Спарфлоксацин



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 от белого до светло-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе ядро от светло-желтого до желтого цвета.

	1 таб.
спарфлоксацин (в пересчете на 100 % вещество)	200 мг

Вспомогательные вещества: гипролоза - 12 мг, крахмал кукурузный - 10 мг, кремния диоксид коллоидный - 3 мг, кросповидон -3 мг, магния силикат - 3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до получения таблетки без оболочки массой 300 мг.

Вспомогательные вещества оболочки: смесь для приготовления пленочного покрытия "Инстакоат Аква II" [поливиниловый спирт - 45 %, титана диоксид - 13 %, тальк - 4%, макрогол - 14%, триацетин - 4 %, кальция фосфат - 20 %] - до получения таблетки с оболочкой массой - 310 мг.

6 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробное средство, производное фторхинолона, ингибирует бактериальную ДНК-гиразу, деспирализующую участки хромосомных молекул ДНК (необходимо для считывания генетической информации). Низкая токсичность для клеток макроорганизма объясняется отсутствием в них гираз.

Является бактерицидным противомикробным препаратом широкого спектра действия (прежде всего, в отношении грамотрицательной флоры, в этом плане близок к аминогликозидам). На грамположительные микроорганизмы оказывает бактерицидное действие только в период деления, на грамотрицательные организмы - и в период покоя, поскольку влияет не только на ДНК-гиразу, но и вызывает лизис клеточной стенки. Предотвращает транскрипцию генетического материала бактерий, необходимого для их нормального метаболизма, что приводит к быстрому снижению способности бактерий к делению. В результате его действия не происходит параллельной выработки устойчивости к другим антибиотикам, не принадлежащим к группе ингибиторов гиразы, что делает его высокоэффективным по отношению к бактериям, которые устойчивы, например, к аминогликозидам, пенициллинам, цефалоспоринам, тетрациклинам и многим другим антибиотикам.

Высоко активен в отношении Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Citrobacter spp., Klebsiella spp., Enterobacter spp., Serratia spp., Hafnia, Edwardsiella, Proteus (индол-положительные и индол-отрицательные), Providencia spp., Morganella morganii, Yersinia spp.; Vibrio spp., Aeromonas spp., Plesiomonas spp., Pasteurella spp., Haemophilus spp., Campylobacter spp., Pseudomonas cepacia, Pseudomonas aeruginosa, Legionella spp., Neisseria spp., Moraxella, Acinobacter spp., Brucella; Staphylococcus spp., Listeria spp., Corynebacterium spp., Chlamydia spp., Xanthomonas maltophilia.

Умеренно активен в отношении Gardnerella spp., Flavobacterium spp., Alcaligenes spp., Streptococcus agalactiae, Enterococcus faecalis, Streptococcus pyogenes, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus viridans, Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneurnoniae, Mycobacterium tuberculosis и Mycobacterium fortuitum. Считается активным в отношении Enterococcus faecium, Ureaplasma urealyticum, Nocardia asteroides. За некоторыми исключениями, анаэробные микроорганизмы являются умеренно чувствительными (например, Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp.) или устойчивыми (например, Bacteroides spp.).

Не активен в отношении Treponema pallidum.

Резистентность к спарфлоксацину развивается крайне медленно, поскольку практически не остается персистирующих микроорганизмов и у бактериальных клеток нет ферментов, инактивирующих его. Не отмечено перекрестной резистентности с другими противомикробным препаратам.

В отношении Pseudomonas aeruginosa и других грамотрицательных бацилл по активности уступает ципрофлоксацину. $T_{1/2}$ более продолжительный, чем у ципрофлоксацина, поэтому спарфлоксацин можно применять 1 раз/сут. Подобно ципрофлоксацину не взаимодействует с теофиллином (не ингибирует активность микросомальных ферментов печени). По способности вызвать фотосенсибилизацию ближе к ломефлоксацину, чем к другим фторхинолонам. Обладает постантибиотическим эффектом, микроорганизмы не размножаются в течение 0.5-4 ч после исчезновения активного вещества из плазмы.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбируется около 90%. Абсорбция не изменяется при приеме вместе с пищей и молоком.

Хорошо распределяется в тканях организма (исключая богатую жирами ткань, например, нервную ткань), концентрация в тканях и жидкостях нижних дыхательных путей превышает концентрацию в плазме. Обнаруживается в высоких концентрациях в альвеолярных макрофагах. Терапевтические концентрации достигаются в слюне, желчи, кишечнике, органах брюшной полости и малого таза, почках и мочевыводящих органах, легочной ткани, бронхиальном секрете, костной ткани, мышцах, синовиальной жидкости и суставных хрящах, перитонеальной жидкости, коже. Концентрация в спинномозговой и внутриглазной жидкости - 10% от концентрации в плазме. V_d - 2-3 л/кг, связывание с белками плазмы - около 45%. После приема внутрь в дозе 400 мг C_{max} в плазме крови достигается через 3-6 ч, содержание в тканях в 2-12 раз выше, чем в плазме. Сывороточная концентрация характеризуется линейной зависимостью от величины принятой дозы. Активность несколько снижается при кислых значениях pH.

Метаболизируется в печени, выводится с калом (30-50%) и мочой (тубулярная фильтрация и канальцевая секреция), из них в неизмененном виде выводится около 10% принятой внутрь дозы. $T_{1/2}$ - 16-30 ч, у больных с почечной недостаточностью $T_{1/2}$ увеличивается. При ХПН снижается процент выведения почками, но кумуляции активного вещества в организме при КК>20 мл/мин не происходит, поскольку параллельно повышается метаболизм и увеличение выведения через кишечник.

Показания к применению:

Инфекции дыхательных путей, инфекции среднего уха, придаточных пазух носа, особенно если они вызваны грамотрицательными возбудителями, включая Pseudomonas, или Staphylococcus, инфекции глаз, почек и мочевыводящих путей, половых органов (в т.ч. аднексит), негонорейный уретрит, простатит, инфекции брюшной полости (например, бактериальные инфекции ЖКТ, желчных путей, перитонит), кожи и мягких тканей, костей и суставов (например, остеомиелит), сепсис, инфекции на фоне иммунодефицита, например, на фоне лечения иммунодепрессивными средствами или у больных с нейтропенией; гонорея, хламидиоз, лепра.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Гонорея
- Инфекции
- Инфекции ЖКТ
- Лепра
- Остеомиелит
- Перитонит
- Простатит
- Сепсис
- Уретрит

Противопоказания:

Эпилепсия, удлиненный интервал QT или другие факторы, способствующие развитию аритмий (гипокалиемия, значительная брадикардия, хроническая сердечная недостаточность, фибрилляция предсердий), дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, тяжелая почечная недостаточность, беременность, период лактации (грудного вскармливания), детский и подростковый возраст до 18 лет (незавершенный процесс формирования скелета), повышенная чувствительность к спарфлоксацину.

Способ применения и дозы:

Взрослым, внутрь, независимо от приема пищи (не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости). Длительность курса лечения зависит от характера и тяжести заболевания и вида возбудителя.

При пневмонии, обострении хронического бронхита, синусите - в первый день 400 мг однократно, далее - по 200 мг/сут в течение 10 дней, пациентам с КК<50 мл/мин - в первый день 400 мг однократно, далее по 200 мг каждые 48 ч.

При инфекции мочевыводящих путей - в первый день 200 мг однократно, далее по 100 мг 1 раз/сут в течение 10-14 дней.

При остром гонорейном уретрите: 200 мг однократно.

При негонококковом уретрите в первый день - 200 мг однократно, далее - по 100 мг 1 раз/сут в течение 6 дней. При лепре - по 200 мг 1 раз/сут в течение 12 недель.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, диарея, рвота, диспепсия, боли в области живота, метеоризм, снижение аппетита, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, холестатическая желтуха (особенно у пациентов с перенесенными заболеваниями печени), гепатит, гепатонекроз.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, повышенная утомляемость, тревожность, тремор, сонливость, периферическая паралгезия (аномалия восприятия чувства боли), потливость, черепно-мозговая гипертензия, тревожность, кошмарные сновидения, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, психотические реакции, мигрень, общая слабость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: удлинение интервала QT, тромбоз церебральных артерий, тахикардия, приливы крови к коже лица, обморок.

Со стороны органов чувств: нарушения вкуса и обоняния, нарушение зрения (например, диплопия, изменение цветовосприятия), шум в ушах, снижение слуха.

Со стороны лабораторных показателей: эозинофилия, лейкопения, гранулоцитопения, анемия, тромбоцитопения, лейкоцитоз, тромбоцитоз, гемолитическая анемия, гипопротромбинемия, гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, гипергликемия, гематурия, кристаллурия (прежде всего при щелочной моче и низком диурезе).

Дерматологические реакции: зуд, лекарственная лихорадка, точечные кровоизлияния (петехии), узловатая эритема, экссудативная многоформная эритема, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), фотосенсибилизация.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, артрит, мышечные боли, тендовагинит.

Аллергические реакции: отек лица, сосудов или гортани, одышка.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении НПВС (исключая ацетилсалициловую кислоту) повышают риск развития судорог.

Пероральный прием совместно с железосодержащими препаратами, сукральфатом и антацидными препаратами, содержащими магний, алюминий, кальций, цинк, а также соли железа, приводит к снижению всасывания спарфлоксацина.

Метоклопрамид ускоряет абсорбцию спарфлоксацина.

При одновременном применении с циклоспорином отмечается повышение содержания сывороточного креатинина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при атеросклерозе сосудов головного мозга, нарушении мозгового кровообращения, эпилептическом синдроме, условиях жизни (профессиональной деятельности), не позволяющих ограничивать инсоляцию, хронической почечной недостаточности.

Следует избегать УФ-облучения в период лечения и в течение 3 дней после его окончания. Во избежание развития кристаллурии, недопустимо превышение рекомендованной суточной дозы, необходимо достаточное потребление жидкости и поддержание кислой реакции мочи.

Пища замедляет скорость всасывания.

Не рекомендуется одновременный прием спарфлоксацина с антиаритмическими препаратами классов IA и III, бепридилом, эритромицином, астемизолом, цизапридом, пентамидином, трициклическими антидепрессантами и фенотиазинами.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

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