

# ร็อกซิน

**ส่วนประกอบ**

ร็อกซิน : ใน 1 เม็ด ประกอบด้วย Roxithromycin 150 มิลลิกรัม

**ลักษณะยา**

ยาเม็ด กลม นูนเล็กน้อย เคลือบฟิล์มสีขาว ด้านหนึ่งมีอักษร BIOLAB อีกด้านหนึ่งเรียบ

**คุณสมบัติทางเภสัชวิทยา**

**เภสัชจลนศาสตร์**

**การดูดซึมยา:**

Roxithromycin ถูกดูดซึมหลังรับประทาน มีค่าชีวปริมาณประสิทธิผลประมาณร้อยละ 50 ความเข้มข้นของยาในเลือดสูงสุดประมาณ 6-8 ไมโครกรัม/มิลลิลิตร วัดได้หลังจากรับประทานขนาด 150 มิลลิกรัม 2 ชั่วโมง ระดับเข้มข้นสูงสุดของยาในเลือดคงที่เท่ากับ 9.3 ไมโครกรัม/มิลลิลิตร หลังจากรับประทานขนาด 150 มิลลิกรัม วันละ 2 ครั้ง การดูดซึมยาลดลงเมื่อรับประทานยาหลังอาหาร

**การกระจายยา:**

Roxithromycin กระจายไปสู่เนื้อเยื่อต่างๆ และของเหลวในร่างกาย ความเข้มข้นของยาสูงสุดที่เซลล์เม็ดเลือดขาว Roxithromycin ปริมาณเล็กน้อยกระจายสู่น้ำนม ประมาณร้อยละ 96 จับกับโปรตีนในเลือดโดยจับแบบอัมตั่ว และที่ความเข้มข้นของยาสูงสุดประมาณร้อยละ 87 จะจับกับโปรตีนในเลือด

**การเปลี่ยนแปลงยาในร่างกาย:**

Roxithromycin ปริมาณน้อยถูกเปลี่ยนแปลงที่ตับ และยาถูกขับออกทางอุจจาระเป็นหลักทั้งในรูปเดิม และรูปสารเมตาบอไลต์ ประมาณร้อยละ 7-10 ขับออกทางปัสสาวะ และขจัดยาออกจากร่างกายทางปอดสูงสุดร้อยละ 15

**การขจัดยาออกจากร่างกาย:**

ยาส่วนใหญ่ถูกขจัดออกทางอุจจาระ ส่วนน้อยถูกขจัดออกทางปัสสาวะและปอด ค่าครึ่งชีวิตของการขจัดยาออกจากร่างกายคือประมาณ 8-13 ชั่วโมง แต่ในผู้ป่วยที่การทำงานของตับหรือไตผิดปกติและในเด็กอาจใช้เวลานานกว่านี้

**เภสัชพลศาสตร์**

Roxithromycin เป็นยาฆ่าเชื้อกลุ่ม Macrolide ที่ออกฤทธิ์กว้างโดยมีฤทธิ์ยับยั้งการเติบโตของเชื้อแบคทีเรียแกรมบวก มากกว่าแบคทีเรียแกรมลบ รวมทั้งเชื้ออื่น เช่น *Mycoplasma* spp. บางสายพันธุ์, Chlamydiaceae, *Rickettsia* spp. และ Spirochaetes

Roxithromycin จับกับไรโบโซม 50S แบบชั่วคราว จึงมีผลยับยั้งกระบวนการ Transpeptidation หรือ Translocation ในการสังเคราะห์โปรตีน ทำให้หยุดการเจริญเติบโตของเชื้อ แมื่อยางจะออกฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเชื้อ แต่เมื่อความเข้มข้นของยาในเลือดสูงก็มีผลฆ่าเชื้อที่ไวต่อยานี้เช่นกัน

Roxithromycin ออกฤทธิ์กว้าง เชื่อว่าไวต่อยานี้ ได้แก่

**Gram-positive cocci:**

*Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Staphylococcus aureus* และ enterococcus บางสายพันธุ์

**Gram-positive organism อื่นๆ:**

*Bacillus anthracis*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Erysipelothrix rhusiopathiae*, *Listeria monocytogenes*, Anaerobic *Clostridium* spp., *Propionibacterium acnes* และ *Nocardia* spp.

**Gram-negative cocci:**

*Neisseria meningitidis* และ *Moraxella catarrhalis*

**Gram-negative organisms อื่นๆ:**

*Bordetella* spp., *Brucella* บางสายพันธุ์, *Flavobacterium*, *Legionella* spp., *Haemophilus ducreyi*, *Helicobacter pylori* และ *Campylobacter jejuni*

**เชื้ออื่น ๆ:**

*Treponema pallidum*, *Borrelia burgdorferi*, *Mycobacterium scrofulaceum* และ *M. kansasii*

**ของไข**

รักษาโรคติดเชื้อต่างๆ ที่เกิดจากเชื้อที่ไวต่อตัวยานี้ โดยเฉพาะอย่างยิ่งการติดเชื้อที่หู คอ จมูก หลอดลมและปอด อวัยวะสืบพันธุ์ (ไม่รวมการติดเชื้อเนื่องจากหนองในเทียม) และผิวหนัง ไขในการป้องกันโรคสมองอักเสบเนื่องจากเชื้อ Meningococcus ในผู้ที่สัมผัสผู้ป่วยโรคนี้

**ขนาดและวิธีใช้**

Roxithromycin เป็นยารับประทาน ใช้สำหรับรักษาการติดเชื้อที่ไวต่อยานี้ ผู้ใหญ่รับประทานครั้งละ 150 มิลลิกรัม วันละ 2 ครั้ง หรืออาจรับประทานครั้งละ 300 มิลลิกรัม วันละครั้ง เป็นเวลา 5-10 วัน โดยรับประทานก่อนอาหารอย่างน้อย 15 นาที ผู้ป่วยที่การทำงานของตับและไตบกพร่องจำเป็นต้องปรับขนาดยา

ขนาดยา Roxithromycin สำหรับเด็กที่น้ำหนัก 6-40 กิโลกรัม คือ 5-8 มิลลิกรัม/กิโลกรัมน้ำหนักตัว

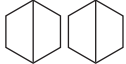
**ข้อห้ามใช้**

ห้ามใช้ Roxithromycin ในผู้ป่วยที่แพ้ยาฆ่าเชื้อกลุ่ม Macrolide หรือแพ้ส่วนประกอบอื่นในผลิตภัณฑ์นี้

**ข้อควรระวัง**

Pseudomembranous colitis:

อาการนี้เกิดเมื่อใช้ยาฆ่าเชื้อเกือบทุกชนิด ระดับความรุนแรงของอาการอาจเกิดขึ้นหรือเกิดมาจนถึงเป็นอันตรายต่อชีวิต ดังนั้น ผู้ป่วยที่มีอาการท้องเสียเมื่อได้รับยาฆ่าเชื้อแบคทีเรีย ควรได้รับการวินิจฉัยอาการ Pseudomembranous colitis และประเมินการรักษา โดยหากระดับความรุนแรงของอาการน้อยให้หยุดยา Roxithromycin หากอาการรุนแรงปานกลางถึงมากจะต้องทำการรักษาเพิ่มเติมโดยโอสารน้ำ, กลีโอสร, โปรตีน และให้ฆ่าเชื้อแบคทีเรียที่มีผลต่อชื่อ *C. difficile*



**ผลต่อหัวใจ:**

หัวใจเต้นไม่เป็นจังหวะ ประกอบด้วย หัวใจเต้นเร็ว และ Torsades de pointes พบรายงานการเกิดภาวะ Prolonged QT interval ในผู้ป่วยบางรายที่ได้รับยาฆ่าเชื้อกลุ่ม Macrolide

**Hepatotoxicity:**

การรับประทาน Roxithromycin ทำให้เกิดภาวะ Cholestatic hepatitis แต่ไม่บ่อยนัก อาการที่พบคือ ู้อัก ไม่สบาย, คลื่นไส้, อาเจียน, ปวดท้อง และเป็นไข้

**Myasthenia gravis:**

Roxithromycin ทำให้อาการอ่อนล้าในผู้ป่วย Myasthenia gravis แย่ลง

**ปฏิกิริยาการแพ้:**

Roxithromicin ทำให้เกิดการแพ้ที่รุนแรง คือ Anaphylaxis ได้

**การทำงานของตับบกพร่อง:**

เนื่องจาก Roxithromycin ถูกจัดออกจากร่างกายทางตับเป็นส่วนใหญ่ ดังนั้นควรระมัดระวังการใช้ยานี้ ในผู้ป่วยที่การทำงานของตับบกพร่อง

**ปฏิกิริยาระหว่างกันของยา**

Roxithromycin เกิดปฏิกิริยากับยาอื่นที่เปลี่ยนแปลงยาโดยใช้ Cytochrome P450 isoenzymes โดยเฉพาะ ยาที่มีผลต่อ CYP1A2 และ CYP3A4 ปฏิกิริยาดังกล่าวทำให้เกิดผลข้างเคียงรุนแรงเมื่อใช้ยา Roxithromycin ร่วมกับยา aztemizole, cisapride และ terfenadine ซึ่งมีผลทำให้หัวใจเต้นผิดปกติ

กลไกการเกิดปฏิกิริยาระหว่างกันของยา Roxithromycin คือการยับยั้งการทำงานของ Normal flora ในทางเดินอาหาร ทำให้มีผลต่อการเปลี่ยนแปลงยา Digoxin นอกจากนี้ Roxithromycin ยังยับยั้งกระบวนการ Transportation ของ P-glycoprotein ของ Digoxin ที่ลำไส้และไต รับประทาน Digoxin ในเลือดจึงสูงขึ้น การใช้ Roxithromycin ร่วมกับยา Spiramycin และ Levodopa มีผลกระทบต่อการทำงานของลำไส้ ยา Roxithromycin ไม่เกิดปฏิกิริยากับยาลดกรด, Carbamazepine, ยาคุมกำเนิดชนิดรับประทาน, Prednisolone หรือ Ranitidine

**สตรีมีครรภ์**

ไม่มีข้อมูลการใช้ยาในสตรีมีครรภ์

**การใช้ยาในสตรีที่เลี้ยงดูบุตรควายน้ำนมตนเอง**

Roxithromycin ปริมาณเล็กน้อยขับออกทางน้ำนมมารดา จึงควรใช้ด้วยความระมัดระวัง

**อาการไม่พึงประสงค์**

Roxithromycin อาจทำให้เกิดอาการผิดปกติในทางเดินอาหาร, ไตอักเสบเฉียบพลัน, Acute eosinophilic pneumonia, ตับอ่อนอักเสบเฉียบพลัน, ลำไส้อักเสบ, ปวดท้อง, ตับอ่อนโต, Serum amylase เพิ่มขึ้น และ Eosinophilia

**การได้รับยาเกินขนาด**

อาการพิษที่เกิดจากการได้รับยากลุ่ม Macrolide เกินขนาด คือ คลื่นไส้, อาเจียน, Epigastric distress และท้องเสีย

การรักษาด้วยวิธีระดับประคอง และเหนี่ยวนำให้เกิดการขจัดยาที่ยังไม่ถูกดูดซึมออกจากร่างกาย อีกทั้งติดตามดูแลอาการปฏิกิริยาการแพ้ยา และเฝ้าการรักษาผู้ป่วยตามอาการที่เกิดขึ้น การพอกเลือดและการล้างไตไม่มีประสิทธิภาพในการรักษาภาวะการได้รับยาเกินขนาด

**การเก็บรักษา**

เก็บที่อุณหภูมิไม่เกิน 30 องศาเซลเซียส

**ขนาดบรรจุ**

บรรจุอูลูมิเนียมฟอยล์ 10 เม็ด อยู่ในกล่องกระดาษ 10 แผง

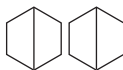
ผลิตโดย  
**บริษัท ไบโอแลบ จำกัด**  
625 นิคมอุตสาหกรรมบางปู จ.สมุทรปราการ

ผู้แทนจำหน่าย  
**BIOPHARM บริษัท ไบโอฟาร์ม เคมิคัลส์ จำกัด**  
55 อาคารไบโอเฮาส์ สุขุมวิท 39 กรุงเทพฯ โทร. 0-2258-9999

วันที่ปรับปรุงล่าสุด : สิงหาคม 2556

LET012/C

# ROXCIN



## COMPOSITION

Roxcin ; Each tablets contains : Roxithromycin 150 mg

## PRODUCT DESCRIPTION

Round, biconvex, white film-coated tablets, impressed "BIO", "LAB" on one surface.

## PHARMACOKINETICS / PHARMACODYNAMICS PROPERTIES

### Pharmacokinetics Properties

#### Absorption:

Roxithromycin is absorbed after oral doses with a bioavailability of about 50%. Peak plasma concentrations of about 6 to 8 micrograms/mL occur around 2 hours after a single dose of 150 mg. The mean peak plasma concentration at steady state after a dose of 150 mg twice daily is 9.3 micrograms/mL. Absorption is reduced when taken after a meal.

#### Distribution:

Roxithromycin is widely distributed into tissues and body fluids; high concentrations are taken up into white blood cells. Small amounts of roxithromycin are distributed into breast milk. It is about 96% bound to plasma proteins at trough concentrations, but binding is saturable, and only about 87% is bound at usual peak concentrations.

#### Metabolism:

Small amounts of roxithromycin are metabolized in the liver, and the majority of a dose is excreted in the faeces as unchanged drug and metabolites; about 7 to 10% is excreted in urine, and up to 15% via the lungs.

#### Elimination:

The elimination half-life is reported to range from about 8 to 13 hours, but may be more prolonged in patients with hepatic or renal impairment and in children.

### Pharmacodynamic Properties

Roxithromycin is a macrolide antibacterial with a broad and essentially bacteriostatic action against many Gram-positive and to a lesser extent some Gram-negative bacteria, as well as other organisms including some *Mycoplasma* spp., Chlamydiaeae, *Rickettsia* spp., and spirochaetes.

Roxithromycin bind reversibly to the 50S subunit of the ribosome, resulting in blockage of the transpeptidation or translocation reactions, inhibition of protein synthesis, and hence inhibition of cell growth. Its action is mainly bacteriostatic, but high concentrations are slowly bactericidal against the more sensitive strains.

Roxithromycin has a broad spectrum of activity. The following pathogenic organisms are usually sensitive to roxithromycin.

#### Gram-positive cocci:

*Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Staphylococcus aureus*, and some enterococcal strains.

#### Other Gram-positive organism:

*Bacillus anthracis*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Erysipelothrix rhusiopathiae*, *Listeria monocytogenes*, Anaerobic *Clostridium* spp., *Propionibacterium acnes* and *Nocardia* spp.

#### Gram-negative cocci:

*Neisseria meningitidis* and *Moraxella catarrhalis*.

#### Other Gram-negative organisms:

*Bordetella* spp., some *Brucella* strains, *Flavobacterium*, *Legionella* spp., *Haemophilus ducreyi*, *Helicobacter pylori* and *Campylobacter jejuni*.

#### Other organisms:

*Treponema pallidum*, *Borrelia burgdorferi*, *Mycobacterium scrofulaceum* and *M. kansasii*.

## INDICATIONS

Treatment of infections caused by roxithromycin sensitive organism, Particularly in ear, nose, throat, bronchopulmonary, genital (excluding gonococcal infections) and skin manifestations. Prophylaxis is of meningococcal meningitis in subjects who have come into contact with the patient

## DOSAGE AND ADMINISTRATION

Roxithromycin is given orally to adults in a usual dose of 150 mg twice daily or sometimes 300 mg once daily, at least 15 minutes before meals, for 5 to 10 days in the treatment of susceptible infections.

Dosage may need to be modified in patients with hepatic or renal impairment.

In children weighing from 6 up to 40 kg a dose of 5 to 8 mg/kg daily of roxithromycin may be used.

## CONTRAINDICATIONS

Roxithromycin is contraindicated in patients who known to be hypersensitive to any of macrolide antibiotics and other ingredients of this product.

## PRECAUTIONS

### Pseudomembranous colitis:

This has occurred with nearly all antibacterial agents and may range in severity from mild to life-threatening. Therefore, it is important to consider this diagnosis in patients who present with diarrhea subsequent to the administration of antibacterial agents. Mild cases of Pseudomembranous colitis usually respond to discontinuation of the drug alone.

In moderate-to-severe cases, give consideration to management with fluids and electrolytes, protein supplementation and treatment with an antibacterial drug effective against *C. difficile* colitis.

### Cardiac effects:

Ventricular arrhythmias, including ventricular tachycardia and torsades de pointes, in individuals with prolonged QT intervals have been reported with macrolide antibiotics.

### Hepatotoxicity:

Roxithromycin administration has been associated with the infrequent of cholestatic hepatitis. Symptoms may include malaise, nausea, vomiting, abdominal cramps, and fever.

### Myasthenia gravis:

Roxithromycin may aggravate the weakness of patients with myasthenia gravis.

### Hypersensitivity reactions:

Serious allergic reactions, including anaphylaxis, have occurred with Roxithromycin.

### Hepatic function impairment:

Roxithromycin is excreted by the liver. Exercise caution in administering to patients with impaired hepatic function.

## DRUG INTERACTIONS

Roxithromycin has the potential to interact with a large number of drugs through its action on hepatic cytochrome P450 isoenzymes, particularly CYP1A2 and CYP3A4.

The interactions can result in severe adverse effects, including ventricular arrhythmias with aztemizole, cisapride and terfenadine.

Other mechanisms by which Roxithromycin cause interactions include suppression of the gastrointestinal flora responsible for the intraluminal metabolism of digoxin and the stimulant effect of roxithromycin on gastrointestinal motility which is believed to be responsible for the interaction between spiramycin and levodopa. An alternative mechanism by which roxithromycin increases serum concentrations of digoxin is thought to be via the inhibition of intestinal or renal P-glycoprotein transport of digoxin.

Roxithromycin does not appear to interact with antacids, carbamazepine, oral contraceptives, prednisolone or ranitidine.

## PREGNANCY

Data not applicable.

## LACTATION

Small amounts of Roxithromycin are distributed into breast milk.

## ADVERSE REACTIONS

Gastrointestinal disturbances, acute interstitial nephritis, acute eosinophilic pneumonia, acute pancreatitis, duodenal inflammation, duodenal pain, pancreatic enlargement, raised serum amylase and eosinophilia.

## OVERDOSAGE

The toxic symptoms following an overdose of a macrolide antibiotic may include nausea, vomiting, epigastric distress and diarrhea.

Treatment includes usual supportive measures. Induce prompt elimination of unabsorbed drug. Control allergic reactions with conventional therapy as indicated. Hemodialysis and peritoneal dialysis are not particularly effective.

## STORAGE CONDITION

Store at temperature not exceeding 30°C

## PACK SIZE

Pack of 10 tablets, 10 packs



Manufactured by  
**BIOLAB CO., LTD.**  
SAMUTPRAKARN, THAILAND



Distributed by  
**BIOPHARM CHEMICALS CO., LTD.**  
55 Biohouse Bldg., Sukhumvit 39,  
BANGKOK, THAILAND Tel:0-2258-9999

Date of revision : August 2013