

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ГАТИФЛОКСАЦИН**  
**(GATIFLOXACIN)**

**Склад:**

діюча речовина: gatifloxacin;

1 флакон 200 мл розчину містить гатифлоксацину 400 мг;

допоміжні речовини: глюкоза безводна, вода для ін'єкцій.

**Лікарська форма.** Розчин для інфузій.

**Фармакотерапевтична група.** Антибактеріальні засоби групи хінолонів. Фторхінолони.

Код АТС J01M A16.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

Інфекції, спричинені чутливими до препарату мікроорганізмами:

- інфекції дихальних шляхів: гострий бактеріальний бронхіт або загострення хронічного бронхіту, негоспітальна пневмонія;
- інфекції ЛОР-органів (включаючи гострий синусит);
- інфекції нирок і сечовидільної системи: цистит, пієлонефрит (із ускладненнями та без ускладнень);
- захворювання, що передаються статевим шляхом: уретральна та вагінальна гонорея без ускладнень, ректальна гонорея без ускладнень у жінок.

**Протипоказання.**

Підвищена чутливість в анамнезі до гатифлоксацину чи інших препаратів хінолонового ряду. Дитячий вік до 18 років. Період вагітності та годування груддю.

**Спосіб застосування та дози.**

Перед застосуванням слід провести шкірний тест на переносимість. Препарат призначають кожні 24 години внутрішньовенно краплинно. Дозування та тривалість лікування залежать від виду та ступеня тяжкості інфекції:

Захворювання	Доза, мг	Тривалість лікування
Гострий бактеріальний бронхіт або загострення хронічного бронхіту	400	5 днів
Гострий синусит	400	10 днів
Негоспітальна пневмонія	400	7 - 14 днів
Інфекції сечовивідних шляхів без ускладнень (цистит)	200 або 400	одноразово або 3 дні
Інфекції сечовивідних шляхів з ускладненнями	400	7-10 днів
Гострий пієлонефрит	400	7-10 днів
Уретральна гонорея (без ускладнень) у чоловіків	400	одноразово
Ендоцервікальна та ректальна гонорея у жінок	400	одноразово

Люди літнього віку та пацієнти з помірною печінковою недостатністю коригування доз не

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

потребують. Рекомендується коригування доз для пацієнтів із нирковою недостатністю з нирковим кліренсом креатиніну менше 40 мл/хв, включаючи пацієнтів, які потребують діалізу та пацієнтів, які перебувають на постійному амбулаторному перитонеальному діалізі. Рекомендована доза - 400 мг один раз на добу на початку лікування, далі - по 200 мг на добу. Пацієнтам, які перебувають на гемодіалізі, рекомендується вводити гатифлоксацин після проведення діалізу.

### **Побічні реакції.**

Відмічалися такі клінічно значущі побічні реакції, пов'язані з прийманням гатифлоксацину.

*Алергічні й шкірні реакції:* набряк обличчя, набряк язика, генералізований чи периферичний набряк, везикулобульозні висипання, макулопапульозні висипання, набряк слизової оболонки ротової порожнини.

*З боку травного тракту:* нудота, діарея, біль у животі, анорексія, запор, диспепсія, метеоризм, гастрит, глосит, виразки в ротовій порожнині, стоматит, гінгівіт, блювання, шлунково-кишкова кровотеча.

*З боку нервової системи і органів чуття:* головний біль, запаморочення, ажитація, тривожність, сплутаність свідомості, нервозність, збудження, парестезія, порушення сну. безсоння, сонливість чи нічні жахи, тремор, судоми, деперсоналізація, депресія, напад паніки, параноя, фотофобія, ворожість, гіперестезія, мігрень, атаксія, порушення зору, порушення смакових відчуттів, фоточутливість очей, ототоксичність, судоми м'язів нижніх кінцівок.

*З боку серцево-судинної системи:* тахікардія, брадикардія, артеріальна гіпертензія, ціаноз, подовження інтервалу QT на ЕКГ.

*З боку респіраторної системи:* фарингіт, задишка.

*З боку сечовидільної системи:* дизурія, гематурія, кристалурія, транзиторний нефрит.

*З боку опорно-рухової системи:* артропатії, артралгії, міалгії, судоми, тендиніти, тендовагініти, підвищений ризик розриву сухожиль.

*З боку гепатобіліарної системи:* підвищення рівня печінкових ферментів, холестатична жовтяниця, гепатит.

*Інші:* вагініт, біль у кістках, у грудях, у спині, артрит, гіпоглікемія, гіпервентиляція, спрага, підвищення температури, сухість шкіри, метрорагія, бронхоспазм, біль у вухах, озноб, гарячка, гематурія.

### **Передозування.**

Клінічні симптоми передозування включають зменшення активності, сплутаність свідомості, запаморочення, психози, зменшення частоти дихання, блювання, тремор та судоми.

У разі виникнення симптомів передозування слід уважно вести спостереження за пацієнтами (включаючи ЕКГ), потрібно негайно провести симптоматичне та підтримуюче лікування. Необхідно проводити достатню гідратацію. Гемодіаліз у разі передозування препаратом неефективний: вилучається з крові приблизно 14 % введеної дози протягом 4 годин, при постійному амбулаторному перитонеальному діалізі - 11 % за 8 діб.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Протипоказаний.

### **Діти.**

Клінічні дослідження щодо безпеки та ефективності гатифлоксацину в пацієнтів віком до 18 років не проводились.

### **Особливі заходи безпеки.**

Відмічалися випадки серйозної, іноді фатальної гіперчутливості та/або анафілактичних реакцій при прийомі хінолонів. Тому при появі перших проявів гіперчутливості (наприклад, висипання на шкірі) прийом препарату слід негайно припинити.

### **Особливості застосування.**

Може спостерігатися псевдомембранозний коліт (що є звичайним після прийому майже всіх антибактеріальних засобів) і проявляється як в помірній, так і загрозливій для життя формі. Цю особливість потрібно враховувати при призначенні гатифлоксацину пацієнтам, які страждають від

діареї після прийому лікарських препаратів.

У деяких пацієнтів гатифлоксацин може потенціювати подовження інтервалу QT на ЕКГ. Внаслідок недостатності клінічних даних слід уникати застосування гатифлоксацину в пацієнтів із подовженим інтервалом QT, у пацієнтів із гіпокаліємією, що не піддається корекції, у пацієнтів, які лікуються антиаритмічними препаратами класу IA (прокаїнамід, хінідин) та класу III (сотолол, аміодарон).

З обережністю слід застосовувати препарат при захворюваннях серця, таких як брадикардія та гостра ішемія міокарда.

Імовірність подовження інтервалу QT може зростати зі збільшенням концентрації гатифлоксацину, тому рекомендована доза не повинна бути перевищена. Подовження тривалості інтервалу QT може призвести до збільшення ризику виникнення шлуночкових аритмій.

Лікарські засоби, такі як цизаприд, еритроміцин, антипсихотичні лікарські засоби та трициклічні антидепресанти також подовжують інтервал QT. Не можна виключати адитивного ефекту цих ліків із гатифлоксацином, тому разом з ними гатифлоксацин слід застосовувати з обережністю.

У випадках підвищеної чутливості до препарату та при розвитку анафілактичного шоку спостерігались серйозні та летальні випадки у пацієнтів, які пройшли лікування хіноліном. Гатифлоксацин не слід застосовувати при появі перших ознак підвищеної чутливості – висипаннях на шкірі чи при інших алергічних реакціях.

*Тяжка печінкова недостатність.* Інформації щодо зміни фармакокінетики гатифлоксацину у пацієнтів з тяжкою печінковою недостатністю немає.

*Люди літнього віку* не потребують корекції дозування, але препарат їм застосовують з обережністю.

*Пацієнтам з нирковою недостатністю* препарат призначають з обережністю. Рекомендується коригування дози для пацієнтів з нирковим кліренсом креатиніну менше 40 мл/хв, включаючи пацієнтів, які потребують діалізу та пацієнтів, які перебувають на постійному амбулаторному перитонеальному діалізі.

*Пацієнти, хворі на діабет II типу (інсуліннезалежний):* фармакокінетика у хворих з діабетом II типу відповідає фармакокінетиці гатифлоксацину у здорових добровольців. Не відмічалось змін функції бета-клітин підшлункової залози та змін рівня цукру в крові, виміряного натщесерце. При застосуванні хінолонів у хворих на діабет при паралельному пероральному прийманні гіпоглікемічних засобів (наприклад, глібуриду) часто виникає порушення рівня глюкози в крові, включаючи симптоматичну гіпер- та гіпоглікемію, тому в таких випадках обов'язково потрібний постійний лабораторний контроль. Якщо рівень цукру знизився або підвищився, застосування препарату слід припинити і звернутися за консультацією до лікаря.

Слід уникати опромінення ультрафіолетовими променями у зв'язку з високим ризиком виникнення фотосенсибілізації.

### ***Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.***

Може порушуватися швидкість психомоторних реакцій, тому під час лікування слід утримуватись від керування транспортними засобами і роботи з точними механізмами.

### ***Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.***

Застосування гатифлоксацину не впливає на системний кліренс внутрішньовенно введеного мідазоламу. Одноразове внутрішньовенне введення мідазоламу в дозі 0,0145 мг/кг не впливає на фармакокінетику гатифлоксацину. Ці результати не суперечать тому, що при дослідженнях *in vitro* з людським ізоферментом CYP3A4 гатифлоксацин не виявляв ніякого впливу.

Одночасне застосування гатифлоксацину та теофіліну не впливало на фармакокінетику жодного з цих препаратів.

При одночасному застосуванні гатифлоксацину та глібуриду пацієнтами з II типом цукрового діабету часто виникає порушення рівня глюкози в крові, включаючи симптоматичну гіпер- та гіпоглікемію.

Одночасне застосування гатифлоксацину та дигоксину не виявило значного ефекту щодо зміни фармакокінетики гатифлоксацину, однак у деяких пацієнтів спостерігалось підвищення концентрації дигоксину. Пацієнтів, які приймають дигоксин, слід перевіряти на ознаки та/чи симптоми розвитку інтоксикації. У пацієнтів, які мають ознаки та/чи симптоми інтоксикації дигоксином, потрібно перевіряти концентрацію дигоксину в сироватці та дози дигоксину відкоригувати.

Системне виведення гатифлоксацину значно підвищується при одночасному застосуванні гатифлоксацину

та

пробенециду.

У пацієнтів, які застосовували варфарин, не було виявлено значних змін у часі згортання крові при одночасному застосуванні гатифлоксацину. Однак завдяки тому, що деякі хінолони збільшують ефект варфарину чи його похідних, протромбіновий час чи інший відповідний тест на згортання повинен суворо контролюватися, якщо протибактеріальний хінолон призначений разом із варфарином чи похідними цього препарату. Під час доклінічних та клінічних досліджень виявлено, що при одночасному застосуванні нестероїдних протизапальних препаратів із хінолонами останні можуть підвищити ризик виникнення розладів ЦНС та судом.

Трициклічні антидепресанти, похідні фенотіазину, еритроміцин, цизаприд підвищують ризик виникнення порушень ритму серця.

### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.* Гатифлоксацин *in vitro* активний щодо широкого спектра грамнегативних та грампозитивних бактерій. Антибактеріальна дія гатифлоксацину полягає в інгібуванні бактеріальних ферментів: ДНК-гірази та топоізомерази IV. ДНК-гіраза - важливий фермент, що бере участь у реплікації, транскрипції та репарації бактеріальної ДНК. Гатифлоксацин активний *in vitro* та в клінічних умовах щодо таких штамів мікроорганізмів: *аеробні грампозитивні бактерії*: *Staphylococcus aureus* (лише метицилінчутливі штами), *Streptococcus pneumoniae* (лише чутливі до пеніциліну штами), *Streptococcus pyogenes*;

*аеробні грамнегативні бактерії*: *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Proteus mirabilis*;

*інші мікроорганізми*: *Chlamydia pneumoniae*, *Legionella pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae*. Гатифлоксацин діє у мінімальній інгібуючій концентрації *in vitro* <2µg/mL (<1 µg/mL для *Streptococcus pneumoniae*) щодо більшості (>90 %) штамів таких мікроорганізмів:

*аеробні грампозитивні бактерії*: *Staphylococcus saprophyticus*, *Streptococcus pneumoniae* (стійкі до пеніциліну штами), *Streptococcus pyogenes*;

*аеробні грамнегативні бактерії*: *Acinetobacter Iwoffii*, *Citrobacter koseri*, *Citrobacter freundii*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Klebsiella Oxytoca*, *Morganella morgani*, *Proteus vulgaris*;

*анаеробні мікроорганізми*: *Peptostreptococcus spp.*

*Фармакокінетика.* Пероральний та внутрішньовенний способи застосування взаємозамінні, оскільки фармакокінетичні параметри після внутрішньовенного введення протягом години подібні до фармакокінетичних параметрів після перорального прийому препарату.

Зв'язування з білками плазми крові становить приблизно 20 % та не залежить від концентрації препарату в крові. Внаслідок низького відсотка зв'язування препарату з білками плазми, його концентрація в слині приблизно така ж, як і в плазмі. У рівноважному стані середній об'єм розподілу гатифлоксацину становить від 1,5 до 2 л/кг.

Препарат підлягає обмеженій біотрансформації в організмі людини, із сечею виводиться менше ніж 1 % введеної дози у вигляді метаболітів етилендіаміну та метилетилендіаміну. У досліджах *in vitro* з ізоензимами цитохрому P<sub>450</sub> гатифлоксацин не інгібував CYP3A, CYP2D6, CYP2C19 або CYP1A2. Отже, він не впливає на фармакокінетику препаратів, які метаболізуються цими ферментами.

Гатифлоксацин екскретується переважно нирками у незміненому вигляді. Більше 70 % введеної дози препарату виводиться в незміненому вигляді із сечею протягом 48 годин після внутрішньовенного застосування та 5 % - із каловими масами.

Середній період напіввиведення гатифлоксацину становить від 7 до 14 годин і не залежить від дози і режиму застосування.

Немає інформації щодо зміни фармакокінетики гатифлоксацину в пацієнтів із тяжкою печінковою недостатністю.

Фармакокінетика в пацієнтів віком до 18 років не вивчалася.

Фармакокінетика у хворих з діабетом II типу (інсуліннезалежний) не відрізняється від фармакокінетики гатифлоксацину у здорових людей. Не відмічалось змін функції бета-клітин підшлункової залози та змін рівня цукру в крові, виміряного натщесерце.

### **Фармацевтичні характеристики:**

*Основні фізико-хімічні властивості:* прозорий розчин без видимих механічних домішок, від світло-жовтого до жовто-зеленого кольору.

***Несумісність.***

Немає інформації щодо сумісності гатифлоксацину з іншими внутрішньовенними розчинами, тому необхідно обмежити застосування додаткових препаратів, а також введення їх через один катетер. При введенні через один катетер інших препаратів послідовно, його необхідно промити до та після введення гатифлоксацину за допомогою розчину, який є сумісним з гатифлоксацином та іншими препаратами.

***Термін придатності.***

2 роки з дати виготовлення “in bulk”.

***Умови зберігання.***

Зберігати при температурі не вище 30 °С в захищеному від світла та недоступному для дітей місці. Не заморожувати.

***Упаковка.***

По 200 мл у пластиковому флаконі, по 1 флакону у картонній пачці.

***Категорія відпуску.***

За рецептом.

***Виробник.***

ТОВ «ЛЮМ'ЄР ФАРМА».

***Місцезнаходження.***

Україна, 03069, м. Київ, вул. Кіровоградська, 100-Б.