# Мофлаксия



## 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 таблеток в блистере из комбинированного материала ОПА/Ал/ПВХ — алюминиевой фольги. По 1 или 2 бл. (по 5 табл.), или по 1 бл. (по 7 табл.), или по 1 бл. (по 10 табл.) помещают в пачку картонную.

Для стационаров: по 5, 10, 14, 16 или 20 бл. (по 5 табл.) или по 10 бл. (по 7 табл.), или по 5, 7, 8, или 10 бл. (по 10 табл.) помещают в пачку картонную.

## Состав:

| | |
|---|---|
| Таблетки, покрытые пленочной оболочкой | 1 табл. |
| *ядро* | |
| *активное вещество:* | |
| моксифлоксацина гидрохлорид | 454,75 мг |
| эквивалентно моксифлоксацину — 400 мг | |
| *вспомогательные вещества:* МКЦ — 186,05 мг; кроскармеллоза натрия — 32 мг; магния стеарат — 6 мг | |
| *оболочка пленочная:* гипромеллоза — 12,6 мг; макрогол 4000 — 4,2 мг; титана диоксид (Е171) — 3,78 мг; краситель железа оксид красный (Е172) — 0,42 мг | |

## Описание:

Капсуловидные, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-розового цвета.

*Вид на поперечном разрезе:* ярко-желтая шероховатая масса с пленочной оболочкой темно-розового цвета.

## Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

## Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — бактерицидное широкого спектра, антибактериальное.

***Фармакодинамика***

*Механизм действия.* Моксифлоксацин — бактерицидный антибактериальный препарат широкого спектра действия, 8-метоксифторхинолон.

Бактерицидное действие моксифлоксацина обусловлено ингибированием бактериальных топоизомераз II и IV, что приводит к нарушению процессов репликации, репарации и транскрипции биосинтеза ДНК микробной клетки и, как следствие, к гибели микробных клеток.

Минимальные бактерицидные концентрации моксифлоксацина в целом сопоставимы с его МИК.

*Механизмы резистентности.* Механизмы, приводящие к развитию устойчивости к пенициллинам, цефалоспоринам, аминогликозидам, макролидам и тетрациклинам, не влияют на антибактериальную активность моксифлоксацина.

Перекрестная устойчивость 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.

Установлено, что добавление в структуру молекулы моксифлоксацина метоксигруппы в положении С8 увеличивает активность моксифлоксацина и снижает образование резистентных мутантных штаммов грамположительных бактерий. Присоединение бициклоаминовой группы в положении С7 предупреждает развитие активного эффлюкса, механизма резистентности к фторхинолонам.

Моксифлоксацин в условиях *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 β-лактамным и макролидным антибиотикам.

*Влияние на кишечную микрофлору человека.* В двух исследованиях у добровольцев, отмечались следующие изменения кишечной микрофлоры после приема моксифлоксацина внутрь: снижение концентраций *Escherichia coli, Bacillus spp., Bacteroides vulgatus, Enterococcus spp., Klebsiella spp.,* а также анаэробов *Bifidobacterium spp., Eubacterium spp., Peptostreptococcus spp.* Эти изменения были обратимыми в течение 2 нед. Токсин *Clostridium difficile* не обнаружен.

*Тестирование чувствительности in vitro* Спектр антибактериальной активности моксифлоксацина представлен в таблице 1:

Таблица 1

***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 P450.

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:

Имеются ограниченные данные о передозировке моксифлоксацина. Не отмечено каких-либо побочных эффектов при применении моксифлоксацина в дозе до 1200 мг однократно и по 600 мг в течение 10 дней и более.

*Лечение:* в случае передозировки следует ориентироваться на клиническую картину и проводить симптоматическую поддерживающую терапию с ЭКГ-мониторингом. Применение активированного угля сразу после приема внутрь может помочь предотвратить чрезмерное системное воздействие моксифлоксацина в случае 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/Moflaksiya