроту, органы мочеполовой системы, полиморфноядерные лейкоциты, альвеолярные макрофаги. В печени небольшая часть окисляется и/или дезацетилируется. Почечный клиренс составляет 70% общего клиренса.

$T_{1/2}$ - 6-8 ч. Выводится из организма преимущественно почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. Менее 5% левофлоксацина экскретируется в виде метаболитов. В неизмененном виде с мочой в течение 24 ч выводится 70% и за 48 ч - 87%; в кале за 72 ч обнаруживается 4% принятой внутрь дозы.

После *в/в инфузии* в дозе 500 мг в течение 60 мин C_{max} - 6.2 мкг/мл. При в/в однократном и многократном введении кажущийся V_d после введения той же дозы составляет 89-112 л, C_{max} - 6.2 мкг/мл, $T_{1/2}$ - 6.4 ч.

После *инстилляции в глаз* левофлоксацин хорошо сохраняется в слезной пленке. У здоровых добровольцев средние концентрации левофлоксацина в слезной пленке, измеренные через 4 и 6 ч после местного применения составили 17 мкг/мл и 6.6 мкг/мл соответственно. У 5 из 6 добровольцев концентрации левофлоксацина составляли 2 мкг/мл и выше через 4 ч после инстилляции. У 4 из 6 добровольцев эта концентрация сохранилась через 6 ч после инстилляции. Средняя концентрация левофлоксацина в плазме крови через 1 ч после применения - от 0.86 нг/мл в 1 сутки до 2.05 нг/мл. C_{max} левофлоксацина в плазме, равная 2.25 нг/мл, выявлена на 4 сутки после двух дней применения препарата каждые 2 ч до 8 раз/сут. C_{max} левофлоксацина, достигавшиеся на 15-й день, более чем в 1000 раз ниже тех концентраций, которые отмечаются после приема внутрь стандартных доз левофлоксацина.

Показания к применению:

Для системного применения: инфекции нижних отделов дыхательных путей (хронический бронхит, пневмония), ЛОР-органов (синусит, средний отит), мочевыводящих путей и почек (в т.ч. острый пиелонефрит), половых органов (в т.ч. урогенитальный хламидиоз), кожи и мягких тканей (нагноившиеся атеромы, абсцесс, фурункулы).

Для местного применения: лечение инфекций переднего отдела глаза, вызванных чувствительными к левофлоксацину микроорганизмами.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Бронхит
- Инфекции
- Отит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Синусит
- Фурункул

Противопоказания:

Эпилепсия, поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении хинолонами, беременность, лактация, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к левофлоксацину.

Способ применения и дозы:

Применяют внутрь, в/в, местно.

При синусите - внутрь, по 500 мг 1 раз/сут; при обострении хронического бронхита - по 250-500 мг 1 раз/сут. При пневмонии - внутрь, по 250-500 мг 1-2 раза/сут (500-1000 мг/сут); в/в - по 500 мг 1-2 раза/сут. При инфекциях мочевыводящих путей - внутрь, 250 мг 1 раз/сут или в/в в той же дозе. При инфекциях кожи и мягких тканей - по 250-500 мг внутрь 1-2 раза/сут или в/в, по 500 мг 2 раза/сут. После в/в введения через несколько дней возможен переход на прием внутрь в той же дозе.

При заболеваниях почек дозу снижают в соответствии со степенью нарушения функции: при КК=20-50 мл/мин - по 125-250 мг 1-2 раза/сут, при КК=10-19 мл/мин - 125 мг 1 раз в 12-48 ч, при КК<10 мл/мин - 125 мг через 24 или 48 ч. Длительность лечения - 7-10 (до 14) дней.

Применяют местно в форме глазных капель. Взрослым и детям старше 1 года закапывают по 1-2 капле в пораженный глаз(а) каждые 2 ч до 8 раз/сут в период бодрствования в течение первых 2 сут, затем 4 раза/сут с 3-го по 7-й день. Длительность применения составляет 5-7 дней.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, анорексия, абдоминальные боли, псевдомембранозный энтероколит, повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия, гепатит, дисбактериоз.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, сосудистый коллапс, тахикардия.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (повышение аппетита, потливость, дрожь).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, слабость, сонливость, бессонница, парестезии, тревожность, страх, галлюцинации, спутанность сознания, депрессия, двигательные расстройства, судороги.

Со стороны органов чувств: нарушения зрения, слуха, обоняния, вкусовой и тактильной чувствительности. При местном применении - кратковременное жжение в глазах, покраснение глаз, снижение остроты зрения, появление слизи в виде тяжей в слезной пленке, блефарит, хемоз, сосочковые разрастания и появление фолликулов на конъюнктиве, синдром сухого глаза, эритема век, зуд и боль в глазах, светобоязнь.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, разрыв сухожилий, мышечная слабость, тендинит.

Со стороны мочевыделительной системы: гиперкреатининемия, интерстициальный нефрит.

Со стороны системы кроветворения: эозинофилия, гемолитическая анемия, лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, панцитопения, геморрагии.

Дерматологические реакции: фотосенсибилизация, зуд, отек кожи и слизистых оболочек, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Аллергические реакции: крапивница, бронхоспазм, удушье, анафилактический шок, аллергический пневмонит, васкулит.

Прочие: обострение порфирии, рабдомиолиз, стойкая лихорадка, развитие суперинфекции.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, эрозии слизистой оболочки ЖКТ, спутанность сознания, головокружение, потеря сознания, галлюцинации, тремор и судороги, удлинение интервала QT.

Лечение: симптоматическое; контроль параметров ЭКГ; назначение антацидных препаратов; гемодиализ неэффективен; специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Диагнозы

- Апоплексия яичника
- Атрофический вагинит
- Бактериальный вагиноз
- Беременность

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Левофлоксацин увеличивает $T_{1/2}$ циклоспорина.

Эффект левофлоксацина снижают препараты, угнетающие моторику кишечника, сукральфат, магний- и алюминийсодержащие антацидные средства и соли железа (необходим перерыв между приемом не менее 2 ч).

При одновременном применении НПВС, теофиллин повышают судорожную готовность, ГКС - повышают риск разрыва сухожилий.

Циметидин и лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение левофлоксацина.

Раствор левофлоксацина для в/в введения совместим с 0.9% раствором натрия хлорида, 5% раствором декстрозы, 2.5% раствором Рингера с декстрозой, комбинированными растворами для парентерального питания (аминокислоты, углеводы, электролиты).

Раствор левофлоксацина для в/в введения нельзя смешивать с гепарином и растворами, имеющими щелочную реакцию.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют левофлоксацин у пациентов пожилого возраста (высокая вероятность сопутствующего снижения функции почек).

После нормализации температуры рекомендуется продолжать лечение не менее 48-78 ч.

Во время лечения необходимо избегать солнечного и искусственного УФ облучения во избежание повреждения кожных покровов (фотосенсибилизация).

При появлении признаков тендинита левофлоксацин немедленно отменяют. Следует иметь в виду, что у больных с поражением головного мозга в анамнезе (инсульт, тяжелая травма) возможно развитие судорог, при недостаточности глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы - риск развития гемолиза.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

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