ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

Пефлоксацин-АКОС

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Пефлоксацин-АКОС

Международное непатентованное название: пефлоксацин

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий

Состав на 5 мл.

Активное вещество: пефлоксацина мезилата дигидрат (в пересчете на пефлоксацин) – 400 мг.

Вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота, бензиловый спирт, натрия дисульфит (натрия метабисульфит), динатрия эдетат (этилендиаминтетрауксусной кислоты динатриевая соль [трилон Б]), натрия гидрокарбонат (натрий двууглекислый), вода для инъекций - до 5 мл.

Описание. Прозрачный раствор желтоватого или зеленовато-желтоватого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство - фторхинолон

Код АТХ: [J01MA03]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Противомикробное средство из группы фторхинолонов. Оказывает бактерицидное действие, ингибируя репликацию ДНК бактерий путем блокирования фермента ДНК-гиразы. В отношении грамотрицательных штаммов эффективно действует как на делящиеся клетки, так и на клетки в стадии покоя; в случае грамположительных штаммов - только на клетки, находящиеся в процессе митотического деления. Обладает широким спектром антимикробного действия.

Активен в отношении:

большинства **аэробных грамотрицательных бактерий (в т.ч. вырабатывающих бета-лактамазы)**: Escherichia coli, Klebsiella spp., индолположительные и индолотрицательные Proteus spp., в т.ч. Proteus mirabilis, Enterobacter spp., Morganella morganii, Yersinia enterocolitica, Vibrio cholerae, Vibrio parahaemolyticus, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Haemophilus influenzae, Pseudomonas aeruginosa, Moraxella catarrhalis, Pasteurella multocida, Campylobacter spp., Serratia spp., Citrobacter spp., Salmonella spp., Shigella spp.;

аэробных грамположительных бактерий: Staphylococcus spp., (в т.ч. продуцирующие и не продуцирующие пенициллиназу и метициллиноустойчивые), Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus pyogenes, Streptococcus agalactiae, кроме Streptococcus pneumoniae), Corynebacterium diphtheriae, Listeria monocytogenes;

внутриклеточных бактерий: Legionella spp. (в т.ч. Legionella pneumophila), Brucella spp., Chlamydia spp. Подавляет жизнедеятельность Mycoplasma spp. и Helicobacter spp.

Умеренно чувствительные к пефлоксацину микроорганизмы: Streptococcus pneumoniae, Acinetobacter spp., Clostridium perfringens, Pseudomonas spp., Chlamydia trachomatis.

Устойчивы к пефлоксацину: грамотрицательные анаэробы, Treponema spp., Mycobacterium tuberculosis.

Фармакокинетика

После внутривенного введения максимальная концентрация препарата в сыворотке крови достигается в течение 60 минут. Терапевтическая концентрация удерживается в течение 12-15 ч. Период полувыведения (T1/2) от 7,2 до 13 часов после однократно введенной дозы. После повторных введений период полувыведения составляет 14-15 часов.

Пефлоксацин хорошо проникает в ткани организма (слизистая бронхов, кости, сердце, спинномозговую жидкость, мокроту, мочу, секрет предстательной железы, желчь, перитониальную жидкость). Метаболизируется в печени.

Выводится почками - 60%, с желчью - 30% в неизмененном виде; частично в виде метаболитов. Концентрация неизмененного препарата в моче через 1-2 ч после приема - 25 мкг/мл, через 12-24 ч - 15 мкг/мл. Неизмененный пефлоксацин и его метаболиты обнаруживаются в моче в течение 84 ч после завершающего введения. Плохо поддается диализу (коэффициент экстракции 23%).

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к пефлоксацину микроорганизмами:

- инфекции почек и мочевыводящих путей;
- инфекции органов малого таза (в т.ч. аднексит и простатит);
- инфекции желудочно-кишечного тракта (в т.ч. сальмонеллез, брюшной тиф);
- инфекции желчного пузыря и желчевыводящих путей (холецистит, холангит, эмпиема желчного пузыря);
- инфекции брюшной полости (интраабдоминальные абсцессы, перитонит);
- инфекции костей, суставов, кожи и мягких тканей;
- инфекции нижних дыхательных путей и ЛОР-органов;
- сепсис;
- эндокардит;
- менингит бактериальный;
- гонорея;
- хламидиоз, эпидидимит, мягкий шанкр;
- профилактика хирургической инфекции.

Противопоказания

Гиперчувствительность, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (гемолитическая анемия), беременность, период лактации, эпилепсия, возраст до 18 лет.

С осторожностью.

Атеросклероз сосудов головного мозга, нарушение мозгового кровообращения, органические поражения центральной нервной системы, судорожный синдром, почечная и/или печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы

Внутривенно капельно, инфузию проводят в течение 1 часа. Первая доза – 400-800 мг; затем - по 400 мг каждые 12 ч. Курс лечения - 1-2 нед (не более 4 нед).

Приготовление раствора для инфузии: содержимое одной ампулы (400 мг = 5 мл концентрата) растворяют в 250 мл 5% раствора декстрозы. В качестве растворителя нельзя использовать раствор натрия хлорида или любой растворитель, содержащий ионы хлора!

Для *профилактики инфекционных осложнений в хирургии* рекомендуют в/в введение препарата в дозе 400-800 мг за 1 ч до проведения операции.

Для пациентов с заболеваниями печени разовая доза для в/в капельного введения составляет 8 мг/кг массы тела; продолжительность инфузии - 1 ч; частота проведения инфузий у пациентов с желтухой - 1 раз в 24 ч; у пациентов с асцитом - 1 раз в 36 ч; у пациентов с желтухой и асцитом - 1 раз в 48 ч.

Пациентам с нарушениями функции почек (при клиренсе креатинина ниже 20 мл/мин) разовая доза должна составлять 50% от средней дозы при кратности назначения 2 раза в сутки или полную разовую дозу вводят 1 раз в сутки. Лицам пожилого возраста дозу препарата уменьшают примерно на 1/3.

Вследствие эквивалентности доз при приеме внутрь и в/в введении, препарат может использоваться для проведения последовательной терапии (курс, начатый в/в введениями, продолжают приемом внутрь).

Побочное действие

Со стороны нервной системы: депрессия, головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, бессонница, повышение судорожной готовности, чувство беспокойства, возбуждение, тремор, редко - судороги.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боль в животе, снижение аппетита, метеоризм, псевдомембранозный колит, транзиторное повышение "печеночных" трансаминаз, холестатическая желтуха, гепатит, некроз печени.

Со стороны мочевыделительной системы: кристаллурия, редко - гломерулонефрит, дизурия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, гиперемия кожи, редко - ангионевротический отек, бронхоспазм, артралгии.

Со стороны кроветворной системы: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения (при дозах 1600 мг/сут), агранулоцитоз, эозинофилия.

Местные реакции: флебит.

Прочие: тахикардия, миалгия, тендинит, кандидоз, фотосенсибилизация.

Передозировка

Лечение: специфический антидот неизвестен. Симптоматическая терапия, при необходимости - гемодиализ и перитонеальный диализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Пефлоксацин снижает метаболизм теофиллина в печени, что приводит к повышению концентрации теофиллина в плазме и центральной нервной системе (во избежание развития интоксикации дозу теофиллина необходимо уменьшить).

Значительно снижает протромбиновый индекс (у пациентов, принимающих непрямые антикоагулянты, необходим постоянный контроль картины крови). Фармацевтически несовместим с гепарином. Нельзя разбавлять раствором натрия хлорида или любым растворителем, содержащим ионы хлора.

Циметидин и др. ингибиторы микросомального окисления увеличивают T1/2, снижают общий клиренс, но не влияют на объем распределения и почечный клиренс.

Одновременное применение бета-лактамных антибиотиков позволяет предупредить развитие резистентности в период лечения стафилококковой инфекции. Аминогликозиды, пиперациллин, азлоциллин, цефтазидим усиливают антибактериальный эффект (в т.ч. при инфекции синегнойной палочкой).

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение пефлоксацина.

Особые указания

Применяется в качестве монотерапии или в сочетании с другими противомикробными лекарственными средствами.

При смешанных инфекциях, при перфоративных процессах в брюшной полости, при инфекциях органов малого таза комбинируют с лекарственными средствами, активными в отношении анаэробов (метронидазол, клиндамицин).

В период лечения больные должны получать большое количество жидкости при адекватном диурезе (для предотвращения кристаллурии).

Вследствие возможного появления фотосенсибилизации в период лечения нельзя подвергаться влиянию УФ-излучения.

Для больных с тяжелыми заболеваниями печени и почек требуется коррекция дозы пропорционально степени повреждения.

При возникновении во время или после лечения пефлоксацином тяжелой и длительной диареи необходимо исключить развитие псевдомембранозного колита (требуется немедленная отмена препарата и назначение соответствующего лечения).

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Концентрат для приготовления раствора для инфузий 400 мг/5 мл.

По 5 мл в ампулы бесцветного или светозащитного нейтрального стекла.

По 10 ампул помещают в коробку из картона.

По 5 или 10 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку.

1 контурную ячейковую упаковку с 10 ампулами или 1, 2 контурные ячейковые упаковки с 5 ампулами помещают в пачку из картона.

В каждую пачку, коробку вкладывают инструкцию по применению, скарификатор ампульный.

Скарификатор ампульный не вкладывают при использования ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

Список Б. В защищенном от света месте, при температуре от 15 до 25 ^{0}С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

2 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель / организация, принимающая претензии:

Открытое акционерное общество "Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий "Синтез" (ОАО "Синтез").

640008, Россия, г. Курган, пр. Конституции, 7

Тел/факс: (3522) 48-16-89

e-mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: http://www.kurgansintez.ru

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Представитель фирмы В.И. Петухов