

Моксифлоксацин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Моксифлоксацин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство из группы фторхинолонов, действует бактерицидно. Проявляет активность в отношении широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, анаэробных, кислотоустойчивых и атипичных бактерий: *Mycoplasma* spp., *Chlamydia* spp., *Legionella* spp. Эффективен в отношении бактериальных штаммов, резистентных к бета-лактамам и макролидам. Активен в отношении большинства штаммов микроорганизмов: грамположительные - *Staphylococcus aureus* (включая штаммы, нечувствительные к метициллину), *Streptococcus pneumoniae* (включая штаммы, устойчивые к пенициллину и макролидам), *Streptococcus pyogenes* (группа А); грамотрицательные - *Haemophilus influenzae* (включая как продуцирующие, так и не продуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis* (включая как продуцирующие, так и не продуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Escherichia coli*, *Enterobacter cloacae*; атипичные - *Chlamydia pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae*. По данным исследований *in vitro*, хотя перечисленные ниже микроорганизмы чувствительными к моксифлоксацину, тем не менее безопасность и эффективность его при лечении инфекций не была установлена. Грамположительные микроорганизмы: *Streptococcus milleri*, *Streptococcus mitior*, *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus dysgalactiae*, *Staphylococcus cohnii*, *Staphylococcus epidermidis* (включая штаммы, чувствительные к метициллину), *Staphylococcus haemolyticus*, *Staphylococcus hominis*, *Staphylococcus saprophyticus*, *Staphylococcus simulans*, *Corynebacterium diphtheriae*. Грамотрицательные микроорганизмы: *Bordetella pertussis*, *Klebsiella oxytoca*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter agglomerans*, *Enterobacter Intermedius*, *Enterobacter sakazaki*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Morganella morganii*, *Providencia rettgeri*, *Providencia stuartii*. Анаэробные микроорганизмы: *Bacteroides distasonis*, *Bacteroides eggerthii*, *Bacteroides fragilis*, *Bacteroides ovatus*, *Bacteroides thetaiotaomicron*, *Bacteroides uniformis*, *Fusobacterium* spp., *Porphyromonas* spp., *Porphyromonas anaerobius*, *Porphyromonas asaccharolyticus*, *Porphyromonas magnus*, *Prevotella* spp., *Propionibacterium* spp., *Clostridium perfringens*, *Clostridium ramosum*. Атипичные микроорганизмы: *Legionella pneumophila*, *Caxiella burnettii*.

Блокирует топоизомеразы II и IV, ферменты, контролируемые топологические свойства ДНК, и участвующие в репликации, репарации и транскрипции ДНК. Действие моксифлоксацина зависит от его концентрации в крови и тканях. Минимальные бактерицидные концентрации почти не отличаются от минимальных подавляющих концентраций.

Механизмы развития резистентности, инактивирующие пенициллины, цефалоспорины, аминогликозиды, макролиды и тетрациклины, не влияют на антибактериальную активность моксифлоксацина. Перекрестная резистентность между моксифлоксацином и этими препаратами отсутствует. Плазмидно-опосредованный механизм развития резистентности не наблюдался. Общая частота развития резистентности - низкая. Исследования *in vitro* показали, что резистентность к моксифлоксацину развивается медленно в результате ряда последовательных мутаций. При многократном воздействии на микроорганизмы моксифлоксацином в субминимальных подавляющих концентрациях лишь незначительно повышаются показатели МПК. Между препаратами из группы фторхинолонов наблюдается

Моксифлоксацин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

перекрестная резистентность. Однако некоторые грамположительные и анаэробные микроорганизмы, устойчивые к другим фторхинолонам, чувствительны к моксифлоксацину.

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 пределах 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 в 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 неизменном виде, так и в виде неактивных сульфосоединений и глюкуронидов.

Выводится с мочой, а также с калом, как в неизменном виде, так и в виде неактивных метаболитов. При однократной дозе 400 мг около 19% выводится в неизменном 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:

Моксифлоксацин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

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.

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.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают моксифлоксацин при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Moksifloksacin>