

Пефлоксацин



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство группы фторхинолонов широкого спектра действия. Оказывает бактерицидное действие, ингибируя репликацию ДНК бактерий на уровне ДНК-гиразы, оказывает также действие на РНК и синтез белков бактерий.

Действует на грамотрицательные бактерии, находящиеся как в стадии деления (фаза роста), так и в стадии покоя. В отношении грамположительных штаммов действует только на клетки, находящиеся в процессе митотического деления. Проявляет активность в отношении внутриклеточных возбудителей.

Активен в отношении грамположительных бактерий: *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, *Staphylococcus saprophyticus*; грамотрицательных бактерий: *Escherichia coli*, *Klebsiella* spp., *Enterobacter* spp., *Serratia* spp., *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Citrobacter* spp., *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Haemophilus ducreyi*, *Haemophilus influenzae*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Aeromonas* spp., *Campylobacter* spp., *Legionella* spp., *Moraxella* spp., *Morganella* spp., *Pasteurella* spp., *Providencia* spp., *Pseudomonas aeruginosa*, *Yersinia* spp., *Ureaplasma urealyticum*.

К пефлоксацину умеренно чувствительны: *Acinetobacter* spp., *Gardnerella vaginalis*, *Mycoplasma* spp., *Chlamydia* spp; слабочувствительны: *Streptococcus* spp. (в т.ч. *Streptococcus pneumoniae*), *Enterococcus* spp.

Фармакокинетика

После однократной инфузии в дозе 400 мг C_{max} пефлоксацина составляет 4 мкг/мл и поддерживается в течение 12-15 ч. После в/в инфузии фармакокинетические параметры такие же, как после приема внутрь. AUC при обоих способах применения одинакова, что свидетельствует о полной абсорбции пефлоксацина.

После приема внутрь пефлоксацин быстро абсорбируется из ЖКТ. После однократного приема внутрь 400 мг пефлоксацина через 20 мин абсорбируется 90% дозы, при этом C_{max} достигается через 1-2 ч и составляет через 1.5 ч 4 мкг/мл. Биодоступность – около 100%.

Связывание с белками плазмы составляет 25-30%. V_d - 1.5-1.8 л/кг. Пефлоксацин быстро проникает в ткани, органы и жидкости организма (клапаны аорты, митральный клапан, сердечная мышца, кости, брюшная полость, перитонеальная жидкость, желчный пузырь, предстательная железа, слюна, мокрота, ткани поджелудочной железы /в т.ч. некротизированные/). Концентрация пефлоксацина в перечисленных жидкостях и тканях выше концентрации в плазме крови.

$T_{1/2}$ составляет примерно 8-10 ч, при повторном введении - 12-13 ч. Выводится преимущественно с мочой (60% в течение 72 ч). 30% выводится с желчью в неизменном виде, частично в виде метаболитов: норфлоксацина, пефлоксацин-N-оксида и пефлоксацин-глюкуронида. Содержание неизмененного пефлоксацина в моче через 1-2 ч после приема – 25 мкг/мл, через 12-24 ч – 15 мкг/мл. Неизмененный пефлоксацин и его метаболиты обнаруживаются в моче в течение 84 ч после последнего введения препарата. Коэффициент экстракции пефлоксацина при гемодиализе – 23%.

Показания к применению:

Лечение инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к пефлоксацину микроорганизмами: инфекции печени и желчевыводящих путей; сепсис и бактериальный эндокардит; стафилококковый менингит и менингит, вызванный грамотрицательной флорой; инфекции костей и суставов; инфекции нижних отделов дыхательных путей; инфекции ЛОР-органов; инфекции мочевыводящих путей; инфекции брюшной полости; гинекологические инфекции; инфекции кожи и мягких тканей; заболевания, передаваемые половым путем.

Лечение и профилактика инфекционных осложнений после хирургических вмешательств.

Относится к болезням:

- [Инфекции](#)
- [Инфекции мочевыводящих путей](#)
- [Менингит](#)
- [Сепсис](#)
- [Эндокардит](#)

Противопоказания:

Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, беременность, период лактации (грудное вскармливание), детский и подростковый возраст до 15 лет, повышенная чувствительность к пефлоксацину и другим фторхинолонам.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально, в зависимости от локализации и тяжести течения инфекции, а также чувствительности микроорганизма.

При приеме внутрь средняя доза составляет 800 мг/сут в 2 приема.

При инфекциях тяжелого течения вводят в/в капельно: первая доза - 800 мг, затем - по 400 мг каждые 12 ч. При нарушениях функции почек легкой степени вводят по 400 мг каждые 24 ч, при более выраженных нарушениях - каждые 36 ч.

Для пациентов с заболеваниями печени при в/в капельном введении разовая доза составляет 8 мг/кг; продолжительность инфузии - 1 ч. Частота проведения инфузий составляет у пациентов с желтухой 1 раз в 24 ч; у пациентов с асцитом - 1 раз в 36 ч; у пациентов с желтухой и асцитом - 1 раз в 48 ч.

Максимальная суточная доза составляет 1.2 г/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боли в животе.

Со стороны ЦНС: головная боль, бессонница.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, артралгия.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (при применении в дозе 1.6 г/сут).

Дерматологические реакции: фотосенсибилизация.

Аллергические реакции: кожный зуд, крапивница.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Пефлоксацин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

В экспериментальных исследованиях установлено токсическое воздействие монофторхинолонов на хрящевую ткань.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении пефлоксацина и аминогликозидов отмечается синергизм в отношении синегнойной палочки; с непрямymi антикоагулянтами - возможно усиление их действия.

Абсорбция пефлоксацина замедляется при одновременном приеме с антацидами, содержащими алюминия гидроксид и магния гидроксид.

Одновременный прием пефлоксацина и циметидина приводит к снижению общего клиренса и увеличению $T_{1/2}$ пефлоксацина.

Пефлоксацин угнетает микросомальное окисление в клетках печени, воздействуя на ферменты системы цитохрома P450. Поэтому пефлоксацин замедляет метаболизм теофиллина в печени, что приводит к повышению концентрации теофиллина в плазме.

Пефлоксацин нельзя смешивать с растворами, содержащими ионы хлора, во избежание выпадения осадка.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с атеросклерозом сосудов головного мозга, нарушениями мозгового кровообращения, эпилепсией, судорожным синдромом неустановленной этиологии, с выраженными нарушениями функции печени.

В период лечения следует избегать ультрафиолетового излучения.

Возможно комбинированное применение пефлоксацина с бета-лактамами антибиотиками и рифампицином с целью профилактики развития резистентности бактерий к последним.

При нарушениях функции почек

Применение возможно согласно режиму дозирования.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют у пациентов с выраженными нарушениями функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 15 лет.

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