Рокситромицин



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
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, полоксамер - 150 мкг, повидон K30 - 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, Chlamydiat rachomatis, Chlamydia psittaci, Ureaplasma urealyticum, Legionella pneumophila, Helicobacter pylori, Gardnerella vaginalis, Bordetella pertussis, Moraxella catarrhalis, Haemophilus ducreyi. Следующие микроорганизмы продемонстрировали вариабельную чувствительность in vitro: Streptococcus pyogenes (бета-гемолитический стрептококк группы A), Staphylococcus aureus, Haemophilus influenzae, Staphylococcus epidermidis.

Рокситромицин *также эффективен в отношении анаэробных микроорганизмов:* Bacleroides oralis, Bacteroides melaninogenicus, Bacteroides urealiticus; Clostridium perfringens; Eubacterium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Propionibactenum acnes; Rickettsia rickettsii, Rickettsia conorii.

К препарату *резистентны:* Bacleroides 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 (Css) 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, пимозида, 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 гипомагниемия, 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 триазоламом.

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