

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОФЛОКСАЦИН
(OFLOXACIN)

Склад:

діюча речовина: офлоксацин;

1 мл розчину для інфузій містить 2 мг офлоксацину;

допоміжні речовини: натрію хлорид, динатрію едетат, натрію гідроксид, кислота хлористоводнева, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для інфузій.

Фармакотерапевтична група. Антибактеріальні засоби для системного застосування. Фторхінолони. Код АТС J01M A01.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Інфекційно-запальні захворювання, спричинені чутливими до офлоксацину збудниками:

- гострі та хронічні інфекції бронхолегеневої системи;
- гострі та хронічні інфекції верхніх та нижніх відділів сечовивідних шляхів;
- інфекції шкіри та м'яких тканин.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до офлоксацину та до інших компонентів препарату або до інших препаратів групи фторхінолонів;
- епілепсія;
- ураження центральної нервової системи зі зниженим судомним порогом (після черепно-мозкових травм, інсульту, запальних процесів мозку та мозкових оболонок);
- тендиніти в анамнезі;
- дефіцит глюкозо-6-фосфатдегідрогенази;
- вагітність;
- годування груддю;
- дитячий вік (до 18 років).

Офлоксацин не можна призначати пацієнтам з подовженням інтервалу QT, пацієнтам з некомпенсованою гіпокаліємією, а також пацієнтам, які приймають протиаритмічні засоби класу IA (хінідин, прокаїнамід) або класу III (аміодарон, соталол).

Спосіб застосування та дози.

Застосовують дорослим пацієнтам внутрішньовенно краплинно. Перед початком введення слід зробити шкірну алергічну пробу.

Доза Офлоксацину встановлюють індивідуально, залежно від чутливості мікроорганізмів, виду та тяжкості інфекційного процесу.

Інфекції бронхолегеневої системи: по 200 мг двічі на добу.

Інфекції сечовивідних шляхів: по 200 мг 1 раз на добу.

При тяжких або ускладнених інфекціях можна вводити в дозі 400 мг двічі на добу.

Інфекції шкіри та м'яких тканин: по 400 мг двічі на добу.

Введення необхідно здійснювати з рівними інтервалами. Дозу 200 мг слід вводити не менше ніж протягом 30 хвилин.

Дозування для пацієнтів із порушенням функції нирок.

Якщо кліренс креатиніну становить 50-20 мл/хв, дозу необхідно зменшити до 100-200 мг кожні 24

години.

При кліренсі креатиніну < 20 мл/хв, у т.ч. для хворих, які перебувають на гемодіалізі або перитонеальному діалізі, доза має становити 100 мг кожні 24 години.

Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання та у більшості випадків становить 7-10 днів. Після нормалізації температури тіла та покращення загального стану пацієнта введення препарату слід продовжувати ще протягом 3 днів.

При покращенні стану пацієнта рекомендовано продовжити лікування пероральною формою препарату. _

Сумісний з наступними інфузійними розчинами: 0,9 % розчином натрію хлориду, розчином Рінгера 5 %, 5 % розчином фруктози, 5 % розчином декстрази.

Побічні реакції.

З боку шлунково-кишкового тракту: гастралгія, зниження апетиту, нудота, блювання, дисбіоз, діарея, метеоризм, біль у животі, підвищення активності печінкових трансаміназ, гіпербілірубінемія, гіпоглікемія (у хворих на цукровий діабет), холестатична жовтяниця, псевдомембранозний ентероколіт, гепатит (до тяжкого перебігу).

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, невпевненість рухів, тремор, судоми, заміління і парестезії кінцівок, інтенсивні сновидіння, «страшні» сновидіння, психотичні реакції, відчуття тривоги, стан збудження, фобії, депресія, сплутаність свідомості, галюцинації, підвищення внутрішньочерепного тиску, сонливість, порушення периферичної чутливості (парестезії, атаксія), сенсорна або сенсомоторна нейропатія, екстрапірамідні симптоми, суїцидальні думки та дії.

З боку опорно-рухового апарату: тендиніт, міалгії, артралгії, тендосиновіт, розрив сухожилля, рабдоміоліз.

З боку органів чуття: розлади зору, смакових відчуттів і нюху (у виняткових випадках – втрата функції), розлади слуху (у виняткових випадках – втрата слуху), порушення сприйняття кольорів, диплопія, порушення смаку, нюху, слуху, рівноваги.

З боку серцево-судинної системи: зниження артеріального тиску, колапс, васкуліти, тахікардія.

Алергічні реакції: шкірні висипи, свербіж, кропив'янка, алергічний пневмоніт, алергічний нефрит, еозинофілія, пропасниця, ангіоневротичний набряк, набряк обличчя, набряк Квінке, набряк язика і/або гортані з можливою асфіксією, бронхоспазм; мультиформна ексудативна еритема (у тому числі синдром Стівенса-Джонсона) і токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайелла), фотосенсибілізація, васкуліт, анафілактичний шок.

З боку шкіри та її похідних: точкові крововиливи (петехії), бульозний геморагічний дерматит, папульозний висип із кіркою, який свідчить про ураження судин (васкуліт).

З боку системи крові та лімфатичної системи: лейкопенія, еозинофілія, агранулоцитоз, анемія, тромбоцитопенія, панцитопенія, гемолітична та апластична анемія, пригнічення кровотворення кісткового мозку, гіперглікемія.

З боку сечовивідної системи: гострий інтерстиціальний нефрит, порушення функції нирок, гостра ниркова недостатність, гіперкреатинінемія, підвищення концентрації сечовини.

Інші: дисбактеріоз кишечника, суперінфекція, гіпоглікемія (у хворих на цукровий діабет), вагініт, слабкість, пропасниця.

Місцеві реакції: біль, гіперемія у місці введення, тромбофлебіт.

Передозування.

Симптоми передозування характеризуються проявами нудоти, блювання, запамороченням, сплутаністю свідомості, загальмованістю, тахікардією, головним болем, руховим збудженням. У випадку гострого передозування необхідно відмінити введення препарату, забезпечити адекватну гідратацію, контроль ЕКГ, призначити симптоматичну терапію. Елімінацію офлоксацину можна пришвидшити шляхом форсованого об'ємного діурезу. Тільки в обмеженій кількості офлоксацин можливо видалити з організму гемодіалізом (15-25 %) або перитонеальним діалізом (менше 2 %).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Протипоказання.

Діти. Протипоказання.

Особливі заходи безпеки.

У разі розвитку алергічних реакцій або виражених побічних ефектів з боку ЦНС, котрі можуть проявитися вже після першого прийому, препарат необхідно негайно відмінити.

Особливості застосування.

Не є препаратом вибору при пневмонії, викликаній пневмококами. Не рекомендується застосовувати препарат більше 2 місяців. Пацієнтові не слід піддаватися впливу сонячних променів, УФ-опроміненню (ртутно-кварцові лампи, солярій). У випадку появи побічних ефектів з боку нервової системи, алергічних реакцій, псевдомембранозного коліту необхідна відміна препарату. При псевдомембранозному коліті, підтверженому колоноскопічно і/або гістологічно, показане пероральне застосування ванкоміцину та метронідазолу.

Рідкісна поява тендиніту може призвести до розриву сухожилля (насамперед ахіллового), особливо у пацієнтів літнього віку. У разі появи ознак тендиніту необхідно негайно припинити лікування, провести іммобілізацію ахіллового сухожилля і проконсультуватися з ортопедом.

У період лікування не можна вживати алкоголь.

При застосуванні препарату жінкам не рекомендується використовувати гігієнічні тампони у зв'язку з підвищеним ризиком виникнення молочниці.

На фоні лікування можливе погіршення перебігу міастенії, збільшення частоти приступів порфірії у схильних до цих захворювань пацієнтів.

Може призводити до псевдонегативних результатів при бактеріологічній діагностиці туберкульозу (запобігає виділенню *Mycobacterium tuberculosis*).

У хворих із порушенням функції печінки та нирок необхідний контроль концентрації офлоксацину у плазмі крові. При тяжкій печінковій та нирковій недостатності підвищується ризик розвитку токсичних ефектів (потрібна корекція дози у бік зниження).

Обережно призначають препарат хворим із вираженим атеросклерозом судин головного мозку та з порушеннями мозкового кровообігу.

Офлоксацин включають у схему комплексного лікування мультирезистентного туберкульозу.

Пацієнти мають вживати достатню кількість рідини, щоб уникнути кристалурії.

Деякі хінолони, включаючи офлоксацин, можуть подовжувати QT-інтервал на електрокардіограмі і спричиняти поодинокі випадки аритмії. Призначення офлоксацину слід уникати пацієнтам з відомим подовженням QT-інтервалу.

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

Застосування Офлоксацину негативно впливає на виконання роботи, що потребує швидкості психомоторних реакцій (участь у дорожньому русі, керування машинами та механізмами), спостерігається уповільнення ефектів, особливо стосовно нервової системи.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Знижує кліренс теофіліну на 25 % (при одночасному застосуванні слід зменшити дозу теофіліну).

Збільшує концентрацію глібенкламіду у плазмі крові.

Циметидин, фуросемід, метотрексат та препарати, які блокують каналцеву секрецію, збільшують концентрацію офлоксацину у плазмі крові.

При одночасному застосуванні з антагоністами вітаміну К необхідно здійснювати контроль згортання системи крові.

При застосуванні з нестероїдними протизапальними препаратами, похідними нітроїмідазолу і метилксантинів, збільшується ризик розвитку нейротоксичних ефектів.

При одночасному призначенні з глюкокортикостероїдами підвищується ризик розриву сухожиль, особливо у пацієнтів літнього віку.

Харчові продукти, антациди, які містять Al^{3+} , Ca^{2+} , Mg^{2+} або солі Fe, знижують всмоктування офлоксацину, утворюючи нерозчинні комплекси (інтервал часу між призначенням цих препаратів має бути не менше 2 годин).

При одночасному застосуванні офлоксацину з нестероїдними протиревматичними засобами або лікарськими засобами, що знижують поріг судом, ризик розвитку судом може зрости.

Одночасне введення офлоксацину з прокаїнамідом може призвести до підвищення рівня прокаїнаміду – у хворих треба проводити ретельний моніторинг рівня прокаїнаміду у плазмі крові, ЕКГ та у разі потреби підібрати дозування препарату.

При одночасному застосуванні офлоксацину з антигіпертензивними засобами або анестетичними барбітуратами можна в окремих випадках спостерігати раптове зниження тиску.

Одночасне введення офлоксацину у великих дозах з лікарськими засобами, які виділяються шляхом тубулярної секреції, може призвести до підвищення плазматичних концентрацій через їх знижене виведення.

При одночасному введенні з варфарином або його похідними необхідно слідкувати за протромбіновим часом або проводити інші відповідні дослідження на згортання.

З огляду на можливу гіперглікемію або гіпоглікемію при введенні офлоксацину у хворих, яких лікували протидіабетичними засобами, необхідно обов'язково проводити моніторинг параметрів їх компенсації. Протягом лікування офлоксацином можуть спостерігатися псевдопозитивні результати при визначенні опіатів або порфіринів у сечі.

Не застосовувати пацієнтам, які приймають препарати, що подовжують QT-інтервал.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Офлоксацин – синтетичний протимікробний засіб фторованого хінолону широкого спектра дії.

У концентраціях, ідентичних мінімальній пригнічувальній концентрації (MIC) або у трохи вищих, він справляє бактерицидну дію (шляхом пригнічення ДНК-гірази = ферменту, необхідного для дублювання та транскрипції бактеріальної ДНК).

Протимікробний спектр охоплює: грамнегативні і грампозитивні бактерії, чутливі до офлоксацину: *Enterobacteriaceae* (*Escherichia coli*, види *Citrobacter*, *Enterobacter*, *Klebsie Proteus*, *Providencia*, *Salmonella*, *Serratia*, *Shigella*, *Yersinia*), *Pseudomonas spp*, у тому числі *Pseudomonas aeruginosa*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus ducreyi*, *Branhamella catarrha*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Acinetobacter spp*, *Campylobacter spp*, *Gardnerel vaginalis*, *Helicobacter pylori*, *Pasteurella multocida*, *Vibrio spp*, *Brucella melitensis*; стафілококи, у тому числі і штами, що виробляють пеніциліназу та деякі штами, резистентні до метициліну; також він має активність відносно *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Ureaplasma urealyticum* (при граничних значеннях MIC), *Mycobacterium tuberculosis*, *Mycobacterium leprae* та деяких інших мікобактерій. Чутливість стрептококів групи А, В і С є граничною.

Більшість анаеробів, за винятком *Clostridium perfringens*, є резистентними. Офлоксацин неактивний відносно *Treponema pallidum*.

Фармакокінетика. Офлоксацин проникає у тканини. Він також добре розповсюджується у рідинах тіла, в тому числі у цереброспінальній рідині. Відносно високі концентрації його у жовчі. Об'єм розподілу становить 1,5-2,5 л/кг. Зв'язок з плазматичними протеїнами становить 25 %. Офлоксацин в обмеженій мірі перетворюється у дезметил-офлоксацин і офлоксацин-N-оксид.

Дезметил-офлоксацин має слабку протимікробну активність.

Плазматичний напівперіод офлоксацину становить приблизно 5-8 годин, при нирковій недостатності він подовжується залежно від ступеня недостатності до 15-60 годин. Офлоксацин виводиться головним чином нирками, тубулярною секрецією та гломерулярною фільтрацією. 75-80 % виведеної дози виводиться у незмінному стані із сечею протягом 24-48 годин, менш ніж 5 % виводиться у формі метаболітів. 4-8 % виведеної дози виводиться з калом. Виведення офлоксацину може бути уповільнено у хворих із тяжким ушкодженням печінки (наприклад, цирозом). Незалежно від дози ниркове виділення офлоксацину становить 173 мл/хв, загальне виділення – до 214 мл/хв. Тільки незначний об'єм можна видалити шляхом гемодіалізу (15-25 %), біологічний напівперіод протягом гемодіалізу становить приблизно 8-12 годин. При перитонеальному діалізі біологічний напіврозпад становить 22 години.

Офлоксацин виявляє постантибіотичну дію.

Офлоксацин проходить крізь плаценту, потрапляючи у грудне молоко.

Фармацевтичні характеристики:

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий розчин блідо-жовтого кольору.

Несумісність. При призначенні з препаратами, які залужнюють сечу (інгібітори карбоангідрази, цитрати, натрію гідрокарбонат), збільшується ризик кристалуриї та нефротоксичних ефектів.

Не змішувати з гепарином (ризик преципітації).

Термін придатності. 2 роки з дати виготовлення “in bulk”.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С в захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 100 мл або 200 мл у флаконі, по 1 флакону у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «ЛЮМ'ЄР ФАРМА».

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