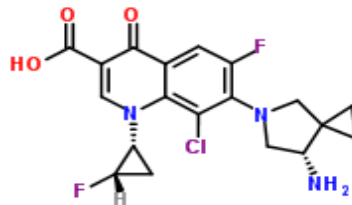


ยานำรู้

Sitafloxacin

ชลลดา มานิตเฉลิมชัย, ภ.บ.*

สูตรโครงสร้าง



ชื่อสามัญทางยา

Sitafloxacin 50 mg tablet

ชื่อการค้า

Gracevit[®] tablet

รูปแบบของยา

ยาเม็ดขนาด 50 มก.

ประเภทของยา

Antibiotic, Fluoroquinolone

ข้อบ่งใช้

ใช้รักษา Laryngopharyngitis, acute bronchitis, tonsillitis (including peritonsillitis and peritonsillar abscess), pneumonia and secondary infection of chronic respiratory disease

- ใช้รักษา Cystitis, pyelonephritis and urethritis

- ใช้รักษา Cervicitis

- ใช้รักษา Otitis media and sinusitis

- ใช้รักษา Periodontitis, pericoronitis and osteitis of jaw

กลไกการออกฤทธิ์

ยับยั้งเอนไซม์ DNA gyrase และ topoisomerase IV ของแบคทีเรีย

เภสัชจลนศาสตร์

การดูดซึม

- maximum serum concentration (C_{max})

- o 50 mg : 0.51 µg/mL

- o 100 mg : 1 µg/mL

* กลุ่มงานเภสัชกรรม โรงพยาบาลพระปกเกล้า จังหวัดจันทบุรี

- Time to Cmax
 - o 50 mg, 100 mg : 1.2 hr
- AUC_{0-∞}
 - o 50 mg : 2.62 µg x hr/mL
 - o 100 mg : 5.55 µg x hr/mL

การเปลี่ยนแปลงยา

ยานี้แทบไม่ถูกเปลี่ยนแปลงและถูกขับถ่ายออกมาในรูปเดิมในปัสสาวะ เมตาบอไลต์บางตัวอยู่ในซีรัม ปัสสาวะ อุจจาระ ได้แก่ glucuronide, 7'-oxo metabolite, 7'S-hydroxylated metabolite, glucuronide of 7'S-hydroxylated metabolite and N-acetyl conjugate

การกำจัดยาออกจากร่างกาย

- t_{1/2}
- o 50 mg : 6.2 hr
 - o 100 mg : 5.7 hr

ขนาดยา

ขนาดยาทั่วไป

- ผู้ใหญ่ : 50 มก. วันละ 2 ครั้ง (หากผู้ป่วยตอบสนองไม่ดีต่อขนาดยาปกติ อาจเพิ่มขนาดเป็น 100 มก. วันละ 2 ครั้ง)
- เด็ก : ยังไม่มีการศึกษาถึงความปลอดภัยของการใช้ยาในเด็ก และวัยรุ่น

ข้อบ่งใช้	ขนาดที่ใช้ต่อวัน	ระยะเวลาที่ใช้รักษา
Laryngopharyngitis, Acute bronchitis, tonsillitis (including peritonsillitis and peritonsillar abscess)	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	3- 7 วัน
Pneumonia and secondary infection of chronic respiratory disease	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	7 วัน
Acute cystitis	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	3 วัน
Pyelonephritis Complicated urinary tract infection	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	7-14 วัน
Urethritis and cervicitis	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	7 วัน
Otitis media and sinusitis	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	7 วัน
Acute exacerbation of chronic Otitis media and sinusitis	100 มก. วันละ 2 ครั้ง	7 วัน
Periodontitis, pericoronitis and osteitis of jaw	50 มก. วันละ 2 ครั้ง	3- 7 วัน

การปรับขนาดยาในผู้ป่วยที่มีการทำงานของไตผิดปกติ

การทำงานของไต (Clcr : ml/minute)	ขนาดยาที่แนะนำสำหรับผู้ป่วยน้ำหนัก 60 กก.
30 ≤ Clcr < 50	50 มก. วันละครั้ง
10 ≤ Clcr < 30	50 มก. ห่างกันอย่างน้อย 48 ชั่วโมง

วิธีบริหารยา

ให้ยาโดยการรับประทาน

- ระบบทางผิวหนัง : ผื่น
- อื่นๆ : eosinophillia

ข้อห้ามใช้

ผู้ป่วยที่มีประวัติแพ้ยานี้ หรือยาตัวอื่นๆ ในกลุ่ม quinolones

- สตรีมีครรภ์หรือสงสัยว่าจะตั้งครรภ์ และสตรีระหว่างให้นมบุตร
- ผู้ป่วยเด็กและวัยรุ่น

ข้อควรระวัง

- ควรทดสอบความไวต่อยาของเชื้อแบคทีเรียก่อโรคก่อนใช้ยา และระยะเวลาที่ใช้ยาไม่ควรน้อยกว่าระยะเวลาที่สั้นที่สุดในการรักษาโรค เพื่อป้องกันการดื้อยา
- ความสามารถในการทำลายเชื้อแบคทีเรียของยาอาจลดลงเมื่อให้ร่วมกับยาลดกรดที่ประกอบด้วย aluminum หรือ magnesium หรือยาที่มีส่วนประกอบของ calcium หรือธาตุเหล็ก จึงควรให้ยาเหล่านี้หลังจากได้รับ Sitaflaxacin ไปแล้วอย่างน้อย 2 ชั่วโมง
- ใช้ด้วยความระมัดระวังในผู้ป่วยที่มีการทำงานของไตบกพร่อง

อาการข้างเคียง

อาการข้างเคียงที่พบบ่อยละ 1 - ร้อยละ 10

- ระบบทางเดินอาหาร : ท้องเสีย อูจาระเหลว
- ระบบประสาทส่วนกลาง : ปวดศีรษะ
- ระบบทางเดินอาหาร : เอนไซม์ตับเพิ่มผิดปกติ

อันตรกิริยาต่อกันระหว่างยา

(Drug Interactions)

เพิ่มฤทธิ์/พิษของยา :

- ยา NSAIDs ซึ่งเป็นอนุพันธ์ของ phenylacetic acid / propionic acid (เช่น keto-profen, ibuprofen, naproxen , loxoprofen) การให้ยาร่วมกันอาจเพิ่มความเสี่ยงของการกระตุ้นระบบประสาทส่วนกลางซึ่งมีสาเหตุมาจากการยับยั้งการจับ GABA receptors ในระบบประสาทส่วนกลาง และอาจเกิดอาการชักได้

ลดฤทธิ์ของยา :

- ยาลดกรดที่ประกอบด้วย aluminum หรือ magnesium หรือยาที่มีส่วนประกอบของ calcium หรือธาตุเหล็ก เกิด Chelate เมื่อให้ร่วมกับยานี้ ทำให้รบกวนการดูดซึมของยาที่กระเพาะอาหารและลำไส้ ส่งผลให้ระดับยาดำกว่าที่ต้องการ

วิธีเก็บรักษา และความคงตัวของยา

(Storage and Stability)

เก็บยาที่อุณหภูมิห้อง

อายุของยา (Shelf-life)

24 เดือน

การศึกษาทางคลินิก (Clinical trial)

จากการศึกษาเปรียบเทียบระหว่าง sitaflaxacin และ levofloxacin ใน complicated urinary tract infections ของ Yukimichi Kawada และคณะ โดยวิธี randomized double-blind

comparative study ในผู้ป่วย complicated UTIs ที่ไม่ได้ใส่ indwelling catheters ผู้ป่วยกลุ่มแรกได้รับยา sitafloxacin 50 mg BID กลุ่มที่สองได้รับ levofloxacin 100 mg TID ผลการศึกษาพบว่ายา sitafloxacin มีประสิทธิภาพทางคลินิกไม่ด้อยไปกว่า levofloxacin และ sitafloxacin สามารถกำจัดเชื้อได้ดีกว่า levofloxacin อย่างมีนัยสำคัญทางสถิติ ส่วนด้านผลข้างเคียงพบว่า sitafloxacin มีอุบัติการณ์การเกิดผลข้างเคียงมากกว่า levofloxacin อย่างมีนัยสำคัญทางสถิติ โดยผลข้างเคียงส่วนใหญ่ของทั้ง 2 กลุ่มได้แก่ ท้องเสีย

จากการศึกษาของ Surapee Tiengrim และคณะเพื่อเปรียบเทียบฤทธิ์ของยา sitafloxacin ต่อแบคทีเรียที่แยกได้จากผู้ป่วยไทยที่ติดเชื้อ urinary tract infections และ lower respiratory tract infections โดยแบคทีเรียจำนวน 1,255 สายพันธุ์ของ *E.coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Proteus mirabilis*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Acinetobacter baumannii*, *Enterococcus spp*, *Streptococcus pneumoniae*, *Staphylococcus aureus*, *Haemophilus influenzae* and *Moraxella catarrhalis* ถูกนำมาทดสอบความไวต่อยา sitafloxacin, ciprofloxacin, levofloxacin, moxifloxacin, imipenem, amikacin, ampicillin, ceftazidime, ceftriaxone, penicillin, piperacillin/tazobactam, vancomycin, azithromycin, trimethoprim/sulfamethoxazole ด้วยวิธี agar

dilution จากการศึกษาพบว่า sitafloxacin มีฤทธิ์ต่อแบคทีเรียที่แยกได้จากผู้ป่วยไทยที่ติดเชื้อ urinary tract infections และ lower respiratory tract infections มากกว่า levofloxacin, ciprofloxacin และ moxifloxacin รวมทั้งเชื้อที่ดื้อยาต้านจุลชีพหลายขนานเช่น MRSA, ESBL-producing Gram-negatives, carbapenem-resistant *A. baumannii*

บรรณานุกรม

1. Kawada Y, Ishihara S, Matsui T, Tsugawa M, Matsumoto T, Watanabe K, et.al. Comparative study on sitafloxacin and levofloxacin in complicated urinary tract infections. *Jpn J Chemother* 2008; 56: 81-91.
2. Keating GM. Sitafloxacin: in bacterial infections. *Drugs* 2011; 71: 731-44.
3. Tiengrim S, Phiboonbanakit D, Thunyaharn S, Tantisiriwat W, Santiwatanakul S, Susaengrat W, et.al. Comparative in vitro activity of sitafloxacin against bacteria isolated from Thai patients with urinary tract infections and lower respiratory tract infections. *J Med AssocThai* 2012 ; 95 Suppl 2: S6-17.