ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

Пефлоксацин-АКОС

Регистрационный номер _____

Торговое название препарата: Пефлоксацин-АКОС

Международное непатентованное название: пефлоксацин

Лекарственная форма: таблетки покрытые плёночной оболочкой

Состав.

Активное вещество: пефлоксацина мезилат дигидрат (в пересчете на пефлоксацин) – 200 мг, 400 мг.
Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, крахмал картофельный, лактоза (сахар молочный), повидон низкомолекулярный, целлюлоза микрокристаллическая, тальк, кальция стеарат.
Оболочка: гипромеллоза (оксипропилметилцеллюлоза), титана диоксид (титана двуокись), пропиленгликоль, макрогол (полиэтиленоксид 4000, полиэтиленгликоль 4000), тальк.

Описание. Таблетки, покрытые плёночной оболочкой, круглой формы, двояковыпуклые белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство - фторхинолон

Код АТХ: [J01MA03]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Противомикробное средство из группы фторхинолонов. Оказывает бактерицидное действие, блокирует ДНК-гиразу. В отношении грамотрицательных штаммов эффективно действует как на делящиеся клетки, так и клетки в стадии покоя; в случае грамположительных штаммов - только на клетки, находящиеся в процессе митотического деления. Обладает широким спектром действия.

Активен в отношении большинства аэробных *грамотрицательных бактерий*: 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 agalactiac, Corynebacterium diphtheriae, Listeria monocytogenes; внутриклеточных бактерий: Legionella spp. (в т.ч. Legionella pneumophila), Brucella spp., Chlamydia spp., а также в отношении бактерий, вырабатывающих бета-лактамазы. Подавляет жизнедеятельность Mycoplasma spp. и Helicobacter spp.

Умеренно чувствительные микроорганизмы:

Streptococcus pneumoniae, Acinetobacter spp., Clostridium perfringens, Pseudomonas spp., Chlamydia trachomatis. Устойчивые микроорганизмы: грамотрицательные анаэробы, Treponema spp., Mycobacterium tuberculosis. При заболеваниях, вызванных умеренно чувствительными микроорганизмами, требуется определение чувствительности in vitro. Угнетает микросомальное окисление в клетках печени.

Фармакокинетика

Абсорбция - высокая, через 20 мин после приема внутрь однократной дозы (400 мг) всасывается 90%. Время достижения максимальной концентрации (4 мкг/мл) - 90-120 мин, терапевтическая концентрация удерживается в течение 12-15 ч. После многократного введения максимальная концентрация (Cmax) в крови - 10 мкг/мл; концентрация в слизистой оболочке бронхов - 5 мкг/мл; соотношение между концентрацией в слизистой оболочке бронхов и крови - 100%. Связь с белками плазмы - 25-30%.

Хорошо проникает в ткани и жидкости организма, в т.ч. в бронхиальный секрет, легкие, предстательную железу, спинномозговую жидкость и костную ткань. Объем распределения - 1.5-1.8 л/кг. Концентрация в спинномозговой жидкости после 3-кратного приема 400 мг - 4.5 мкг/мл, при увеличении дозы до 800 мг - 9.8 мкг/мл; концентрация в спинномозговой жидкости составляет 89% от таковой в

плазме. Концентрация в других органах и тканях через 12 ч после последнего приема: щитовидная железа - 11.4 мкг/г, слюнные железы - 2.2 мкг/г, кожа - 7.6 мкг/г, слизистая оболочка носоглотки - 6 мкг/г, миндалины - 9 мкг/г, мышцы - 5.6 мкг/г.

Метаболизируется в печени путем метилирования до диметилпефлоксацина (обладает значительной антибактериальной активностью), окисляется до N-оксида и конъюгирует с глюкуроновой кислотой с образованием пефлоксацин-глюкуронида.

Период полувыведения - 8-10 ч, при повторном введении - 12-13 ч. 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

Лечение инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к препарату 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);
- инфекции костей, суставов;
- кожи и мягких тканей (в т.ч. вызванные стафилококком, устойчивым к пенициллину);
- инфекции нижних отделов дыхательных путей;
- инфекции ЛОР-органов (в т.ч. хронический синусит, тяжелый наружный отит);
- гонорея;
- хламидиоз, мягкий шанкр.

Противопоказания

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

С осторожностью

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

Способ применения и дозы

Внутрь, натощак, дозы подбираются индивидуально в зависимости от локализации и тяжести течения инфекции, а также чувствительности микроорганизмов. Назначают препарат по 1 таблетке (400 мг) 2 раза в сутки (каждые 12 ч), средняя суточная доза - 800 мг в 2 приема. Максимальная суточная доза – 1200 мг.

Таблетки глотают, не разжевывая и запивают большим количеством воды.

При лечении некоторых инфекций мочеполовой системы препарат назначают по 1 (400 мг) таблетке в сутки.

Для лечения гонореи у мужчин и женщин назначают препарат однократно в дозе 800 мг.

У больных с нарушением функции печени требуется коррекция режима дозирования: при незначительных нарушениях препарат назначают в дозе 400 мг/сут; при более выражен-ных нарушениях – каждые 36 ч; при тяжелой патологии печени интервал между введениями удлиняется до 2 сут.

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.

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, фотосенсибилизация, редко - ангионевротический отек, бронхоспазм, артралгии.

Со стороны кроветворной системы: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, эозинофилия.

Прочие: тахикардия, миалгия, тендинит, кандидоз.

Передозировка

Симптомы: тошнота, рвота, спутанность сознания, психическое возбуждение; в тяжелых случаях – потеря сознания, судороги.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь. Необходимо обеспечить медицинский контроль состояния пациента, достаточное поступление жидкости в организм больного; при необходимости проводят симптоматическую терапию. Гемодиализ не является эффективным методом удаления производных хинолона из организма.

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). Циметидин и др. ингибиторы микросомального окисления увеличивают период полувыведения, снижают общий клиренс, но не влияют на объем распределения и почечный клиренс.

Обволакивающие лекарственные средства замедляют абсорбцию.

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, вызванной синегнойной палочкой).

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение пефлоксацина.

Особые указания

При смешанных инфекциях, 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 соблюдении адекватного диуреза (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

Таблетки покрытые плёночной оболочкой 200 мг, 400 мг.

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

1, 2 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению в пачке

из картона.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 ^{0}С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 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