

Beil. z. Lesartenhauspharmazie

ZB MED

# Chemotherapie Journal

Band 10, Beilage Nr. 17  
April 2001  
ISSN 0940-6486

## Forschungswerkstatt Moxifloxacin

Im Rahmen der Entwicklung von Moxifloxacin (Avalox®) wurden zahlreiche mikrobiologische Forschungsprojekte zur näheren Charakterisierung der Substanz initiiert und durchgeführt. Auf einer „Forschungswerkstatt“, zu der die Firma Bayer alle beteiligten Mikrobiologen aus Deutschland eingeladen hatte, wurden diese Forschungsprojekte vorgestellt und diskutiert. Aufgrund der Fülle der Beiträge mit einem breiten Spektrum an Themen, die von vergleichender In-vitro-Aktivität gegenüber klinischen Isolaten über pharmakodynamische Aspekte bis zu immunologischen und tierexperimentellen Untersuchungen reichten, können diese hier nur auszugsweise wiedergegeben werden.

Moxifloxacin, das neue 8-Methoxychinolon, ist derzeit das einzige in Deutschland auf dem Markt befindliche Fluorchinolon der Gruppe 4 (nach der Einteilung der Paul-Ehrlich-Gesellschaft für Chemotherapie e. V.). Es ist im Vergleich zu den klassischen Substanzen nicht nur durch eine wesentlich verbesserte Aktivität gegen grampositive Keime gekennzeichnet, sondern es ist auch gegen Anaerobier aktiv.

Nach oraler Gabe wird Moxifloxacin rasch resorbiert und erreicht bereits 2 Stunden nach einer 400-mg-Dosis einen Plasmaspitzen Spiegel ( $C_{max}$ ) von 2,5 bis 4,5 mg/l. Dank einer Halbwertszeit von 12 bis 15 Stunden und einer oralen Bioverfügbarkeit von 90 % ist eine einmal tägliche Verabreichung ausreichend. Moxifloxacin weist eine sehr gute Gewebepenetration auf und reichert sich insbesondere in der Lunge an. Hier wer-

den Gewebekonzentrationen, die bis zum 90fachen des Serumspiegels betragen können, erreicht. Die mittlere Moxifloxacin-Konzentration 3 Stunden nach Applikation von 400 mg oral betrug 5,5 mg/l in der Bronchialmukosa, 24,4 mg/l im epithelialen Flüssigkeitsfilm und 61,8 mg/kg in den Alveolarmakrophagen, gegenüber 3,3 mg/l im Serum (Abb. 1). Moxifloxacin wurde primär als Atemwegsantibiotikum entwickelt und ist sowohl in Europa als auch in den USA bislang in oraler Darreichungsform zur Behandlung von Atemwegsinfektionen wie akuter Exazerbation der chronischen Bronchitis (AECB), ambulant erworbener Pneumonie und akuter bakterieller Sinusitis zugelassen. Die klinischen Prüfungen mit der parenteralen Darreichungsform sind abgeschlossen. Mit der Zulassung wird im Laufe des Jahres 2001 gerechnet.

### Schnelle konzentrationsabhängige Bakterizidie

Pharmakodynamisch zeichnet sich Moxifloxacin durch eine starke und zudem konzentrationsabhängige Bakterizidie aus, je höher die Konzentration desto rascher werden die Keime abgetötet (Abb. 2, 3). Darin unterscheidet es sich von Beta-Lactam-Antibiotika und älteren Chinolonen, bei denen eine Steigerung der Konzentration über einen bestimmten Wert hinaus nicht mit einer höheren Bakterizidie verbunden ist. Auch gegenüber Ma-

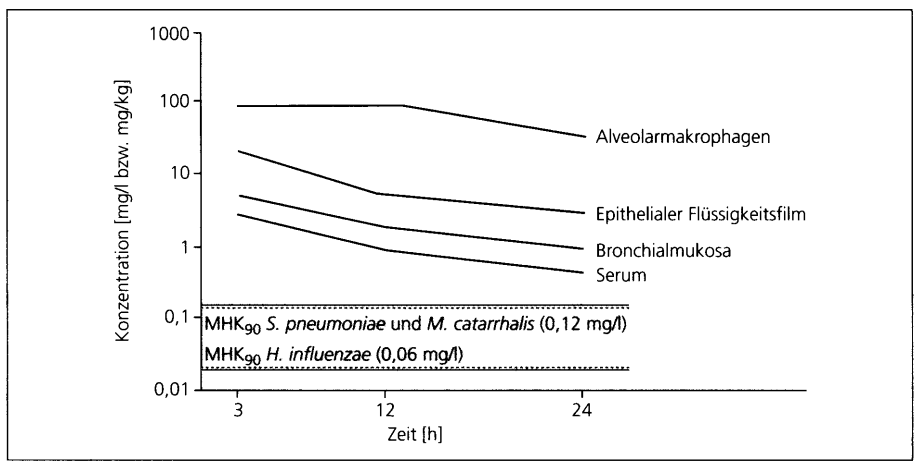


Abb. 1. Gewebekonzentrationen von Moxifloxacin [nach Andrews, 1998]

75-A  
2067  
-77,4 (Beil. 10, 17)  
ZB MED