

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОФЛО®
(OFLO®)

Склад:

діюча речовина: офлоксацин;

1 таблетка містить офлоксацину 200 мг або 400 мг;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, целюлоза мікрокристалічна, натрію кроскармелоза, натрію метилпарагідроксибензоат (Е 219), магнію стеарат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, Опадри ІІ білий 33G28707 (таблетки 200 мг), Опадри ІІ жовтий 33G52517 (таблетки 400 мг).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група.

Антибактеріальні засоби для системного застосування. Група фторхінолонів. Код АТС J01M A01.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Інфекції легкого та середнього ступеня тяжкості, спричинені чутливими штамми мікроорганізмів:

- інфекції ЛОР-органів та дихальних шляхів;
- неускладнені та ускладнені інфекції нирок та сечовивідних шляхів;
- змішані інфекції уретри та статевих шляхів, спричинені *Chlamydia trachomatis* та/або *Neisseria gonorrhoeae*;
- інфекційні захворювання шкіри та м'яких тканин.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до офлоксацину та до інших похідних фторхінолонів;
- дефіцит глюкозо-6-фосфатдегідрогенази;
- епілепсія;
- ураження зі зниженим судомним порогом (після черепно-мозкової травми, інсульту, запальних захворювань головного мозку);
- тендиніти в анамнезі;
- вагітність та період годування груддю;
- дитячий вік.

Офлоксацин не можна призначати пацієнтам із подовженням інтервалу QT, пацієнтам із некомпенсованою гіпоглікемією, а також пацієнтам, які приймають протиаритмічні засоби класу ІА (хінідин, прокаїнамід) або класу ІІІ (аміодарон, соталол).

Спосіб застосування та дози.

Середньодобову дозу препарату таблетки Офло®, підбирають індивідуально, залежно від локалізації, тяжкості та перебігу інфекції.

Зазвичай призначають дозу 400 мг на добу (у 2 прийоми з інтервалом 12 годин). Дози, які не перевищують 400 мг, можна призначати 1 раз на добу, краще вранці.

Добова доза може бути збільшена до 600 мг (в окремих випадках – до 800 мг) у пацієнтів з тяжкими інфекціями або у випадках збільшеної маси тіла. В такому випадку доза має бути розподілена на два прийоми та отримана пацієнтом через рівні інтервали часу. Таблетки слід приймати цілими, не розжовувати, запивати їх водою як до, так і після приймання їжі. Зазвичай тривалість курсу лікування – 7 - 10 днів (залежно від стану організму хворого та клінічної картини). Гостра, неускладнена уретральна і цервікальна гонорея, спричинена *Neisseria gonorrhoeae*, лікується протягом 1 дня. Простатит, спричинений *E. coli* – протягом 6 тижнів.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Пацієнти з печінковою недостатністю.

Максимальна добова доза препарату Офло® не має перевищувати 400 мг.

Пацієнти з порушенням функції нирок.

Для пацієнтів із порушеною функцією нирок рекомендуються нижчезазначені дози.

Кліренс креатиніну	Доза
50-20 мл/хв	100 мг 1 раз на добу
< 20 мл/хв	100 мг 1 раз на добу через день

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: тахікардія; рідко – короткочасна артеріальна гіпотензія, колапс. У випадку розвитку тяжкої артеріальної гіпотензії терапію препаратом слід припинити.

З боку центральної нервової системи: головний біль, запаморочення, депресія, порушення сну/безсоння, неспокій, збудження, сплутаність свідомості, нічні жахи, сонливість, гастралгія, невропатія, сенсорні або сенсомоторні периферичні невропатії (див. розділ «Особливості застосування»); зрідка – судоми м'язів, тремор та інші екстрапірамідні симптоми, порушення м'язової координації (порушення відчуття рівноваги, нестійка хода), порушення периферичної чутливості (парестезії, атаксія, порушення смаку, порушення нюху, розлади зору – диплопія), порушення слуху (шум у вухах або втрата слуху), світлобоязнь; дуже рідко – конвульсії та тремтіння, ступор; у поодиноких випадках – відчуття тривоги, психотичні реакції (з галюцинаціями), суїцидальні думки і дії – ці реакції потребують термінової відміни препарату.

З боку травної системи: нудота, блювання, діарея, яка може бути симптомом геморагічного ентероколіту, метеоризм, біль та різь у животі, анорексія (відсутність апетиту); рідко – холестатична жовтяниця, гепатит або тяжке ураження печінки, підвищення рівня печінкових ферментів та білірубину у плазмі крові, псевдомембранозний коліт. У випадку виникнення псевдомембранозного коліту прийом препарату слід припинити і призначити відповідну терапію. В такому випадку не слід призначати лікарські засоби, які інгібують перистальтику.

З боку сечовидільної системи: кристалурія, рабдоміоліз, ниркова недостатність з підвищенням рівня сечовини та креатиніну у плазмі крові (рідко); у поодиноких випадках – інтерстиціальний нефрит, який може прогресувати до розвитку гострої ниркової недостатності.

З боку опорно-рухового апарату: артралгія (біль у суглобах), міалгія (м'язовий біль), тендиніт, особливо у пацієнтів літнього віку (ці реакції потребують термінової відміни препарату), розрив сухожилля (дуже рідко, якщо пацієнт отримує супутню терапію кортикостероїдами); у поодиноких випадках може виникнути напад порфірії.

Алергічні реакції: свербіж, шкірні висипання, кропив'янка, поява пухирів, бронхоспазм; дуже рідко – мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєлла; у поодиноких випадках – гіперчутливість у формі сонячної еритеми, знебарвлення шкіри або розшарування нігтів. Відразу після введення офлоксацину можуть розвинути анафілактичні або анафілактоїдні реакції (ознаки анафілаксії – тахікардія, гарячка, задишка, шок, ангіоневротичний набряк, васкуліт, еозинофілія). У випадку такої реакції введення Офло® слід припинити і розпочати альтернативну терапію.

З боку кровотворної системи: дуже рідко – лейкопенія, агранулоцитоз, еозинофілія, тромбоцитопенія, панцитопенія, пригнічення кістково-мозкового кровотворення; у поодиноких випадках – гемолітична анемія.

Порушення метаболізму: гіперглікемія або гіпоглікемія (у хворих на діабет).

Інші: слабкість, пневмоніт.

Передозування.

Симптоми: запаморочення, сплутаність свідомості, загальмованість, нудота, блювання, судоми, ерозивні ушкодження слизових оболонок.

Лікування: промивання шлунка, посилена гідратація, дезінтоксикаційна, десенсибілізуюча та симптоматична терапія, яка повинна бути спрямована на корекцію змін з боку внутрішніх органів.

Специфічний антидот невідомий. Гемодіаліз і перитонеальний діаліз не є ефективними.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Офло® протипоказаний для застосування жінкам у період вагітності та годування груддю, оскільки досвід застосування препарату у вагітних недостатній, а екскреція офлоксацину у грудне молоко значна.

Діти. Препарат не застосовують дітям.

Особливості застосування.

Перед початком лікування необхідно провести тести: посів на мікрофлору та визначення чутливості до офлоксацину. Терапію офлоксацином необхідно розпочати ще до того, як стануть відомі результати тестів; щойно результати тестів будуть отримані, адекватна терапія має бути продовжена. Під час лікування офлоксацином, як і іншими лікарськими засобами цієї групи, резистентність деяких штамів *Pseudomonas aeruginosa* може розвинутися досить швидко.

При застосуванні Офло® необхідно підтримувати адекватну гідратацію організму пацієнта, щоб запобігти утворенню концентрованої сечі. Хворим із порушенням функції печінки та нирок препарат слід призначати з великою обережністю. До початку лікування препаратом і під час лікування стан таких хворих підлягає суворому клінічному та лабораторному контролю. Для пацієнтів зі зниженою функцією нирок призначена доза офлоксацину повинна бути скорегована, враховуючи вповільнене виділення.

Пацієнтам, які лікуються офлоксацином, слід уникати дії сонячного опромінення та не користуватися солярієм через можливу фотосенсибілізацію шкіри. При виникненні реакцій фоточутливості (наприклад, подібних до сонячних опіків) терапію офлоксацином необхідно припинити.

У випадку виникнення тяжкої артеріальної гіпотензії терапію препаратом Офло® слід припинити.

При прийомі фторхінолонів у дуже рідкісних випадках повідомлялося про подовження інтервалу QT. Слід дотримуватись обережності при прийомі фторхінолонів, включаючи офлоксацин, у пацієнтів із відомими факторами ризику подовження інтервалу QT, пацієнтам літнього віку, при порушенні балансу електролітів (гіпокаліємія, гіпомagneмія), синдром вродженого та набутого подовженого інтервалу QT, захворювання серця (серцева недостатність, інфаркт міокарда, брадикардія).

При прийомі фторхінолонів, включаючи офлоксацин, повідомлялося про випадки сенсорної чи сенсомоторної периферичної нейропатії. При розвитку у пацієнта нейропатії прийом офлоксацину слід припинити.

Пацієнтам із порушенням функції центральної нервової системи (епілепсія, порушення мозкового кровообігу) Офло® слід призначати з обережністю через небезпеку виникнення судом або зниження судомного порогу.

У хворих на цукровий діабет офлоксацин може спричинити потенціювання гіпоглікемічної дії інсулінів.

При довготривалому та повторному лікуванні антибіотиками можливий розвиток опортуністичних інфекцій та ріст резистентних мікроорганізмів. При розвитку вторинної інфекції необхідно прийняти відповідні міри.

Під час лікування препаратом Офлоксацин не слід вживати алкоголь.

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

Під час лікування препаратом Офло® не рекомендується керувати автотранспортом та працювати з потенційно небезпечними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному прийомі офлоксацину з барбітуратами, включаючи анестетики та

антигіпертензивними засобами можливе раптове зниження артеріального тиску.

Не слід застосовувати офлоксацин із препаратами, які подовжують інтервал QT (*антиаритмічні засоби класу IA – хінін, прокаїнамід та класу III – аміодарон, соталол, трициклічні антидепресанти, макроліди*).

При застосуванні Офло® одночасно з *нестероїдними протизапальними засобами, похідними нітроїмідазолу та метилксантинів* підвищується ризик розвитку нейротоксичних ефектів, зокрема зниження судомного порогу, що може призвести до розвитку судом.

Одночасний прийом офлоксацину у великих дозах з лікарськими засобами, що виділяються шляхом тубулярної секреції, може призвести до підвищення плазматичних концентрацій через їх знижене виведення.

Якщо офлоксацин застосовується одночасно з *глюкокортикоїдами*, зростає ризик розриву сухожилля, особливо у літніх людей.

При застосуванні Офло® з препаратами, що олузнюють сечу (*інгібітори карбоангідрази, цитрати, натрію дикарбонат*), збільшується ризик кристалурії та нефротоксичних ефектів.

Одночасне застосування препарату з *циметидином, пробенецидом, фуросемідом і метотрексатом* призводить до збільшення концентрації офлоксацину в плазмі крові.

Оскільки одночасне застосування більшості хінолінів, включаючи офлоксацин, інгібує ферментну активність цитохрому P450, одночасний прийом Офло® з препаратами, які також метаболізуються цією системою (*циклоспорин, теофілін/метилксантини, варфарин*), пролонгує період напіввиведення зазначених лікарських засобів.

Якщо препарат приймають одночасно з антагоністами вітаміну К (*варфарин*), необхідно здійснювати постійний контроль згортувальної системи крові.

При одночасному застосуванні Офло® з пероральними *протидіабетичними засобами, інсуліном* можлива гіпоглікемія або гіперглікемія. Тому необхідно обов'язково проводити моніторинг параметру їх компенсації.

Одночасне застосування офлоксацину з *антацидами*, що вміщують *кальцій, магній або алюміній, із сукральфатом, із двовалентним або тривалентним залізом, з мультивітамінами*, що вміщують *цинк*, знижує інтенсивність всмоктування офлоксацину. Тому інтервал між прийомами цих препаратів повинен становити не менше 4 годин.

Протягом лікування офлоксацином можуть спостерігатися псевдопозитивні результати при визначенні опіатів або порфіринів у сечі. Тому необхідно використовувати більш специфічні методи.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Бактерицидна дія офлоксацину зумовлена пригніченням активності бактеріального ферменту – ДНК-гірази, яка контролює реплікацію бактеріальної ДНК. При відсутності активності ДНК-гірази відбувається неконтрольована реплікація ушкодженої ДНК і, як наслідок, - порушення синтезу білкових молекул у клітинах бактерій.

Офлоксацин впливає переважно на грамнегативні і деякі грампозитивні аеробні бактерії:

– високочутливі: *E. coli, Klebsiella spp.* (включаючи *Klebsiella pneumoniae*), *Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Serratia spp., Enterobacter spp., Providencia spp., Citrobacter spp., Salmonella spp., Shigella sonnei, Yersinia spp., Vibrio spp., Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitides, Haemophilus influenzae, Haemophilus ducreyi, Aeromonas hydrophila, Bordetella pertussis, Moraxella catarrhalis, Propionibacterium acnes, Brucella spp., Legionella spp.; Staphylococcus spp., Streptococcus aureus, Chlamydia trachomatis, Mycoplasma spp.*, атипівні мікобактерії, що швидко розмножуються, а також бактерії, які виробляють бета-лактамази;

– помірно чутливі: *Acinetobacter spp., Enterococcus spp., Streptococcus spp.* (включаючи пневмококи), *Clostridium perfringens, Corynebacterium spp., Campylobacter spp., Helicobacter pylori, Listeria monocytogenes, Pseudomonas aeruginosa, Gardnerella vaginalis, Mycobacterium tuberculosis, Ureaplasma urealyticum;*

– стійкі: *Treponema pallidum*, віруси, найпростіші, анаеробні мікроорганізми, серед яких більшість

видів бактероїдів; клостридії, актиномицети, фузобактерії, ентерококи, метицилінрезистентні стафілококи, нокардії.

Фармакокінетика.

Максимальна концентрація офлоксацину в плазмі крові залежить від дози і спостерігається вже через 1-2 години після прийому. Після одноразового прийому дози 200 мг і 400 мг максимальна концентрація становить 2,5 мкг/мл і 5 мкг/мл відповідно. Прийом їжі може уповільнювати всмоктування лікарського засобу, але не виявляє суттєвого впливу на біодоступність офлоксацину. Зв'язування офлоксацину з білками плазми крові становить приблизно 25 %. Оскільки офлоксацин має великий об'єм розподілу, майже вся кількість введеного препарату може вільно проникати в клітини, забезпечуючи високі концентрації в органах, тканинах і рідинах організму – в легенях, жовчному міхурі, шкірі, ЛОР-органах, сечовивідних шляхах, статевих органах, простаті. Офлоксацин проходить крізь гематоенцефалічний та плацентарний бар'єри, проникає у грудне молоко.

Період напіввиведення офлоксацину становить 6-7 годин. Близько 80-90 % прийнятої дози виводиться, в основному, нирками в незміненому вигляді; близько 4 % виводиться з калом.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 200 мг: круглі, двоопуклі, вкриті плівковою оболонкою, білого або майже білого кольору;

таблетки 400 мг: круглі, двоопуклі, вкриті плівковою оболонкою, жовтого кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері. По 1 блістеру в пачці з картоном.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Юнік Фармасьютикал Лабораторіз (відділення фірми Дж.Б.Кемікалз енд Фармасьютикалз Лтд.).

Місцезнаходження.

Ворлі, Мумбаї 400 030, Індія.