Лефокцин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой светло-бежевого цвета, пленочной; двояковыпуклые, продолговатые (каплеты), с линией разлома с одной стороны.

	1 таб.
левофлоксацина гемигидрат (в пересчете на левофлоксацин)	250 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал, натрия крахмал гликолат, повидон К-30, тальк очищенный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, гипромеллоза 15 cps, пропиленгликоль, тальк, титана диоксид, железа оксид красный, железа оксид желтый.

5 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой бежевого цвета, пленочной; двояковыпуклые, продолговатые (каплеты), с линией разлома с одной стороны.

	1 таб.
левофлоксацина гемигидрат (в пересчете на левофлоксацин)	500 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал, натрия крахмал гликолат, повидон К-30, тальк очищенный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, гипромеллоза 15 cps, пропиленгликоль, тальк, титана диоксид, железа оксид красный, железа оксид желтый.

5 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический противомикробный препарат широкого спектра действия из группы фторхинолонов. Левофлоксацин - левовращающий изомер офлоксацина. Блокирует ДНК-гиразу, нарушает суперспирализацию и сшивку разрывов ДНК, ингибирует синтез ДНК, вызывает глубокие морфологические изменения в цитоплазме, клеточной стенке и мембранах. К левофлоксацину чувствительны большинство штаммов микроорганизмов как в условиях in vitro, так и in vivo.

Препарат *активен в отношении аэробных грамположительных микроорганизмов:* Corynebacterium diphtheriae, Enterococcus spp. (в т.ч. Enterococcus faecalis), Listeria monocytogenes, Staphylococcus spp. (коагулазонегативные метициллин-чувствительные/метициллин-умеренно чувствительные штаммы), Staphylococcus aureus (метициллин-чувствительные штаммы), Staphylococcus epidermidis (метициллин-чувствительные штаммы), Staphylococcus spp. (коагулазонегативные штаммы), Streptococcus spp. группы C и G, Streptococcus agalactiae, Streptococcus pneumoniae

(пенициллин-чувствительные/умеренно чувствительные/резистентные штаммы), Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans (пенициллин-чувствительные/резистентные штаммы); *аэробных грамотрицательных микроорганизмов:* Acinetobacter baumannil, Acinetobacter spp, Actinobacillus actinimycetemcomitans, Citrobacter freundii, Eikenella corrodens, Enterobacter spp. (в т.ч. Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter cloacae), Escherichia coli, Gardnerella vaginalis, Haemophilus ducreyi, Haemophilus influenzae (ампициллин-чувствительные/резистентные штаммы), Haemophilus parainfluenzae, Helicobacter pylori, Klebsiella spp. (в т.ч. Klebsiella oxytoca, Klebsiella pneumoniae), Moraxella catarrhalis (штаммы, продуцирующие и непродуцирующие β-лактамазы), Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae (штаммы, продуцирующие и непродуцирующие пенициллиназу), Neisseria meningitidis, Pasteurella spp. (Pasteurella conis, Pasteurella dagmatis, Pasteurella multocida), Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Providencia spp. (в т.ч. Providencia rettgeri, Providencia stuartii), Pseudomonas spp. (в т.ч. Pseudomonas aeruginosa), Salmonella spp, Serratia spp. (в т.ч. Serratia marcescens); *анаэробных микроорганизмов:* Bacteroides fragilis, Bifidobacterium spp, Clostridium perfringens, Fusobacterium spp., Peptostreptococcus spp., Propionibacterum spp., Veilonella spp.; *других микроорганизмов:* Bartonella spp, Chlamydia pneumoniae, Chlamydia psittaci, Chlamydia trachomatis, Legionella spp. (в т.ч. Legionella pneumophila), Mycobacterium spp. (в т.ч. Mycobacterium leprae, Mycobacterium tuberculosis), Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneumoniae, Rickettsia spp., Ureaplasma urealyticum.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь левофлоксацин быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. Прием пищи мало влияет на скорость и полноту абсорбции. При дозе 500 мг биодоступность левофлоксацина после приема внутрь составляет почти 100%. После приема разовой дозы 500 мг C_{max} составляет 5.2-6.9 мкг/мл, время достижения C_{max} - 1.3 ч.

Распределение

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

Метаболизм

В печени небольшая часть окисляется и/или дезацетилируется.

Выведение

Выводится из организма преимущественно почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. После приема внутрь около 87% дозы выводится с мочой в неизмененном виде в течение 48 ч, менее 4% - с калом в течение 72 ч. $T_{1/2}$ - 6-8 ч.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

— острый синусит;

— обострение хронического бронхита;

— внебольничная пневмония;

— осложненные инфекции мочевыводящих путей (включая пиелонефрит);

— неосложненные инфекции мочевыводящих путей;

— простатит;

— инфекции кожи и мягких тканей;

— септицемия/бактериемия, связанные с указанными выше показаниями;

— интраабдоминальная инфекция.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Пиелит
- Пиелонефрит

- Пневмония
- Простатит
- Синусит

Противопоказания:

— эпилепсия;

— поражения сухожилий при ранее проводившемся лечении хинолонами;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к левофлоксацину или к другим хинолонам.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов пожилого возраста, в связи с высокой вероятностью наличия сопутствующего снижения функции почек, при дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 или 2 раза/сут. Таблетки не разжевывают и запивают достаточным количеством жидкости (1/2-1 стакана). Препарат можно принимать перед или между приемами пищи. Доза определяется в зависимости от характера и тяжести инфекции, а также чувствительности предполагаемого возбудителя.

Пациентам с **нормальной или умеренно сниженной функцией почек (КК>50 мл/мин)** рекомендуется следующий режим дозирования препарата.

Синусит: по 500 мг 1 раз/сут в течение 10-14 дней.

Обострение хронического бронхита: по 250-500 мг 1 раз/сут в течение 7-10 дней.

Внебольничная пневмония: по 500 мг 1-2 раза/сут в течение 7-14 дней.

Неосложненные инфекции мочевыводящих путей: по 250 мг 1 раз/сут в течение 3 дней.

Простатит: по 500 мг 1 раз/сут в течение 28 дней.

Осложненные инфекции мочевыводящих путей, включая пиелонефрит: по 250 мг 1 раз/сут в течение 7-10 дней.

Инфекции кожи и мягких тканей: по 250 мг 1 раз/сут или по 500 мг 1-2 раза/сут в течение 7-14 дней.

Септицемия/бактериемия: по 250-500 мг 1-2 раза/сут в течение10-14 дней (после в/в введения для продолжения терапии).

Интраабдоминальная инфекция: по 250-500 мг 1 раз/сут в течение 7-14 дней (в комбинации с антибактериальными препаратами, действующими на анаэробную флору, после в/в введения для продолжения терапии).

У **пациентов с нарушениями функции почек** применяют следующий режим дозирования.

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: 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 ПАПД)	затем: по 125 мг/48 ч	затем: по 125 мг/24 ч	затем: по 125 мг/24 ч

После гемодиализа или постоянного амбулаторного перитонеального диализа не требуется введения дополнительных доз.

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

Для **пациентов пожилого возраста** не требуется изменения режима дозирования, за исключением случаев низкого

КК.

Как и при применении других антибиотиков, лечение препаратом Лефокцин таблетки по 250 мг и 500 мг рекомендуется продолжать не менее 48-78 ч после нормализации температуры тела или после достоверного уничтожения возбудителя.

Если пропущен прием препарата, надо как можно скорее принять таблетку, пока не приблизилось время очередного приема. Далее продолжать принимать Лефокцин по схеме.

Побочное действие:

Определение частоты побочных эффектов: часто - 1-10%; иногда - <1%; редко - < 0.1%; очень редко - < 0.01%; отдельные случаи < 0.01%.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, диарея, повышение активности печеночных ферментов (АЛТ, АСТ); иногда - потеря аппетита, рвота, боли в животе, нарушения пищеварения; редко - диарея с кровью (может являться признаком колита и даже псевдомембранозного колита), повышение уровня билирубина в сыворотке крови; очень редко - печеночные реакции (гепатит).

Со стороны обмена веществ: очень редко - гипогликемия (особое значение имеет для пациентов с сахарным диабетом); возможные признаки гипогликемии: значительно повышенный аппетит, нервозность, испарина, дрожь. При применении хинолонов имеется риск обострения порфирии, что нельзя исключить при лечении препаратом Лефокцин.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: иногда - головная боль, головокружение и/или оцепенение, сонливость, нарушения сна; редко - депрессия, беспокойство, психотические реакции (например, с галлюцинациями), парестезии в кистях рук, тремор, психомоторное возбуждение, спутанность сознания, судорожный синдром, тревога.

Со стороны органов чувств: очень редко - нарушения зрения и слуха, нарушения вкусовой чувствительности и обоняния, понижение тактильной чувствительности.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - усиление сердцебиения, снижение АД; очень редко - сосудистый (шокоподобный) коллапс; в отдельных случаях - удлинение интервала QT.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - поражения сухожилий (включая тендинит), суставные и мышечные боли; очень редко - разрыв сухожилий (например, ахиллова сухожилия), мышечная слабость (имеющая особое значение для больных с бульбарным синдромом); в отдельных случаях - поражения мышц (рабдомиолиз).

Со стороны мочевыделительной системы: редко - повышение уровня креатинина в сыворотке крови; очень редко - ухудшение функции почек вплоть до острой почечной недостаточности, например, вследствие аллергических реакций (интерстициальный нефрит).

Со стороны системы кроветворения: иногда - повышение количества эозинофилов, уменьшение количества лейкоцитов; редко - нейтропения; тромбоцитопения, что может сопровождаться усилением кровоточивости; очень редко - агранулоцитоз и развитие тяжелых инфекций (стойкое или рецидивирующее повышение температуры тела, ухудшение самочувствия); в отдельных случаях - гемолитическая анемия, панцитопения.

Аллергические реакции: иногда - зуд и покраснение кожи; редко - анафилактические и анафилактоидные реакции с такими симптомами, как крапивница, бронхоспазм и возможно - тяжелое удушье; очень редко - ангионевротический отек (например, в области лица и глотки), внезапное падение АД и шок, фотосенсибилизация, аллергический пневмонит; васкулит; в отдельных случаях - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла) и экссудативная многоформная эритема. Общим реакциям повышенной чувствительности могут иногда предшествовать более легкие кожные реакции. Названные выше реакции могут развиться уже после первой дозы через несколько минут или часов после введения препарата.

Прочие: иногда - общая слабость (астения); очень редко - лихорадка. Любая антибиотикотерапия может вызывать изменения микрофлоры (бактерии и грибы), которая в норме присутствует у человека. По этой причине может произойти усиленное размножение бактерий и грибов, устойчивых к применяемому антибиотику (вторичная инфекция и суперинфекция), которое в редких случаях может потребовать дополнительного лечения.

Передозировка:

Симптомы: спутанность сознания, головокружение, нарушения сознания и приступы судорог по типу эпилептических припадков; возможны желудочно-кишечные расстройства (например, тошнота) и эрозивные поражения слизистых оболочек. В исследованиях при применении левофлоксацина в чрезмерно высоких дозах было показано удлинение интервала QT.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Левофлоксацин не выводится посредством диализа (гемодиализа, перитонеального диализа и постоянного перитонеального диализа). Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении хинолонов и препаратов, которые способны снижать порог судорожной готовности, наблюдается выраженное усиление этого эффекта. В равной мере это касается также одновременного применения хинолонов и теофиллина, фенбуфена или сходных с ним НПВС (для лечения ревматических заболеваний).

Действие препарата Лефокцин значительно уменьшается при одновременном применении с сукральфатом, а также с магнийсодержащими или алюминийсодержащими антацидными средствами (для лечения изжоги и гастралгий), солями железа (для лечения анемии). Лефокцин следует принимать не менее, чем за 2 ч до или через 2 ч после приема этих средств. С карбонатом кальция взаимодействия не выявлено.

При одновременном применении антагонистов витамина К необходим контроль состояния свертывающей системы крови.

Выведение (почечный клиренс) левофлоксацина незначительно замедляется под действием циметидина и пробенецида. Следует отметить, что это взаимодействие практически не имеет никакого клинического значения. Тем не менее, при одновременном применении лекарственных средств типа пробенецида и циметидина, блокирующих канальцевую секрецию, лечение Лефокцином следует проводить с осторожностью, особенно у пациентов с нарушениями функции почек.

Лефокцин незначительно увеличивает $T_{1/2}$ циклоспорина.

Прием ГКС повышает риск разрыва сухожилий.

При приеме этанола на фоне терапии Лефокцином повышается риск развития таких побочных эффектов, как головокружение или оцепенение, сонливость и расстройства зрения.

Особые указания и меры предосторожности:

При лечении пациентов старческого возраста следует иметь в виду, что они часто страдают от нарушений функции почек.

При тяжелом воспалении легких, вызванном пневмококками, Лефокцин может не дать оптимального терапевтического эффекта.

Госпитальные инфекции, вызванные определенными возбудителями (Pseudomonas aeruginosa), могут потребовать комбинированного лечения.

Во время лечения препаратом Лефокцин возможно развитие приступа судорог у больных с предшествующим поражением головного мозга, обусловленным, например, инсультом или тяжелой травмой. Судорожная готовность может повышаться и при одновременном применении фенбуфена, сходных с ним НПВС или теофиллина.

Несмотря на то, что фотосенсибилизация отмечается при применении Лефокцина очень редко, во избежание ее пациентам не рекомендуется подвергаться сильному солнечному или искусственному ультрафиолетовому облучению.

При подозрении на псевдомембранозный колит следует немедленно отменить Лефокцин и начать соответствующее лечение. В таких случаях нельзя применять лекарственные средства, угнетающие моторику кишечника.

Редко возникающий при применении препарата Лефокцин тендинит (прежде всего воспаление ахиллова сухожилия) может привести к разрыву сухожилий. Разрыв ахиллова сухожилия может наблюдаться в течение 48 ч после начала лечения и носить двусторонний характер. У пациентов пожилого возраста, а также при лечении ГКС повышается риск разрыва сухожилия. При подозрении на тендинит следует немедленно прекратить терапию препаратом Лефокцин и начать соответствующее лечение пораженного сухожилия, прежде всего, обеспечив ему состояние покоя.

С осторожностью следует проводить лечение Лефокцином у пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы в связи с возможным разрушением эритроцитов (гемолиз).

Использование в педиатрии

Лефокцин противопоказан для лечения детей и подростков ввиду вероятности поражения суставных хрящей.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Следует иметь в виду, что во время лечения препаратом Лефокцин возможно развитие таких побочных эффектов, как головокружение или оцепенение, сонливость и расстройства зрения, что ухудшает способность к концентрации внимания и быстрым психомоторным реакциям. Это следует учитывать при необходимости вождения автотранспорта, обслуживания машин и механизмов, при выполнении работ в неустойчивом положении. В особой мере это касается случаев взаимодействия препарата с этанолом.

При нарушениях функции почек

У**пациентов с нарушениями функции почек** применяют следующий режим дозирования:

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: 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 ПАПД)	затем: по 125 мг/48 ч	затем: по 125 мг/24 ч	затем: по 125 мг/24 ч

После гемодиализа или постоянного амбулаторного перитонеального диализа не требуется введения 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.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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