Селезолид



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

Раствор для инфузий в виде прозрачной, бесцветной или с коричневатым оттенком жидкости.

	1 мл
линезолид	2 мг

Вспомогательные вещества: натрия цитрата дигидрат - 1.64 мг, лимонная кислота безводная - 0.85 мг, декстрозы моногидрат - 50.24 мг, вода д/и - до 1 мл.

Теоретическая осмолярность 291 мОсм/л.

100 мл - бутылки (1) - пачки картонные.
200 мл - бутылки (1) - пачки картонные.
300 мл - бутылки (1) - пачки картонные.
100 мл - бутылки (48) - ящики картонные (для стационаров).
200 мл - бутылки (21) - ящики картонные (для стационаров).
300 мл - бутылки (12) - ящики картонные (для стационаров).

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство, относится к классу оксазолидинонов. Механизм действия обусловлен селективным ингибированием синтеза белка в бактериях. За счет связывания с бактериальными рибосомами линезолид предотвращает образование функционального инициирующего комплекса 70S, который является компонентом процесса трансляции при синтезе белка.

Активен в отношении аэробных грамположительных бактерий: Corynebacterium jeikeium, Enterococcus faecalis (включая гликопептид-резистентные штаммы), Enterococcus faecium (включая гликопептид-резистентные штаммы), Enterococcus casseliflavus, Enterococcus gallinarum, Listeria monocytogenes, Staphylococcus aureus (включая метициллин-резистентные штаммы), Staphylococcus aureus (штаммы с промежуточной чувствительностью к гликопептидам), Staphylococcus epidermidis (включая метициллин-резистентные штаммы), Staphylococcus haemolyticus, Staphylococcus lugdunensis, Streptococcus agalactiae, Streptococcus intermedius, Streptococcus pneumoniae (включая штаммы с промежуточной чувствительностью к пенициллину и пенициллин-резистентные штаммы), Streptococcus spp. (стрептококки групп C и G), Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans; *аэробных грамотрицательных бактерий:* Pasteurella canis, Pasteurella multocida; *анаэробных грамположительных бактерий:* Clostridium perfringens, Peptostreptococcus spp. (в т.ч. Peptostreptococcus anaerobius); *анаэробных грамотрицательных бактерий:* Bacteroides fragilis, Prevotella spp.; Chlamydia pneumoniae.

Менее активен в отношении Legionella spp., Moraxella catarrhalis, Mycoplasma spp.

Не активен в отношении Haemophilus influenzae, Neisseria spp., Enterobacteriaceae, Pseudomonas spp.

Не отмечено перекрестной резистентности между линезолидом и аминогликозидами, бета-лактамными антибиотиками, антагонистами фолиевой кислоты, гликопептидами, линкозамидами, хинолонами, рифамицинами, стрептограминами, тетрациклинами, хлорамфениколом т.к. механизм действия линезолида отличается от механизмов действия указанных антибактериальных препаратов.

Резистентность по отношению к линезолиду развивается медленно путем многостадийной мутации 23S рибосомальной РНК и происходит с частотой менее 1×10^{-9}-1×10^{-11}.

Фармакокинетика

Линезолид быстро распределяется в тканях с хорошей перфузией. V_d при достижении C_{ss} у здоровых добровольцев составляет в среднем 40-50 л. Связывание с белками плазмы крови составляет 31% и не зависит от концентрации линезолида в крови.

Установлено, что изоферменты цитохрома Р450 не участвуют в метаболизме линезолида in vitro. Линезолид также не ингибирует активность клинически важных изоферментов цитохрома Р450 (1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4). Метаболическое окисление приводит к образованию 2 неактивных метаболитов - гидроксиэтилглицина (является основным метаболитом у человека и образуется в результате неферментативного процесса) и аминоэтоксиуксусной кислоты (образуется в меньших количествах). Также описаны другие неактивные метаболиты.

Линезолид выводится, в основном, с мочой в виде гидроксиэтилглицина (40%), аминоэтоксиуксусной кислоты (10%) и неизмененного препарата (30-35%). С калом выводится в виде гидроксиэтилглицина (6%) и аминоэтоксиуксусной кислоты (3%). Неизмененный препарат практически не выводится с калом.

Показания к применению:

Лечение инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к анаэробными и аэробными грамположительными микроорганизмами (включая инфекции, сопровождающиеся бактериемией): внебольничная пневмония; госпитальная пневмония; инфекции кожи и мягких тканей; инфекции, вызванные Enterococcus spp. (в т.ч. штаммами Enterococcus faecalis и Enterococcus faecium, резистентными к ванкомицину).

Инфекции, вызванные грамотрицательными микроорганизмами, подтвержденными или подозреваемыми (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Инфекции
- Пневмония

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к линезолиду.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования и продолжительность лечения зависит от возбудителя, локализации и тяжести инфекции, а также от клинической эффективности.
Вводят в/в в виде инфузий в дозе 600 мг с интервалом 12 ч. Длительность лечения - 14-28 дней.

Пациентов, которым в начале терапии препарат назначали в/в, в дальнейшем можно перевести на любую лекарственную форму для приема внутрь. При этом подбор дозы не требуется, т.к. биодоступность при приеме внутрь составляет почти 100%.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: часто (>1%) - извращение вкуса, тошнота, рвота, диарея, боли в животе (в т.ч. спастические), метеоризм, изменение показателей общего билирубина, АЛТ, АСТ, ЩФ.

Со стороны системы кроветворения: часто (>1%) - обратимая анемия, тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения.

Прочие: часто (>1%) - головная боль, кандидоз; редко - случаи периферической невропатии и невропатии

зрительного нерва при применении более 28 дней (связь между применением линезолида и развитием невропатии не доказана).

Побочные реакции не зависят от дозы и, как правило, не требуют прекращения лечения.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения линезолида при беременности не проводилось. Применение линезолида при беременности возможно только в случаях, если предполагаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода

Неизвестно, выделяется ли линезолид с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Атопический дерматит
- Бородавки
- Витилиго
- Выпадение волос

Особые указания и меры предосторожности:

При развитии диареи на фоне применения линезолида следует учитывать риск развития псевдомембранозного колита различной степени тяжести.

В процессе лечения необходимо проводить клинический анализ крови у пациентов с повышенным риском развития кровотечения, миелосупрессией в анамнезе, а также при одновременном применении препаратов, снижающих уровень гемоглобина, количество тромбоцитов или их функциональные свойства, а также у пациентов, получающих линезолид более 2 недель.

Источник: http://drugs.thead.ru/Selezolid