Леволет Р (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 прозрачный или слабо опалесцирующий бледно-желтого цвета.

	1 мл	**1 фл.**
левофлоксацина гемигидрат	5.12 мг	512 мг,
что соответствует содержанию левофлоксацина	5 мг	500 мг

Вспомогательные вещества: декстроза, хлористоводородная кислота, натрия гидроксид, вода д/и.

100 мл - флаконы из полиэтилена низкой плотности (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибактериальный препарат группы фторхинолонов широкого спектра действия. Блокирует ДНК-гиразу

(топоизомеразу II) и топоизомеразу IV, нарушает суперспирализацию и сшивку разрывов ДНК, подавляет синтез ДНК, вызывает глубокие морфологические изменения в цитоплазме, клеточной стенке и мембранах.

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

Чувствительные микроорганизмы (МПК менее 2 мг/мл)

Аэробные грамположительные микроорганизмы: Corynebacterium diphtheriae, Enterococcus spp. (в т.ч. Enterococcus faecalis), Listeria monocytogenes, Staphylococcus spp. (коагулаза-отрицательные метициллин-чувствительные/умеренно чувствительные штаммы, лейкотоксинсодержащие штаммы), включая Staphylococcus aureus (метициллин-чувствительные штаммы), Staphylococcus epidermidis (метициллин-чувствительные штаммы); Streptococcus spp. групп C и G, Streptococcus agalactiae, Streptococcus pneumoniae (пенициллин-чувствительные/умеренно-чувствительные/резистентные штаммы), Streptococcus pyogenes, Streptococcus группы viridans (пенициллин-чувствительные/резистентные штаммы).

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: Acinetobacter spp. (в т.ч. Acinetobacter baumannil), Actinobacillus actinomycetemcomitans, Citrobacter freundii, Eikenella corrodens, Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter spp. (в т.ч. 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 (продуцирующие и непродуцирующие β-лактамазу штаммы), Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae (продуцирующие и непродуцирующие пенициллиназу штаммы), Neisseria meningitidis, Pasteurella spp. (в т.ч. 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), Serratia spp. (в т.ч. Serratia marcescens), Salmonella spp.

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

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

Умеренно чувствительные микроорганизмы (МПК более 4 мг/л)

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

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: Burkholderia cepacia, Campylobacter jejuni, Campylobacter coli.

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

Устойчивые микроорганизмы (МПК более 8 мг/л)

Аэробные грамположительные микроорганизмы: Corynebacterium jeikeium, Staphylococcus aureus (метициллин-резистентные штаммы), прочие Staphylococcus spp. (коагулаза-отрицательные метициллин-резистентные штаммы).

Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: Alcaligenes xylosoxidans.

Другие микроорганизмы: Mycobacterium avium.

Фармакокинетика

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

Всасывание

После в/в инфузии левофлоксацина в дозе 500 мг в течение 1 ч здоровым добровольцам средняя величина C_{max} в плазме составила 6.2±1.0 мкг/мл, T_{max} - 1.0±0.1 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы - 30-40%.

После однократного и многократного в/в введения в дозе 500 мг средний Vd левофлоксацина составляет 89-112 л.

Хорошо проникает в органы и ткани: легкие, слизистую оболочку бронхов, мокроту, органы мочеполовой системы, полиморфно-ядерные лейкоциты, альвеолярные макрофаги.

Метаболизм

В печени небольшая часть левофлоксацина окисляется и/или дезацетилируется.

Выведение

При приеме внутрь $T_{1/2}$ составляет 6-8 ч. После однократного в/в введения в дозе 500 мг $T_{1/2}$ составляет 6.4±0.7 ч. Выводится из организма преимущественно почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. Почечный клиренс составляет 70% общего клиренса. Менее 5% левофлоксацина экскретируется в виде метаболитов. В моче за период 24 ч обнаруживается в неизмененном виде 70%, а за 48 ч - 87% принятой внутрь или введенной в/в дозы. В кале за период 72 ч выявляется 4% принятой внутрь или введенной в/в дозы дозы.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При почечной недостаточности уменьшение клиренса препарата и его выведения почками зависит от степени снижения КК.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания легкой и средней степени тяжести, вызванные чувствительными к препарату возбудителями:

— внебольничная пневмония (для раствора для инфузий);

— в составе комплексной терапии лекарственно устойчивых форм туберкулеза;

— осложненные инфекции почек и мочевыводящих путей, включая пиелонефрит;

— неосложненные инфекции мочевыводящих путей;

— простатит;

— септицемия/бактериемия, связанная с указанными выше показаниями;

— интраабдоминальные инфекции.

Относится к болезням:

- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Простатит
- Туберкулез

Противопоказания:

— эпилепсия;

— поражения сухожилий, связанные с приемом хинолонов в анамнезе;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к левофлоксацину или к другим хинолонам;

— повышенная чувствительность к вспомогательным компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, пациентам пожилого возраста (высокая вероятность наличия сопутствующего снижения функции почек).

Способ применения и дозы:

Препарат вводят в/в.

Доза определяется характером и тяжестью инфекции, а также чувствительностью предполагаемого возбудителя.

При *внебольничной пневмонии* - по 500 мг 1-2 раза/сут. Курс лечения - 7-14 дней.

При *неосложненных инфекциях мочевыводящих путей* - 250 мг 1 раз/сут. Курс лечения - 3 дня.

При *осложненных инфекциях мочевыводящих путей (включая пиелонефрит)* - 250 мг 1 раз/сут. При тяжелых инфекциях доза может быть увеличена. Курс лечения - 7-10 дней.

При *бактериальном простатите* - 500 мг 1 раз/сут. Курс лечения - 28 дней.

При *септицемии/бактериемии* - по 500 мг 1-2 раза/сут. Курс лечения - 10-14 дней.

При *интраабдоминальных инфекциях* - по 500 мг 1 раз/сут. Курс лечения - 7-14 дней, в комбинации с антибактериальными препаратами, действующими на анаэробную флору.

В *составе комплексной терапии лекарственно-устойчивых форм туберкулеза* - по 500 мг 1-2 раз/сут (500-1000 мг левофлоксацина в сутки), в зависимости от тяжести течения заболевания и применяемой схемы терапии. Курс лечения - до 3 мес.

Пациентам с незначительно нарушенной функцией почек (КК >50 мл/мин) коррекции дозы препарата не требуется.

Пациентам с нарушением функции почек требуется коррекция режима дозирования, в зависимости от величины КК.

Клиренс креатинина	**Дозы для в/в введения**		
	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 125 мг/24 ч	затем 250 мг/24 ч	затем 250 мг/12 ч
19-10 мл/мин	затем 125 мг/48 ч	затем 125 мг/24 ч	затем 125 мг/12 ч
<10 мл/мин (включая гемодиализ и постоянный амбулаторный перитонеальный диализ)	затем 125 мг/48 ч	затем 125 мг/24 ч	затем 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 в крайне незначительной мере.

Препарат Леволет Р, в форме раствора для инфузий, вводят в/в капельно медленно. Продолжительность введения препарата в дозе 500 мг (100 мл инфузионного раствора/500 мг левофлоксацина) должна составлять не менее 60 мин.

Раствор препарата Леволет Р совместим со следующими инфузионными растворами: 0.9% раствор натрия хлорида, 5% раствор декстрозы (глюкозы), 2.5% раствор Рингера с декстрозой, комбинированные растворы для парентерального питания (аминокислоты, углеводы, электролиты). Раствор препарата нельзя смешивать с гепарином или растворами с щелочной реакцией (например, с раствором натрия гидрокарбоната).

При положительной динамике клинического состояния больного через несколько дней лечения можно перейти от в/в капельного введения на пероральный прием препарата в той же дозе.

Продолжительность лечения, в зависимости от течения заболевания, составляет не более 14 дней (за исключением бактериального простатита). Как и при применении других антибиотиков, лечение препаратом Леволет Р рекомендуется продолжать в течение минимум 48-72 ч после нормализации температуры тела или после достоверной эрадикации возбудителя.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов классифицируется в зависимости частоты встречаемости случая: часто (1-10%), иногда (0.1-1%), редко (0.01-0.1%), очень редко (менее 0.01%), включая отдельные сообщения.

Со стороны системы кроветворения: иногда - эозинофилия, лейкопения; редко - нейтропения, тромбоцитопения;

очень редко - выраженный агранулоцитоз; в отдельных случаях - гемолитическая анемия, панцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, диарея, повышение активности АЛТ, АСТ, дисбактериоз; иногда - потеря аппетита, рвота, боли в животе, нарушения пищеварения, гипербилирубинемия; редко - диарея с кровью (в очень редких случаях это может являться признаком воспаления кишечника или псевдомембранозного колита); очень редко - гепатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - тахикардия, снижение АД; очень редко - сосудистый коллапс; в отдельных случаях - удлинение интервала QT.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: иногда - головная боль, головокружение, сонливость, нарушения сна; редко - парестезии в кистях, дрожь, беспокойство, состояния страха, приступы судорог и спутанность сознания; очень редко - психотические реакции типа галлюцинаций и депрессий, расстройства движений.

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

Со стороны обмена веществ: очень редко - гипогликемия (проявляющаяся резким повышением аппетита, нервозностью, испариной, дрожью); в отдельных случаях - обострение имеющейся порфирии.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - гиперкреатининемия; очень редко - ухудшение функции почек вплоть до острой почечной недостаточности (например, вследствие аллергических реакций - интерстициальный нефрит).

Со стороны костно-мышечной системы: редко - поражения сухожилий (включая тендинит), суставные и мышечные боли; очень редко - разрыв сухожилия (в т.ч. разрыв ахиллова сухожилия, который может носить двусторонний характер и проявляться в течение 48 ч после начала лечения), мышечная слабость (имеет особое значение для больных миастенией); в отдельных случаях - рабдомиолиз.

Аллергические реакции: иногда - зуд и покраснение кожи; редко - анафилактические и анафилактоидные реакции (проявляющиеся такими симптомами, как крапивница, бронхоспазм и возможное тяжелое удушье, а также - в редких случаях - отеки лица, гортани); очень редко - резкое снижение АД, анафилактический шок; в отдельных случаях - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла) и экссудативная многоформная эритема, аллергический пневмонит, васкулит.

Дерматологические реакции: очень редко - фотосенсибилизация.

Прочие: иногда - астения; очень редко - стойкая лихорадка, развитие суперинфекции.

Местные реакции: часто при в/в введении - боль, покраснение, флебит.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, эрозивные поражения слизистых оболочек ЖКТ, удлинение интервала QT, спутанность сознания, головокружение, судороги.

Лечение: симптоматическое, диализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Увеличивает $T_{1/2}$ циклоспорина.

Степень всасывания левофлоксацина снижают лекарственные средства, угнетающие моторику кишечника, сукральфат, антацидные лекарственные средства, содержащие соли алюминия и магния, а также препараты, содержащие соли железа (необходим перерыв между приемом не менее 2 ч).

НПВС, теофиллин повышают судорожную готовность.

ГКС повышают риск разрыва сухожилий.

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

При одновременном применении с непрямыми антикоагулянтами (включая варфарин) необходимо контролировать свертываемость крови.

Особые указания и меры предосторожности:

При тяжелой пневмонии, вызванной Streptococcus pneumoniae, левофлоксацин может быть не эффективен.

Введение должно осуществляться в течение не менее 60 мин, во время введения может отмечаться сердцебиение и транзиторное снижение АД, редко может развиваться коллапс.

При выраженном снижении АД введение левофлоксацина прекращают.

При подозрении на развитие псевдомембранозного колита, обусловленного Clostridium difficile, лечение левофлоксацином отменяют и назначают соответствующую терапию.

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 повышается риск развития гемолиза.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении транспортных средств и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с незначительно нарушенной функцией почек (КК >50 мл/мин) коррекции дозы препарата не требуется.

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

При нарушениях функции печени

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

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста (высокая вероятность наличия сопутствующего снижения функции почек).

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С; не замораживать.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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