Пефлоксацин-АКОС (концентрат)



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пефлоксацин

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 оболочкой белого или белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
пефлоксацина мезилат	200 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный или картофельный, поливинилпирролидон, лактоза, кальция стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, тальк.

Состав оболочки: оксипропилцеллюлоза, полиэтиленоксид 4000, титана диоксид, 1,2-пропиленгликоль, тальк или Opadry.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
пефлоксацина мезилат	400 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный или картофельный, поливинилпирролидон, лактоза, кальция стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, тальк.

Состав оболочки: оксипропилцеллюлоза, полиэтиленоксид 4000, титана диоксид, 1,2-пропиленгликоль, тальк или Opadry.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Раствор для инфузий прозрачный, желтоватого или зеленовато-желтоватого цвета.

	1 мл	**1 амп.**
пефлоксацин (в форме мезилата)	80 мг	400 мг

Вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота, спирт бензиловый, натрия пиросульфит, динатриевая соль этилендиаминтетрауксусной кислоты, натрия карбонат, вода д/и.

5 мл - ампулы (5) - пачки картонные.
5 мл - ампулы (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробный препарат широкого спектра действия из группы фторхинолонов. Оказывает бактерицидное действие, блокируя ДНК-гиразу, нарушает репликацию А-субъединицы ДНК и РНК и синтез белков бактерий.

В отношении грамотрицательных бактерий действует на клетки, находящие в стадии покоя и деления, в отношении грамположительных бактерий - только на клетки, находящиеся в процессе митотического деления. Устойчив к действию β-лактамаз. Обладает широким спектром действия.

Препарат *активен в отношении аэробных грамотрицательных бактерий:* Escherichia coli, Klebsiella spp., индол-положительные и индол-отрицательные Proteus spp. (в т.ч. Proteus mirabilis), Enterobacter spp., Helicobacter pylori, Morganella morganii, Yersinia enterocolitica, Vibrio cholerae, Vibrio parahaemolyticus, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Haemophilus influenzae, Pseudomonas aeruginosa, Moraxella catarrhalis, Pasteurella multocida, Campylobacter spp., Serratia spp., Citrobacter spp., Salmonella spp., Shigella spp., Haemophilus spp., Neisseria gonorrhoeae; *аэробных грамположительных бактерий:* Staphylococcus spp., (в том числе, продуцирующие и не продуцирующие пенициллиназу и метициллинрезистентные), Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus pyogenes, Streptococcus agalactiae), Corynebacterium diphtheriae, Listeria monocytogenes; *внутриклеточных бактерий:* Legionella spp. (в т.ч. Legionella pneumophila), Brucella spp., Chlamydia spp., Mycoplasma spp.

К препарату *умеренно чувствительны:* Pneumococcus spp. (Streptococcus pneumoniae), Acinetobacter spp., Clostridium perfringens, Pseudomonas spp., Chlamydia trachomatis.

К препарату *устойчивы* грамотрицательные анаэробные бактерии - Bacteroides spp. (за исключением B.fragilis), Treponema spp., Mycobacterium tuberculosis.

Фармакокинетика

Всасывание

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 90-120 мин и составляет 4 мкг/мл. После многократного введения C_{max} в плазме крови - 10 мкг/мл, концентрация в слизистой оболочке бронхов - 5 мкг/мл; соотношение между концентрацией в слизистой оболочке и в крови - 100%.

После в/в введения C_{max} достигается в течение 60 мин.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 25-30%. V_d - 1.5-1.8 л/кг. Пефлоксацин хорошо проникает в ткани и жидкости организма (бронхиальный секрет, легкие, предстательную железу, спинномозговую жидкость, перитонеальную жидкость, костную ткань, сердце, мокроту, мочу, желчь). Концентрация в перечисленных жидкостях и тканях выше концентрации в плазме крови.

Концентрация в спинномозговой жидкости после трехкратного приема в дозе 400 мг - 4.5 мкг/мл, при увеличении дозы до 800 мг - 9.8 мкг/мл; соотношение между концентрацией в плазме и жидкости - 89%. Концентрация в других органах и тканях через 12 ч после последнего приема: щитовидная железа - 11.4 мкг/г, слюнные железы - 2.2 мкг/г, кожа - 7.6 мкг/г, миндалины - 9 мкг/г, мышцы - 5.6 мкг/г.

Метаболизм

Метаболизируется в печени путем метилирования до диметилпефлоксацина (обладает значительной антибактериальной активностью), окисляется до N-оксида и конъюгирует с глюкуроновой кислотой с образованием пефлоксацина-глюкуронида.

Выведение

$T_{1/2}$ после приема внутрь составляет примерно 8-10 ч, при повторном введении - 12-13 ч; $T_{1/2}$ после в/в введения однократной дозы - 7.2-13 ч, при повторном введении - 14-15 ч. Выводится с мочой (60%) и с калом в неизмененном виде, частично - в виде метаболитов. 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 препарату микроорганизмами:

—инфекции почек и мочевыводящих путей;

—инфекции ЖКТ (в т.ч. сальмонеллез, брюшной тиф);

—инфекции желчного пузыря и желчевыводящих путей (в т.ч. холецистит, холангит, эмпиема желчного пузыря);

—инфекции брюшной полости (в т.ч. интраабдоминальные абсцессы, перитонит);

—инфекции органов малого таза (в т.ч. аднексит, простатит);

—инфекции костей и суставов (в т.ч. остеомиелит);

—инфекции кожи и мягких тканей;

—инфекции нижних отделов дыхательных путей;

—инфекции ЛОР-органов (в т.ч. среднего уха, придаточных пазух носа, глотки и гортани);

—инфекции глаз;

—сепсис, септицемия;

—бактериальный эндокардит;

—менингоэнцефалит;

—инфекции кожи и мягких тканей;

—гонорея;

—хламидиоз;

—простатит;

—эпидидимит;

—мягкий шанкр;

—хирургические и внутрибольничные инфекции;

—профилактика инфекционных осложнений после хирургических вмешательств.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Аднексит
- Брюшной тиф
- Гонорея
- Интраабдоминальный абсцесс
- Инфекции
- Менингит
- Менингоэнцефалия
- Остеомиелит
- Перитонит
- Простатит
- Сальмонеллез
- Сепсис
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Эмпиема
- Эмпиема желчного пузыря
- Эндокардит
- Эпидидимит

Противопоказания:

—эпилепсия;

—гемолитическая анемия;

—недостаточность глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;

—беременность;

—лактация (грудное вскармливание);

—детский и подростковый возраст до 18 лет;

—повышенная чувствительность к фторхинолонам.

С *осторожностью* назначают препарат при атеросклерозе сосудов головного мозга, нарушении мозгового кровообращения, органических поражениях ЦНС, судорожном синдроме неустановленной этиологии.

Способ применения и дозы:

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

При *неосложненных инфекциях* **взрослым** назначают внутрь по 400 мг 2 раза/сут, средняя суточная доза - 800 мг. Таблетки следует принимать внутрь, натощак, не разжевывая, запивая большим количеством воды.

При *инфекциях тяжелого течения* препарат назначают в/в капельно (в 250 мл 5% раствора глюкозы в течение 1 ч): первая доза - 800 мг, затем по 400 мг каждые 12 ч. Средняя продолжительность курса лечения - не более 1-2 недель.

Для **пациентов с нарушениями функции печени** требуется коррекция режима дозирования. При незначительных нарушениях препарат назначают по 400 мг 2 раза/сут, при более выраженных нарушениях - каждые 36 ч, при тяжелых заболеваниях печени интервал между введениями удлиняют до 2 сут. Курс лечения - не более 30 дней.

Пациентам с нарушениями функции почек (при КК менее 20 мл/мин) разовая доза составляет 50% от средней дозы при кратности назначения 2 раза/сут, или полную разовую дозу вводят 1 раз/сут.

Пациентам пожилого возраста дозу препарата уменьшают на 1/3.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: депрессия, головная боль, головокружение, бессонница, повышенная утомляемость, повышение судорожной активности, беспокойство, возбуждение, тремор; редко - судороги.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, абдоминальные боли, анорексия, метеоризм, псевдомембранозный колит, транзиторное повышение активности печеночных трансаминаз, холестатическая желтуха, гепатит, некроз печени.

Со стороны мочевыделительной системы: кристаллурия; редко - гломерулонефрит, дизурия.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения (при дозах 1.6 г/сут), агранулоцитоз, эозинофилия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, гиперемия кожи, фотосенсибилизация; редко - отек Квинке, бронхоспазм, артралгия.

Прочие: тахикардия, миалгия, тендинит, разрыв сухожилий, кандидоз.

Местные реакции: флебит.

Передозировка:

В настоящее время о случаях передозировки препарата Пефлоксацин-АКОС не сообщалось.

При случайной передозировке назначают симптоматическую терапию. При необходимости проводят гемодиализ и перитонеальный диализ. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение Пефлоксацина-АКОС и бета-лактамных антибиотиков предупреждает развитие резистентности при лечении стафилококковой инфекции

При одновременном применении Пефлоксацина-АКОС с аминогликозидами, пиперациллином, азлоциллином, цефтазидимом отмечается синергизм антибактериального действия (в т.ч. в отношении синегнойной палочки).

При одновременном применении Пефлоксацина-АКОС и непрямых антикоагулянтов отмечается снижение протромбинового индекса (поэтому при необходимости назначения данной комбинации следует контролировать картину периферической крови).

Фармакокинетическое взаимодействие

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 периода полувыведения пефлоксацина, но не изменяет объем распределения и почечный клиренс.

Пефлоксацин-АКОС замедляет метаболизм теофиллина в печени, что приводит к повышению концентрации теофиллина в плазме и в ЦНС (поэтому при необходимости назначения данной комбинации следует уменьшить дозу теофиллина).

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение пефлоксацина.

Фармацевтическое взаимодействие

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

Несовместим с гепарином.

Особые указания и меры предосторожности:

При смешанных инфекциях, перфоративных процессах в брюшной полости, при инфекциях органов малого таза Пефлоксацин-АКОС комбинируют с препаратами, активными в отношении анаэробов (метронидазол, клиндамицин).

В период лечения пациенты должны получать большое количество жидкости для предотвращения кристаллурии.

Вследствие возможной фотосенсибилизации в период лечения Пефлоксацином-АКОС следует избегать УФ-излучения.

При тяжелых заболеваниях печени и почек требуется коррекция режима дозирования.

При возникновении во время или после лечения Пефлоксацином-АКОС тяжелой и длительной диареи необходимо исключить псевдомембранозный колит (при этом требуется немедленная отмена препарата и назначение соответствующей терапии).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управление механизмами

При применении препарата следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек (при КК менее 20 мл/мин) разовая доза составляет 50% от средней дозы при кратности назначения 2 раза/сут, или полную разовую дозу вводят 1 раз/сут.

При нарушениях функции печени

Для **пациентов с нарушениями функции печени** требуется коррекция режима дозирования. При незначительных нарушениях препарат назначают по 400 мг 2 раза/сут, при более выраженных нарушениях - каждые 36 ч, при тяжелых заболеваниях печени интервал между введениями удлиняют до 2 сут. Курс лечения - не более 30 дней.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям и подросткам до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Срок годности препарата в форме таблеток - 3 года, в форме раствора для инфузий - 2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Pefloksacin-AKOS_koncentrat