

ЦЕЛЕВО

Тиббиётда қўлланилишига доир йўриқнома

Препаратнинг савдо номи: Целево
Таъсир этувчи моддалар (ХПН): левофлоксацин
Дори щакли: плёнка қобик билан қопланган таблеткалар
Таркий:

Хар бир плёнка қобик билан қопланган таблетка қўйидагиларни сақлайди:
Фаол модда:

Левофлоксацина гемигидрат 512,50 мг
левофлоксацинага қатиҳ хисоблагандага 500 мг

Ёрдами қоддадар:

Қайта жалетинланган крахмал 26 мг
Маккаждукори крахмали 70 мг
Микрокристалл үзеллюлоза 51,50 мг

Лаурисульфат натрий 4 мг
Натрий крахмали гликоптия 15 мг

Кроскармеллоза натрий 15 мг
Коллоидли кремний диоксиди 2 мг

Тальк 7 мг
Магний стеарати 7 мг

Химия қатлами учун материал: ок (IC -MS 218) намлиқдан изоляция қилувчи қатлам, титан диоксида, изопропил спирти, метиленхлорид.

Плёнка қолпама материалы: ок (IG-001) ёргулиқдан ҳимояловчи қатлам, изопропил спирти, метиленхлорид

Таътиф: қапсулла шакидаги оқ рангли, иккى томонлама қавари, бир тамонида синдириш учун чизиқчаси бўлган, қобик билан қопланган таблеткалар.

Фармакотерапевтик гурухи: Кенг таъсир доирасига эга бўлган, фторхинолонлар гурухига мансуб микробларга қарши антибактериал вositса.

АТК коди: J01MA12

Фармакология ҳисусиятлари

Фармакодинамикаси

Кенг таъсир доирасига эга, фторхинолонлар гурухига мансуб, фаол модда сифатида оффлоксациннинг чапга айланувчи изомерни сақловчи микробларга қарши препарат. Бактерицид таъсир килид. ДНК – гираза (топозимераза II) ва топозимераза IV ни блокайди. ДНКнинг суперопирилизацияси узилишларни тикишини бузди, ДНК синтезини сусайтиради, микроорганизмларнинг цитоплазмасида, хужайра деворида ва мембронасида чукур морфологик ўзгаришларни чакиради. In vitro ва in vivo шароитида микроорганизмларнинг кўчлиларини штаммларига нисбатан самарали.

Левофлоксацина сезиги микроорганизмлар:

- Аэроб граммусбат микроорганизмлар: *Corynebacterium diphtheriae*; *Enterococcus faecalis*; *Listeria monocytogenes*; *Staphylococcus spp.* (коагулаза-негатив метициллинга сезигир/метициллинга ўртача сезигир штаммлари), *Staphylococcus aureus* (метициллинга сезигир/метициллинга сезигир штаммлари), *Staphylococcus epidermidis* (метициллинга сезигир штаммлари), *Staphylococcus spp.* (лейкотоксин сақловчи); *Streptococcus spp.* С ва Г групчлари, *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus pneumoniae* (пенициллинга сезигир/пенициллинга ўртча сезигир/пенициллинга – чидамли штаммлари), *Streptococcus pyogenes*, *Viridans* гурухидаги *Streptococcus pneumoniae* сезигир ва пенициллинга чидамли штаммлари) ни ҳам қўшиб;

- Аэроб грамманифий бактериалар: *Acinetobacter spp.*, шу жумладан *Acinetobacter baumannii*; *Acinobacillus actinomycetemcomitans*; *Citrobacter freundii*, *diversus*; *Eikenella corrodens*; *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter agglomerans*, *Enterobacter spp.* (шу жумладан *Enterobacter cloacae*), *Escherichia coli*, *Gardnerella vaginalis*, *Haemophilus ducreyi*, *Haemophilus influenzae* (ампициллинга сезигир/ампициллинга – чидамли штаммлари), *Haemophilus parainfluenzae*, *Helicobacter pylori*; *Klebsiella spp.* (шу жумладан *Klebsiella oxytoca*, *Klebsiella pneumoniae*), *Moraxella catarrhalis* (бета-лактамаза ишлаб чиқарувчи ва ишлаб чиқармайдаган штаммлари), *Morganella morganii*; *Neisseria gonorrhoeae* (шу жумладан пенициллинанан ишлаб чиқарувчи ва ишлаб чиқармайдаган штаммлари), *Neisseria meningitidis*, *Pasteurella spp.* (шу жумладан *Pasteurella canis*, *Pasteurella dogmatis*, *Pasteurella multocida*), *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Providencia spp.* (шу жумладан *Providencia rettgeri*, *Providencia stuartii*), *Pseudomonas spp.* (шу жумладан *Pseudomonas aeruginosa*), *Serratia spp.* (шу жумладан *Serratia marcescens*, *Salmonella spp.*;

- Анаэроб микроорганизмлар: *Bacteroides fragilis*, *Bifidobacterium spp.*, *Clostridium perfringens*, *Fusobacterium spp.*, *PeptoTreptococcus spp.*, *Propionibacterium spp.*, *Veillonella spp.*;

- Бошка микроорганизмлар: *Bartonella spp.*, *Chlamydia pneumoniae*, *Chlamydia psittaci*, *Chlamydia trachomatis*, *Legionella spp.* (шу жумладан *Legionella pneumophila*), *Mycobacterium spp.* (шу жумладан *Mycobacterium leprae*, *Mycobacterium tuberculosis*); *Mycoplasma hominis*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Rickettsia spp.*, *Ureaplasma urealyticum*.

Левофлоксацина ўртча сезиги микроорганизмлар (МПК > 4 мг/л):

- Аэроб граммусбат микроорганизмлар: *Corynebacterium urealyticum*, *Corynebacterium xerosis*, *Enterococcus faecium*, *Staphylococcus epidermidis* (метициллин-резистентни штаммлари), *Staphylococcus haemolyticus* (метициллин-резистентни штаммлари);

- Аэроб грамманифий микроорганизмлар: *Burkholderia cepacia*, *Campylobacter jejuni*, *Campylobacter coli*;

- Анаэроб микроорганизмлар: *Bacteroides thetaiotaomicron*, *Bacteroides vulgatus*, *Bacteroides ovatus*, *Prevotella spp.*, *Roriquimonas spp.*

Левофлоксацина чидамли микроорганизмлар (МПК > 8 мг/л):

- Аэроб граммусбат микроорганизмлар: *Corynebacterium urealyticum*, *Corynebacterium xerosis*, *Enterococcus faecium*, *Staphylococcus epidermidis* (метициллин-резистентни штаммлари);

- Аэроб грамманифий микроорганизмлар: *Alcaligenes xylosoxidans*;

- Бошка микроорганизмлар: *Mycobacterium avium*.

Фармакокинетикаси

Сўрилиши

Ичга қабул қилинганида левофлоксацин тез ва деярли тўлиқ сўрилди (овқат қабул қилиш сўрилиши тезлигига кам таъсир килиди).

Биоциралишиги – 99%. Плазмадаги максимал концентрацияга эришиш вақти (T_{max}) – 1-2 соат. 500 мг қабул қилинганида плазмадаги максимал концентрацияси (C_{max}) 5,2 мкг/млни ташкил қилиди.

Таксиминаниши

Плазма оқислари билан бөгланиши тахминан 30-40%. Левофлоксациннинг ўртача кумуляцияси препарат 500 мг дозада кунига 2 марта қабул қилинганида учинчи куни кузатилди. Аъзо ва тўқималарга яхши киради: ўпка, бронхларни шиллиқ қавати, балғам, сийдик-жинис тизими азольари, полиморф-ядроларни лейкоцитлар, агаюнлар макрофаглар.

Левофлоксацини C_{max} кўрсаткичлари 500 мг де препаратни перорал қабул қилинганидан кейин:

- бронхларнинг шиллиқ қаватида ва эпителланларни суюклинида мувофиқ раввишида – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

- қавати кириклинида сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса бўнда 2-4 соатни ташкил қилиди);

- ўпка тўқимасидаги – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

- простата бези тўқимасида даволашнинг учинчи куни препарат қабул қилинганидан сўнг 2, 6 ва 24 соат ўтганидан кейин мувофиқ раввишида – 8,7 мкг/г, 8,2 мкг/г ва 2,0 мкг/г;

- сийдикда қабул қилинганидан сўнг 8-12 соатдан кейин – 200 мкг/л.

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Метаболизми ва чиқарилиши

Жигарда препаратурнинг катта бўлмаган қисми оксидланади ва/ёки дезацетилланади. Ярим чиқарилиш даври ($T_{1/2}$) – 6-8 соат.

Организмдан асосан бўйраклар орқали (қабул қилинганидан кўрашади) ўпка, бронхларни шиллиқ қавати, балғам, сийдик-жинис тизими азольари, полиморф-ядроларни лейкоцитлар, агаюнлар макрофаглар.

Левофлоксацини C_{max} кўрсаткичлари 500 мг де препаратни перорал қабул қилинганидан кейин:

- бронхларнинг шиллиқ қаватида ва эпителланларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

- қавати кириклинида сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса бўнда 2-4 соатни ташкил қилиди);

- ўпка тўқимасидаги – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

- простата бези тўқимасида даволашнинг учинчи куни препарат қабул қилинганидан сўнг 2, 6 ва 24 соат ўтганидан кейин мувофиқ раввишида – 8,7 мкг/г, 8,2 мкг/г ва 2,0 мкг/г;

- сийдикда қабул қилинганидан сўнг 8-12 соатдан кейин – 200 мкг/л.

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Узга хос клиник ҳолатлардаги фармакокинетикаси

Бўйраклар фаолиятининг бузилишларидан ва бўйрак клиренсини камайишида $T_{1/2}$ ошади.

Кўллаш усули ва дозалари

Бўйрактида унга нисбатан анилланган микроорганизмлар сезуванлигини анилаш тавсия этилади.

Биоциралишиги – 99%. Плазмадаги максимал концентрацияга эришиш вақти (T_{max}) – 1-2 соат. 500 мг қабул қилинганида плазмадаги максимал концентрацияси (C_{max}) 5,2 мкг/млни ташкил қилиди.

Таксиминаниши

Плазма оқислари билан бөгланиши тахминан 30-40%. Левофлоксациннинг ўртача кумуляцияси препарат 500 мг дозада кунига 2 марта қабул қилинганида учинчи куни кузатилди. Аъзо ва тўқималарга яхши киради: ўпка, бронхларни шиллиқ қавати, балғам, сийдик-жинис тизими азольари, полиморф-ядроларни лейкоцитлар, агаюнлар макрофаглар.

Левофлоксацини C_{max} кўрсаткичлари 500 мг де препаратни перорал қабул қилинганидан кейин:

- бронхларнинг шиллиқ қаватида ва эпителланларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

- қавати кириклинида сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса бўнда 2-4 соатни ташкил қилиди);

- ўпка тўқимасидаги – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

- простата бези тўқимасида даволашнинг учинчи куни препарат қабул қилинганидан сўнг 2, 6 ва 24 соат ўтганидан кейин мувофиқ раввишида – 8,7 мкг/г, 8,2 мкг/г ва 2,0 мкг/г;

- сийдикда қабул қилинганидан сўнг 8-12 соатдан кейин – 200 мкг/л.

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Ишлаб чиқарувчи ғарбияларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

Рўйхатдан утилган гурухона сезигида сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса 2-4 соатни ташкил қилиди);

Ўзбекистон Республикаси сезигилди – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Ишлаб чиқарувчи ғарбияларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

Рўйхатдан утилган гурухона сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса 2-4 соатни ташкил қилиди);

Ўзбекистон Республикаси сезигилди – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Ишлаб чиқарувчи ғарбияларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

Рўйхатдан утилган гурухона сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (T_{max} эса 2-4 соатни ташкил қилиди);

Ўзбекистон Республикаси сезигилди – 11,3 мкг/г (T_{max} эса 4-6 соатни ташкил қилиди);

Левофлоксацин сиз мизбордорда орка мия суюқлигига киради. Простата бези/плазма концентрацияларининг нисбати ўртача – 1,84 ни ташкил қилиди.

Ишлаб чиқарувчи ғарбияларни сезигилди – 8,3 мкг/г ва 10,8 мкг/мл;

Рўйхатдан утилган гурухона сезигилди – 4,0-6,7 мкг/мл (<