

Селезолид



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#) [Википедия](#)
[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 иницирующего 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 С 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-лактамами, 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 P450 не участвуют в метаболизме линезолида *in vitro*. Линезолид также не ингибирует активность клинически важных изоферментов цитохрома P450 (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 аминоэтоксиксусной кислоты (образуется в меньших количествах). Также описаны другие неактивные метаболиты.

Линезолид выводится, в основном, с мочой в виде гидроксиэтилглицина (40%), аминоэтоксиксусной кислоты (10%) и неизмененного препарата (30-35%). С калом выводится в виде гидроксиэтилглицина (6%) и аминоэтоксиксусной 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>