Лефлобакт (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:

Раствор для инфузий 0.5% зеленовато-желтого цвета, прозрачный.

	1 мл	**1 фл.**
левофлоксацин (в форме гемигидрата)	5 мг	500 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид - 900 мг, вода д/и - до 100 мл.

100 мл - флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.
100 мл - бутылки стеклянные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Лефлобакт – синтетический противомикробный бактерицидный препарат широкого спектра действия из группы фторхинолонов, содержащий в качестве активного вещества левофлоксацин – левовращающий изомер офлоксацина. По сравнению с офлоксацином левофлоксацин имеет более широкий спектр антибактериальной активности, дополнительно включающий различные стрептококки, в т.ч. пневмококки.

Левофлоксацин блокирует бактериальные ДНК-гиразу (топоизомеразу II) и топоизомеразу IV, нарушает суперспирализацию и сшивку разрывов ДНК, ингибирует синтез ДНК, вызывает глубокие морфологические изменения в цитоплазме, клеточной стенке и мембране микроорганизмов, но не влияет на ферменты клеток человеческого организма.

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

Чувствительны к левофлоксацину (МПК <2 мг/мл)

Грамположительные аэробные микроорганизмы: Corynebacterium diphtheriae, Enterococcus faecalis, Enterococcus spp. (кроме Enterococcus faecium), Listeria monocytogenes, Staphylococcus spp. коагулазонегативные (штаммы, чувствительные и умеренно чувствительные к метициллину), Staphylococcus aureus (метициллин-чувствительные штаммы), Staphylococcus epidermidis (метициллин-чувствительные штаммы), Streptococcus spp. группы C и G, Streptococcus agalactiae, Streptococcus pneumoniae (чувствительные, умеренно чувствительные и резистентные к пенициллину), Streptococcus pyogenes, Streptococcus группы Viridans (чувствительные и резистентные к пенициллину).

Грамотрицательные аэробные микроорганизмы: Acinetobacter spp. (в т.ч. Acinetobacter baumannii, Acinetobacter calcoaceticus), Actinobacillus actinomycetemcomitans, Bordetella pertussis, Citrobacter diversus, Citrobacter freundii, Eikenella corrodens, Enterobacter spp. (в т.ч. Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter cloacae), Escherichia coli, Gardnerella vaginalis, Haemophilus ducreyi, Haemophilus influenzae (штаммы, чувствительные и резистентные к ампициллину), Haemophilus parainfluenzae, Helicobacter pylori, Klebsiella spp. (в т.ч. Klebsiella pneumoniae, Klebsiella oxytoca), Moraxella catarrhalis (продуцирующие и не продуцирующие β-лактамазу штаммы), Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Pasteurella spp. (в т.ч. Pasteurella canis, Pasteurella dagmatis, Pasteurella multocida), Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Providencia spp. (в т.ч. Providencia rettgeri, Providencia stuartii), Pseudomonas aeruginosa, Pseudomonas spp., Salmonella spp., Serratia spp. (в т.ч. Serratia marcescens).

Анаэробные микроорганизмы: Bacteroides fragilis, Bifidobacterium spp., Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Peptostreptococcus spp., Propionibacterum spp., Veillonella spp.

Другие микроорганизмы: Bartonella spp., Chlamydia (Chlamydophila) pneumoniae, Chlamydia psittaci, Chlamydia trachomatis, Legionella spp. (в т.ч. Legionella pneumophila), Mycobacterium spp. (в т.ч. Mycobacterium leprae, Mycobacterium tuberculosis), Mycoplasma pneumoniae, Mycoplasma hominis, Rickettsia spp., Ureaplasma urealyticum.

Умеренно чувствительны к левофлоксацину (МПК ≥4 мг/л)

Грамположительные аэробные микроорганизмы: Corynebacterium urealyticum, Corynebacterium xerosis, Enterococcus faecium, Staphylococcus epidermidis (метициллин-резистентные штаммы), Staphylococcus haemolyticus (метициллин-резистентные штаммы).

Грамотрицательные аэробные микроорганизмы: Burkholderia cepacia, Campylobacter jejuni, Campylobacter coli.

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

Устойчивы к левофлоксацину (МПК ≥ 8 мг/мл)

Грамположительные аэробные микроорганизмы: Corynebacterium jeikeium, Staphylococcus aureus (метициллин-резистентные штаммы), Staphylococcus spp. (коагулазонегативные метициллин-резистентные штаммы).

Грамотрицательные аэробные микроорганизмы: Alcaligenes xylosoxidans.

Другие микроорганизмы: Mycobacterium avium.

Фармакокинетика

Распределение

Фармакокинетика левофлоксацина имеет линейный характер и предсказуема при однократном и множественном введении препарата. Плазменный профиль концентраций левофлоксацина после в/в введения аналогичен таковому при приеме таблеток. Поэтому пероральный и в/в пути введения могут считаться взаимозаменяемыми.

Связывание с белками плазмы - 30-40 %. Хорошо проникает в органы и ткани: легкие, слизистую оболочку бронхов, мокроту, органы мочевыделительной системы, половые органы, костную ткань, спинномозговую жидкость, предстательную железу, полиморфно-ядерные лейкоциты, альвеолярные макрофаги.

Средний V_d левофлоксацина составляет от 89 до 112 л после одноразового и многократного в/в введения 500 мг. Фармакокинетические характеристики после разового в/в введения левофлоксацина в дозе 500 мг, соответственно, составляют: C_{max} - 6.2±1 мкг/мл, время, необходимое для достижения C_{max} - 1±0.1 ч.

Метаболизм

Левофлоксацин незначительно метаболизируется в печени (около 5% введенной дозы).

Выведение

$T_{1/2}$ – 6.4±0.7 ч. Левофлоксацин преимущественно выделяется почками в неизмененном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При почечной недостаточности уменьшение клиренса препарата и его выведения через почки зависит от степени снижения клиренса креатинина.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к левофлоксацину бактериями:

— нижних дыхательных путей (внебольничная пневмония);

— мочевыводящих путей и почек (в т.ч. острый пиелонефрит);

— хронический бактериальный простатит;

— кожи и мягких тканей (нагноившиеся атеромы, абсцесс, фурункулы);

— интраабдоминальные инфекции;

— септицемия/бактериемия, связанная с указанными выше показаниями.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Инфекции
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Простатит
- Фурункул

Противопоказания:

— эпилепсия;

— поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении хинолонами;

— беременность;

— период лактации;

— детский и подростковый возраст (до 18 лет);

— повышенная чувствительность (в т.ч. к другим хинолонам).

С *осторожностью*

— пожилой возраст, в связи с высокой вероятностью наличия сопутствующего снижения функции почек (дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы);

— у пациентов с поражением головного мозга в анамнезе (инсульт или тяжелая травма) (возможно развитие судорог);

— у пациентов с псевдопаралитической миастенией (myasthenia gravis);

— у пациентов с известными факторами риска удлинения интервала QT;

— у пациентов с сахарным диабетом;

— предрасположенность к судорожным реакциям (атеросклероз сосудов головного мозга, нарушения мозгового кровообращения (в анамнезе);

— органические заболевания ЦНС;

— почечная недостаточность;

— синдром врожденного удлинения интервала QT;

— заболевания сердца (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия);

— электролитный дисбаланс (например, при гипокалиемии, гипомагниемии);

— психозы и другие психические нарушения в анамнезе;

— печеночная порфирия;

— одновременный прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT (антиаритмические препараты классов I A и III, трициклические и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики, макролиды, противогрибковые, производные имидазола, некоторые антигистаминные, в т.ч. астемизол, терфенадин, эбастин) и снижающих порог судорожной готовности головного мозга (фенбуфен, теофиллин).

Не рекомендуется назначать левофлоксацин одновременно с другими средствами, удлиняющими интервал QT, т.к. увеличивается риск развития сердечных аритмий.

Способ применения и дозы:

В/в, капельно, медленно 1-2 раза/сут. Дозы определяются характером и тяжестью инфекции, а также чувствительностью предполагаемого возбудителя.

Больным с нормальной функцией почек (клиренс креатинина >50 мл/мин) можно рекомендовать следующий режим дозирования препарата.

Внебольничная пневмония: по 500 мг (100 мл раствора) 1-2 раза/сут в течение 7-14 дней.

Неосложненные инфекции мочевыводящих путей: по 250 мг (50 мл раствора) 1 раз/сут в течение 3 дней.

Осложненные инфекции мочевыводящих путей (в т.ч. острый пиелонефрит): по 250 мг (50 мл раствора) 1 раз/сут в течение 7-10 дней.

Инфекции кожи и мягких тканей (нагноившиеся атеромы, абсцесс, фурункулы): по 500 мг (100 мл раствора) 2 раза/сут в течение 7-14 дней.

Хронический бактериальный простатит: 500 мг (100 мл раствора) 1 раз/сут в течение 28 дней.

Септицемия/бактериемия: по 500 мг (100 мл раствора) 1-2 раза/сут в течение 10-14 дней

Интраабдоминальная инфекция: по 500 мг (100 мл раствора) 1 раз/сут в течение 7-14 дней (в комбинации с антибактериальными препаратами, действующими на анаэробную флору).

Пациентам с нарушением функции почек требуется коррекция режима дозирования в зависимости от величины клиренса креатинина.

Клиренс креатинина	**Режим дозирования**		
	250 мг/24 ч	**500 мг/24 ч**	**500 мг/12 ч**
	первая доза: 250 мг	первая доза: 500 мг	первая доза: 500 мг
50-20 мл/мин	затем - по 125 мг/24 ч	затем - по 250 мг/24 ч	затем - по 250 мг/12 ч
19-10 мл/мин	затем - по 125 мг/48 ч	затем - по 125 мг/24 ч	затем - по 125 мг/12 ч
< 10 мл/мин (включая гемодиализ и ДАПД[1])	затем - по 125 мг/48 ч	затем - по 125 мг/24 ч	затем - по 125 мг/24 ч

[1] - после гемодиализа или длительного амбулаторного перитонеального диализа (ДАПД) не требуется введение дополнительных доз.

При **нарушении функции печени** не требуется специального подбора доз, поскольку левофлоксацин метаболизируется в печени лишь в крайне незначительной мере.

Инфузионный раствор левофлоксацина 500 мг (100 мл) вводят в/в капельно медленно. Продолжительность инфузии 1 флакона раствора левофлоксацина 500 мг (100 мл) должна составлять не менее 60 мин. После в/в введения через несколько дней возможен переход на прием внутрь в той же дозе.

Лечение левофлоксацином рекомендуется продолжать не менее 48-72 ч после нормализации температуры тела или после достоверной эрадикации возбудителя.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, снижение аппетита, боль в животе, псевдомембранозный колит, повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия, гепатит, дисбактериоз, тяжелая печеночная недостаточность, включая случаи развития острой печеночной недостаточности, особенно у пациентов с тяжелым основным заболеванием (например, при сепсисе).

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

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (повышение аппетита, повышенное потоотделение, дрожь), приступы порфирии.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, слабость, сонливость, бессонница, парестезии, периферическая сенсорная и сенсомоторная невропатия, тревожность, страх, психотические реакции, самоповреждающее поведение, включая суицидальные мысли и действия, галюцинации, спутанность сознания, депрессия, двигательные расстройства, судороги, тремор, экстрапирамидные расстройства, ажитация (возбуждение), ночные кошмары.

Со стороны органов чувств: агевзия, дисгевзия (извращение вкуса), потеря вкусовых ощущений, паросмия (расстройство ощущения запаха, особенно субъективное ощущение запаха, объективно отсутствующего), включая потерю обоняния, вертиго (чувство отклонения или кружения или собственного тела или окружающих предметов), звон в ушах, снижение слуха.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миастения, миалгия, разрыв сухожилий, тендинит, рабдомиолиз.

Со стороны мочевыделительной системы: гиперкреатининемия, интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

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

*Аллергические реакции***:** зуд, гиперемия, отек кожи и слизистых оболочек, крапивница, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), бронхоспазм, удушье, одышка, анафилактический шок, аллергический пневмонит, васкулит.

Местные реакции: флебит и перифлебит.

Прочие: обострение порфирии, фотосенсибилизация, стойкая лихорадка, развитие суперинфекции, астения.

Передозировка:

Симптомы: спутанность сознания, головокружение, судороги, удлинение интервала QT.

Лечение: симптоматическое, диализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При комбинированном лечении фенбуфеном и сходных с ним НПВП, теофиллином лекарственное средство может повышать порог судорожной готовности.

ГКС повышают риск разрыва сухожилий (особенно в пожилом возрасте).

Выведение левофлоксацина незначительно замедляется под действием циметидина и пробенецида.

Левофлоксацин вызывает небольшое увеличение $T_{1/2}$ циклоспорина из плазмы крови.

При одновременном применении с варфарином увеличивается протромбиновое время и риск кровотечения (необходим тщательный мониторинг МНО, протромбинового времени и других показателей коагуляции, а также мониторинг возможных признаков кровотечения).

Этанол может усилить побочные эффекты со стороны ЦНС (головокружение, сонливость).

У больных сахарным диабетом, получающих пероральные гипогликемические средства или инсулин, на фоне приема левофлоксацина возможны гипо- и гипергликемические состояния (рекомендуется тщательный мониторинг концентрации глюкозы в крови).

При одновременном применении с препаратами, удлиняющими интервал QT (антиаритмические препараты классов I A и III , трициклические и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики, макролиды, противогрибковые, производные имидазола, некоторые антигистаминные, в т.ч. астемизол, терфенадин, эбастин) возможно удлинение интервала QT.

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

Нельзя смешивать с гепарином и растворами, имеющими щелочную реакцию.

Особые указания и меры предосторожности:

При тяжелой пневмонии, вызванной пневмококками, терапевтический эффект Лефлобакта может быть недостаточным.

Длительность в/в инфузии 500 мг (100 мл инфузионного раствора) должна составлять не менее 60 мин.

Во время инфузии в отдельных случаях могут наблюдаться ощущение сердцебиения; транзиторное снижение АД. При выраженном снижении АД инфузию немедленно прекращают.

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

При появлении признаков тендинита, псевдомембранозного колита, аллергических реакций 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.

Так как левофлоксацин экскретируется главным образом через почки, у пациентов с нарушением функции почек требуется обязательный контроль функции почек, а также коррекция режима дозирования.

Сообщалось об очень редких случаях удлинения интервала QT у пациентов, получавших фторхинолоны, включая левофлоксацин. При применении фторхинолонов, включая левофлоксацин, следует соблюдать осторожность у пациентов с известными факторами риска удлинения интервала QT: пожилой возраст; нарушение электролитного баланса (гипокалиемия, гипомагниемия); синдром врожденного удлинения интервала QT; заболевания сердца (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия); одновременный прием лекарственных средств, способных удлинять интервал QT.

У пациентов, получающих фторхинолоны, включая левофлоксацин, отмечалась сенсорная и сенсорно-моторная периферическая невропатия, начало которой может быть быстрым. Если у пациента появляются симптомы невропатии, применение левофлоксацина должно быть прекращено. Это минимизирует возможный риск развития необратимых изменений.

Во время лечения следует избегать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо отказаться от управления автомобилем и потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушением функции почек требуется коррекция режима дозирования в зависимости от величины клиренса креатинина.

Клиренс креатинина	**250 мг/24 ч**	**500 мг/24 ч**	**500 мг/12 ч**
	первая доза: 250 мг	первая доза: 500 мг	первая доза: 500 мг
50-20 мл/мин.	затем - по 125 мг/24 ч	затем - 250 мг/24 ч	затем - 250 мг/12 ч
19-10 мл/мин.	затем- по 125 мг/48 ч	затем - 125 мг/24 ч	затем - 125 мг/12 ч
< 10 мл/мин. (включая гемодиализ и ДАПД[1])	затем - по 125 мг/48 ч	затем - 125 мг/24 ч	затем - 125 мг/24 ч

[1] = после гемодиализа или длительного амбулаторного перитонеального диализа (ДАПД) не требуется введение дополнительных доз.

При нарушениях функции печени

При **нарушении функции печени** не требуется специального подбора доз, поскольку левофлоксацин метаболизируется в печени лишь в крайне незначительной мере.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять у пожилых пациентов в связи с высокой вероятностью наличия сопутствующего снижения функции почек (дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы).

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям в возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

При комнатном освещении инфузионный раствор может храниться без светозащиты не более 3 дней. Замораживание недопустимо.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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