Хайнемокс



Код АТХ:

- J01MA14

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Моксифлоксацин

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, 400 мг. По 5, 7 или 10 табл. в блистере из Ал/ПВХ/ПВДХ или блистере из Ал/Ал. По 1, 2 или 10 блистеров помещают в пачку картонную.

Для стационаров. По 100, 500 или 1000 табл. в пакете из ПВХ, пакет в банке из ПЭВП.

Состав:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
моксифлоксацина гидрохлорид	436,3 мг
(соответствует моксифлоксацину — 400 мг)	
вспомогательные вещества: крахмал кукурузный — 52 мг; натрия лаурилсульфат — 7,5 мг; тальк очищенный — 15 мг; магния стеарат — 6,5 мг; карбоксиметилкрахмал натрия — 20 мг; кремния диоксид коллоидный безводный — 3,5 мг; натрия кроскармеллоза — 6,5 мг; МКЦ — 130,7 мг	
оболочка пленочная: Opadry белый (85G58977) *Make-Colorcon* (поливиниловый спирт, титана диоксид, тальк, макрогол 3000, лецитин (соевый) — 17,32 мг; оксид железа красный — 0,68 мг	

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой: розовато-красного цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской, покрытые пленочной оболочкой.

На изломе — однородная масса, от белого до светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — противомикробное.

Фармакодинамика

Моксифлоксацин — бактерицидный антибактериальный препарат широкого спектра действия фторхинолонового ряда, 8-метоксифторхинолон. Ингибирует топоизомеразу II и топоизомеразу IV, нарушает суперспирализацию и сшивку разрывов ДНК, подавляет синтез ДНК, вызывает глубокие морфологические изменения в цитоплазме, клеточной стенке и мембранах чувствительных микроорганизмов. Минимальные бактерицидные концентрации моксифлоксацина в целом сопоставимы с его минимальными ингибирующими концентрациями (МИК).

Механизмы, приводящие к развитию устойчивости к пенициллинам, цефалоспоринам, аминогликозидам, макролидам и тетрациклинам, не нарушают антибактериальную активность моксифлоксацина. Перекрестной устойчивости между этими группами антибактериальных препаратов и моксифлоксацином не отмечается. До сих пор также не наблюдалось случаев плазмидной устойчивости. Общая частота развития устойчивости очень незначительна (10^{-7}–10^{-10}). Резистентность к моксифлоксацину развивается медленно, путем множественных мутаций. Многократное воздействие моксифлоксацина на микроорганизмы в концентрациях ниже МИК сопровождается лишь незначительным увеличением МИК. Отмечаются случаи перекрестной устойчивости к хинолонам. Тем не менее, некоторые устойчивые к другим хинолонам грамположительные и анаэробные микроорганизмы сохраняют чувствительность к моксифлоксацину.

Моксифлоксацин *in vitro* активен в отношении широкого спектра грамотрицательных и грамположительных микроорганизмов, анаэробов, кислотоустойчивых бактерий и атипичных бактерий, таких как *Mycoplasma spp., Chlamydia spp., Legionella spp.*, а также бактерий, резистентных к бета-лактамным и макролидным антибиотикам.

Спектр антибактериальной активности моксифлоксацина включает следующие микроорганизмы.

Чувствительные

Грамположительные: *Gardnerella vaginalis, Streptococcus pneumoniae** (включая штаммы, устойчивые к пенициллину и штаммы, с множественной резистентностью к антибиотикам), *Streptococcus pyogenes* (группа А)*, группа *Streptococcus milleri (S. anginosus*, S. constellatus*, S. intermedius*),* группа *Streptococcus viridans (S. viridans, S. mutans, S. mitis, S. sanguinis, S. salivarius, S. thermophilus, S. constellatus), Streptococcus agalactiae, Streptococcus dysgalactiae, Staphylococcus aureus* (включая штаммы, чувствительные к метициллину)*, коагулазонегативные стафилококки *(S. cohnii, S. epidermidis, S. haemolyticus, S. hominis, S. saprophyticus, S. simulans),* включая штаммы, чувствительные к метициллину.

Грамотрицательные: *Haemophilus influenzae* (включая штаммы, продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазы)*, *Haemophilus parainfluenzae*, Moraxella catarrhalis* (включая штаммы, продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазы)*, *Bordetella pertussis, Legionella pneumophila, Acinetobacter baumannii, Proteus vulgaris*.

Анаэробы: *Fusobacterium spp., Porphyromonas spp., Prevotella spp., Propionibacterium spp.*

Атипичные: *Chlamydia pneumoniae*, Chlamydia trachomatis*, Mycoplasma pneumoniae*, Mycoplasma hominis, Mycoplasma genitalium, Legionella pneumophila*, Coxiella burnetii.*

Умеренно-чувствительные

Грамположительные: *Enterococcus faecalis** (только штаммы, чувствительные к ванкомицину и гентамицину), *Enterococcus avium*, Enterococcus faecium**.

Грамотрицательные: *Escherichia coli*, Klebsiella pneumoniae*, Klebsiella oxytoca, Citrobacter freundii*, Enterobacter spp. (E. aerogenes, E. intermedius, E. sakazakii), Enterobacter cloacae*, Pantoea agglomerans, Pseudomonas fluorescens, Burkholderia cepacia, Stenotrophomonas maltophilia, Proteus mirabilis*, Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae*, Providencia spp. (P. rettgeri, P. stuartii).*

Анаэробы: *Bacteroides spp. (B. fragilis*, B. distasonis*, B. thetaiotaomicron*, B. ovatus*, B. uniformis*, B. vulgaris*), Peptostreptococcus spp., Clostridium spp.*

Резистентные

Грамположительные: *Staphylococcus aureus* (резистентные к метициллину/офлоксацину штаммы)**, коагулазонегативные стафилококки *(S. cohnii, S. epidermidis, S. haemolyticus, S. hominis, S. saprophyticus, S. simulans)*, резистентные к метициллину штаммы.

Грамотрицательные: *Pseudomonas aeruginosa.*

* Чувствительность к моксифлоксацину подтверждена клиническими данными.

** Применение препарата Хайнемокс не рекомендуется для лечения инфекций, вызванных штаммами *S. aureus*, резистентными к метициллину *(MRSA)*. В случае предполагаемых или подтвержденных инфекций, вызванных *MRSA,* следует назначить лечение соответствующими антибактериальными препаратами.

Фармакокинетика

После приема внутрь моксифлоксацин абсорбируется быстро и почти полностью. После однократного приема моксифлоксацина в дозе 400 мг C_{max} в крови достигается в течение 0.5-4 ч и составляет 3.1 мг/л.

После однократной инфузии в дозе 400 мг в течение 1 ч C_{max} достигается в конце инфузии и составляет 4.1 мг/л, что соответствует ее увеличению приблизительно на 26% по сравнению с величиной этого показателя при приеме внутрь. При многократных в/в инфузиях в дозе 400 мг продолжительностью 1 ч C_{max} варьирует в пределе от 4.1 мг/л до 5.9 мг/л. Средние C_{ss}, равные 4.4 мг/л, достигаются в конце инфузии.

Абсолютная биодоступность составляет около 91%.

Фармакокинетика моксифлоксацина при приеме в однократных дозах от 50 мг до 1200 мг, а также а дозе 600 мг/сут в течение 10 дней является линейной.

Равновесное состояние достигается в течение 3 дней.

Связывание с белками крови (главным образом с альбуминами) составляет около 45%.

Моксифлоксацин быстро распределяется в органах и тканях. V_d составляет приблизительно 2 л/кг.

Высокие концентрации моксифлоксацина, превышающие таковые в плазме, создаются в легочной ткани (в т.ч. в альвеолярных макрофагах), в слизистой оболочке бронхов, в носовых пазухах, в мягких тканях, коже и подкожных структурах, очагах воспаления. В интерстициальной жидкости и в слюне препарат определяется в свободном, не связанном с белками виде, в концентрации выше, чем в плазме. Кроме того, высокие концентрации активного вещества определяются в органах брюшной полости и перитонеальной жидкости, а также в тканях женских половых органов.

Биотрансформируется до неактивных сульфосоединений и глюкуронидов. Моксифлоксацин не подвергается биотрансформации микросомальными ферментами печени системы цитохрома Р450.

После прохождения 2-ой фазы биотрансформации моксифлоксацин выводится из организма почками и через кишечник как в неизмененном виде, так и в виде неактивных сульфосоединений и глюкуронидов.

Выводится с мочой, а также с калом, как в неизмененном виде, так и в виде неактивных метаболитов. При однократной дозе 400 мг около 19% выводится в неизмененном виде с мочой, около 25% - с калом. $T_{1/2}$ составляет примерно 12 ч. Средний общий клиренс после приема в дозе 400 мг составляет от 179 мл/мин до 246 мл/мин.

Показания к применению:

Инфекции верхних и нижних отделов дыхательных путей: острый синусит, обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония; инфекции кожи и мягких тканей.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Инфекции
- Пневмония
- Синусит

Противопоказания:

Детский и подростковый возраст до 18 лет, беременность, лактация (период грудного вскармливания), повышенная чувствительность к моксифлоксацину.

Способ применения и дозы:

Внутрь, 400 мг 1 раз/сут. Курс лечения при обострении хронического бронхита - 5 дней, внебольничной пневмонии - 10 дней, остром синусите, инфекциях кожи и мягких тканей - 7 дней.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: абдоминальные боли, тошнота, диарея, рвота, диспепсия, метеоризм, запор, повышение активности печеночных трансаминаз, извращение вкуса.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, бессонница, нервозность, чувство тревоги, астения, головная боль, тремор, парестезия, боль в ногах, судороги, спутанность сознания, депрессия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, периферические отеки, повышение АД, сердцебиение, боль в груди.

Со стороны лабораторных показателей: снижение уровня протромбина, повышение активности амилазы.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, эозинофилия, тромбоцитоз, тромбоцитопения, анемия.

Со стороны костно-мышечной системы: боль в спине, артралгия, миалгия.

Со стороны половой системы: вагинальный кандидоз, вагинит.

Аллергические реакции: сыпь, зуд, крапивница.

Передозировка:

Лечение: в случае передозировки следует ориентироваться на клиническую картину и проводить симптоматическую поддерживающую терапию с ЭКГ-мониторингом. Назначение активированного угля сразу после перорального приема препарата может помочь предотвратить чрезмерное системное воздействие моксифлоксацина в случаях передозировки.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Моксифлоксацин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении антациды, минеральные вещества, поливитамины ухудшают абсорбцию (вследствие образования хелатных комплексов с поливалентными катионами) и снижают концентрацию моксифлоксацина в плазме (одновременный прием возможен с интервалом в 4 ч до или 2 ч после приема моксифлоксацина).

При приеме моксифлоксацина на фоне применения других фторхинолонов возможно развитие фототоксических реакций.

Ранитидин снижает всасывание моксифлоксацина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью назначают моксифлоксацин при эпилептическом синдроме (в т.ч. в анамнезе), эпилепсии, печеночной недостаточности, синдроме удлинения интервала QT.

Во время терапии фторхинолонами могут развиваться воспаление и разрыв сухожилия, в особенности у пожилых больных и у пациентов, параллельно получающих ГКС. При первых признаках боли или воспаления сухожилий больные должны прекратить лечение и освободить от нагрузки пораженную конечность.

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