

Рокситромицин



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "164" на одной стороне; вид на поперечном разрезе: белого цвета.

	1 таб.
рокситромицин	150 мг

Вспомогательные вещества: гипролоза - 19.65 мг, поллоксамер - 150 мкг, повидон К30 - 4.2 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.875 мг, магния стеарат - 1.875 мг, тальк - 2.25 мг, крахмал кукурузный - до 210 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 2.78 мг, декстроза - 1.12 мг, титана диоксид - 270 мкг, пропиленгликоль - 830 мкг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Полусинтетический антибиотик из группы макролидов, обладающий широким спектром антибактериальной активности. Оказывает бактериостатическое действие: связываясь с 50S субъединицей рибосом, подавляет реакции транслокации и транспептидации, процесс образования пептидных связей между аминокислотами и пептидной цепью, тормозит синтез белка рибосомами, в результате чего угнетает рост и размножение бактерий. Хорошее проникновение в клетку обеспечивает эффективность рокситромицина в отношении внутриклеточных возбудителей (в том числе *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia pneumoniae*, *Ureaplasma urealyticum*, *Legionella pneumophila*, *Mycoplasma pneumoniae*).

In vitro к препарату чувствительны: *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus pneumoniae*, *Neisseria meningitidis*, *Listeria monocytogenes*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia psittaci*, *Ureaplasma urealyticum*, *Legionella pneumophila*, *Helicobacter pylori*, *Gardnerella vaginalis*, *Bordetella pertussis*, *Moraxella catarrhalis*, *Haemophilus ducreyi*. Следующие микроорганизмы продемонстрировали переменную чувствительность in vitro: *Streptococcus pyogenes* (бета-гемолитический стрептококк группы A), *Staphylococcus aureus*, *Haemophilus influenzae*, *Staphylococcus epidermidis*.

Рокситромицин также эффективен в отношении анаэробных микроорганизмов: *Bacteroides oralis*, *Bacteroides melanogenicus*, *Bacteroides urealyticus*; *Clostridium perfringens*; *Eubacterium* spp., *Peptococcus* spp., *Peptostreptococcus* spp., *Propionibacterium acnes*; *Rickettsia rickettsii*, *Rickettsia conorii*.

К препарату резистентны: *Bacteroides fragilis*, *Clostridium difficile*, *Pseudomonas* spp.; *Acinetobacter* spp., семейство Enterobacteriaceae.

Фармакокинетика

Быстро всасывается из ЖКТ после перорального приема. Рокситромицин стабилен в кислой среде желудка, прием пищи через 15 минут после приема таблетки не оказывает влияния на всасывание. $C_{\max}$ после приема внутрь 150 мг - 6,6 мг/л, время достижения максимальной концентрации ($TC_{\max}$) - 2,2 ч, после приема 300 мг - 9,6 мг/л и 1,5 ч соответственно. У детей $C_{\max}$ (при 2-кратном приеме 2,5 мг/кг/сут) - 8,7-10,1 мг/л и достигается через 2 ч. Прием с интервалом в 12 ч обеспечивает сохранение эффективных концентраций в крови в течение 24 ч. Равновесная концентрация (C_{ss}) в плазме при приеме 150 мг 2 раза в сутки в течение 10 дней достигается через 2-4 дня и составляет 9,3 мг/л; при приеме 300 мг 1 раз в сутки в течение 11 дней - 10,9 мг/л. Связь с белками плазмы крови составляет 96%. Характеризуется высоким проникновением в ткани, особенно в легкие, небные миндалины и предстательную железу. Рокситромицин также хорошо проникает в клетки (макрофаги) и жидкости организма. Практически не проникает через гематоэнцефалический барьер. Рокситромицин в незначительных количествах выводится в грудное молоко. Объем распределения - 31,2 л.

Частично метаболизируется в печени, большая часть (более 50% активного вещества) выводится кишечником в неизмененном виде, около 12% выводится почками и около 15% - легкими. Период полувыведения рокситромицина после однократного приема в дозе 150 мг составляет в среднем 12 часов.

При недостаточности функции печени увеличивается $T_{1/2}$ и $C_{\max}$.

Показания к применению:

Инфекции легкой и средней степени тяжести, вызванные чувствительными к рокситромицину возбудителями:

У взрослых

- инфекции верхних дыхательных путей: фарингит, тонзиллит, острый синусит;
- инфекции нижних дыхательных путей: пневмония (в т.ч. пневмония, вызванная "атипичными" возбудителями, в т.ч. *Chlamydia psittaci*, *Chlamydia pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis*, *Legionella pneumophila*), бронхит;
- инфекции кожи и мягких тканей;
- инфекции мочеполового тракта, вызванные *Chlamydia trachomatis* и *Ureaplasma urealyticum*;
- инфекции в одонтологии, инфекции ротовой полости и зубов.

У детей

- инфекции верхних дыхательных путей: тонзиллит, фарингит, острый синусит;
- инфекции нижних дыхательных путей: пневмония (в т.ч., пневмония, вызванная "атипичными" возбудителями, в т.ч. *Chlamydia psittaci*, *Chlamydia pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis*, *Legionella pneumophila*), бронхит;
- инфекции кожи и мягких тканей.

Относится к болезням:

- [Бронхит](#)
- [Инфекции](#)
- [Пневмония](#)
- [Синусит](#)
- [Тонзиллит](#)
- [Фарингит](#)

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к рокситромицину, другим макролидам или другим компонентам препарата;
- беременность;
- период лактации;
- порфирия;
- одновременный прием сосудосуживающих алкалоидов спорыньи (эрготамин и дигидроэрготамин);
- одновременный прием цизаприда, пимозиды, астемизола и терфенадина;

— детский возраст до 12-ти лет или при массе тела менее 40 кг (для данной лекарственной формы).

С осторожностью: пациентам с печеночной недостаточностью; пациентам с почечной недостаточностью, пациентам старше 65 лет; пациентам с врожденным удлинением интервала QT, с состояниями, способствующими возникновению нарушений сердечного ритма (нескорректированная гипокалиемия или гипомagnesемия, клинически значимая брадикардия) и у пациентов, получающих антиаритмические препараты IA и III класса; при миастении gravis; при одновременном приеме с варфарином, дизопирамидом, дигоксином, колхицином, агонистами дофаминовых рецепторов - алкалоидами спорыньи (в т.ч. бромокриптином, каберголином, лисуридом, перголидом), циклоспорином, теофиллином.

Способ применения и дозы:

Внутрь. Препарат следует принимать перед едой, запивая достаточным количеством жидкости.

Взрослые и дети старше 12 лет (при массе тела более 40 кг): стандартная доза составляет 150 мг 2 раза в сутки, с интервалом 12 часов или 300 мг однократно (только для взрослых).

У пожилых пациентов

У пожилых пациентов разовая и суточная доза рокситромицина не изменяется.

У пациентов с почечной недостаточностью

При почечной недостаточности рокситромицин назначается в дозе 150 мг 2 раза в сутки.

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью

У больных с тяжелой печеночной недостаточностью (например, при циррозе печени с желтухой или асцитом) дозу следует уменьшать в 2 раза, то есть, 150 мг рокситромицина один раз в сутки.

Продолжительность лечения

Длительность приема рокситромицина зависит от показания к применению, микроорганизма, вызвавшего инфекцию и тяжести инфекционного процесса. У взрослых обычная продолжительность курса лечения 5-10 дней; при инфекциях, вызванных бета-гемолитическим стрептококком, курс лечения должен составлять не менее 10 дней. У детей обычная продолжительность курса лечения 5-10 дней; при инфекциях, вызванных бета-гемолитическим стрептококком, курс лечения должен составлять не менее 10 дней. Продолжительность терапии не должна превышать 10 дней.

Побочное действие:

Со стороны ЖКТ: тошнота, рвота, боли в животе, диарея (иногда с кровью), панкреатит, псевдомембранозный колит.

Со стороны печени: повышение активности «печеночных» трансаминаз (аланинаминотрансферазы (АЛТ) и аспартатаминотрансферазы (АСТ) и/или щелочной фосфатазы), острый холестатический или гепатоцеллюлярный гепатит (иногда с развитием желтухи).

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, парестезии, изменения вкусовых ощущений (включая агевзию), нарушения обоняния (включая аносмию), галлюцинации, временная потеря слуха, гипоакузия (неполная потеря слуха), вертиго.

Кожные реакции: сыпь, покраснение, пурпура.

Аллергические реакции: крапивница, ангионевротический отек, бронхоспазм, эозинофилия; анафилактический шок, многоформная экссудативная эритема.

Прочие: возможно развитие суперинфекции, кандидоза.

Передозировка:

Симптомы: возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Рокситромицин противопоказан при беременности.

Рокситромицин в незначительных количествах проникает в грудное молоко. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Рокситромицин не назначают одновременно с препаратами, содержащими эрготамин или дигидроэрготамин (сосудосуживающие алкалоиды спорыньи). Подобное сочетание может спровоцировать артериальный спазм и вызвать серьезную ишемию с развитием некроза конечностей.

При одновременном применении антибиотиков группы макролидов (таких как эритромицин) с терфенадином отмечалось повышение риска развития тяжелых осложнений со стороны сердечно-сосудистой системы, включая трепетание-мерцание желудочков и другие желудочковые аритмии. Хотя при применении рокситромицина таких реакций не наблюдалось, данное совместное применение противопоказано.

Прием таких препаратов, как астемизол, цизаприд или пимозид, которые метаболизируются с помощью изофермента CYP3A, ассоциировался с удлинением интервала QT и/или нарушениями сердечного ритма (обычно с развитием желудочковой тахикардии типа «пируэт») в результате повышения их плазменных концентраций вследствие взаимодействия с ингибиторами этого изофермента, включая некоторые антибиотики из группы макролидов. Поэтому совместное применение данных препаратов с рокситромицином противопоказано. Одновременное применение с непрямыми антикоагулянтами (варфарин) может приводить к увеличению протромбинового времени. Рекомендуется регулярно определять международное нормализованное отношение (МНО) при одновременном применении рокситромицина с непрямыми антикоагулянтами.

Рокситромицин может вытеснять дизопирамид из связи с белками плазмы, приводя к повышению его концентрации в плазме крови. Рекомендовано мониторирование ЭКГ и, по возможности, определение концентрации дизопирамида в плазме крови.

При одновременном приеме с дигоксином возможно увеличение его абсорбции, что может приводить к развитию гликозидной интоксикации. Она может проявляться такими симптомами как тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение; интоксикация сердечными гликозидами может также вызывать нарушения сердечной проводимости или нарушения сердечного ритма. Поэтому у пациентов, принимающих рокситромицин и дигоксин (или другие сердечные гликозиды), рекомендуется регулярно контролировать ЭКГ и определять плазменные концентрации сердечного гликозида. Это обязательно при появлении симптомов передозировки сердечных гликозидов.

Рокситромицин, как и другие макролиды следует применять с осторожностью у пациентов, получающих антиаритмические препараты IA и III класса (требуется ЭКГ-контроль), так как макролиды, включая рокситромицин, также как и эти антиаритмические препараты могут удлинять интервал QT и имеется возможность суммации эффектов удлинения интервала QT этих препаратов.

При одновременном применении некоторых макролидов с колхицином наблюдалось повышение плазменных концентраций колхицина с увеличением риска развития его побочных эффектов, включая нефротоксическое действие. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении рокситромицина и колхицина, хотя до настоящего времени нет данных о наличии такого взаимодействия.

При одновременном применении некоторых макролидов с агонистами дофаминовых рецепторов - алкалоидами спорыньи (в т.ч. бромокриптин, каберголин, лисурид, перголид), наблюдалось повышение плазменных концентраций последних, что может усиливать их фармакодинамическое действие и повышать риск развития их побочных эффектов. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении рокситромицина и агонистов допаминовых рецепторов - алкалоидов спорыньи, хотя до настоящего времени нет данных о наличии такого взаимодействия.

Рокситромицин, как и другие макролидные антибиотики, может увеличивать площадь под кривой «концентрация-время» и $T_{1/2}$ мидазолама, в связи с этим эффекты мидазолама могут усиливаться и пролонгироваться у пациентов, получающих лечение рокситромицином.

Отсутствуют убедительные доказательства наличия взаимодействия между рокситромицином и триазоломом.

Одновременное применение рокситромицина и теофиллина или циклоспорина может вызывать повышение плазменных концентраций последних, что не требует, как правило, коррекции режима дозирования.

При одновременном применении рокситромицина с карбамазепином, ранитидином, гидроксидами алюминия и магния, пероральными контрацептивами, содержащими эстрогены и гестагены, не наблюдалось клинически значимого взаимодействия.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с печеночной недостаточностью препарат применяется с осторожностью, под контролем функции печени и при необходимости с коррекцией дозы.

При назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью, а также пациентам пожилого возраста, необходимости в коррекции дозы нет.

При развитии суперинфекции, аллергических реакций рокситромицин следует немедленно отменить и назначить соответствующую терапию.

Как и другие макролиды, рокситромицин может утяжелять течение миастении gravis, в связи с чем, применение рокситромицина у таких пациентов требует осторожности и контроля за состоянием пациента.

При применении препарата, как на фоне приема, так и через 2-3 нед, после прекращения лечения возможно развитие диареи, вызванной *Clostridium difficile* (псевдомембранозный колит). В легких случаях достаточно отмены лечения и применения ионообменных смол (колестирамин, колестипол), в тяжелых случаях показано возмещение потери жидкости, электролитов и белка, назначение ванкомицина или метронидазола. Нельзя применять лекарственные средства, тормозящие перистальтику кишечника.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами

При применении препарата следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиями видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В случае возникновения побочных реакций со стороны нервной системы (таких как, головокружение, галлюцинации) пациентам не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности.

Условия хранения:

В защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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