Моксифлоксацин Канон



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
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 thetaiotaornicron, 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 топоизомеразами II и IV, ферменты, контролирующие 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 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 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 Р450.

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.

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_Kanon