

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОФТАКВІКС
(OFTAQUIX)

Склад:

діюча речовина: левофлоксацин;

1 мл крапель очних містить 5 мг левофлоксацину у вигляді левофлоксацину напівгідрату;

допоміжні речовини: бензалконію хлорид; натрію хлорид; кислота хлористоводнева; натрію гідроксид; вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Краплі очні.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються в офтальмології. Левофлоксацин.
Код АТС S01A X19.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Місцеве лікування зовнішніх бактеріальних очних інфекцій у пацієнтів старше 1 року, спричинених мікроорганізмами, чутливими до левофлоксацину.

Протипоказання.

Гіперчутливість до активної речовини левофлоксацину або до будь-якого компонента препарату.

Дитячий вік до 1 року.

Вагітність та годування груддю.

Спосіб застосування та дози.

По 1-2 краплі в уражене око (очі) кожні 2 години до 8 разів на день, протягом перших 2 днів, а потім 4 рази на день з 3-го по 5-й день.

Для запобігання забрудненню кінчика піпетки та розчину кінчик піпетки не повинен контактувати з повіками або оточуючою ділянкою ока.

Тривалість лікування залежить від гостроти розладу, клінічного та бактеріологічного перебігу хвороби. Зазвичай термін лікування становить 5 днів.

При паралельному застосуванні різних місцевих очних лікарських засобів інтервал між введеннями має становити щонайменше 15 хвилин.

Побічні реакції.

Приблизно у 10 % пацієнтів можна очікувати небажані реакції. Ці реакції зазвичай є слабкими, помірними або тимчасовими і найчастіше обмежуються ділянкою ока.

Оскільки препарат містить бензалконію хлорид, активна речовина цього консерванту може викликати контактну екзему та/або подразнення.

Наведені нижче побічні реакції визначені, як точно, ймовірно або можливо пов'язані з лікуванням і про які повідомлялося під час клінічних досліджень та післяреєстраційного нагляду.

Очні розлади

Поширені (>1/100, <1/10):

печіння в очах, поява тяжів слизу, погіршення гостроти зору.

Непоширені (>1/1000, <1/100):

матування повік, хемоз, папілярна реакція кон'юнктиви, набряк повік, дискомфорт в очах, свербіж в

очах, біль в очах, кон'юнктивальна інфекція, кон'юнктивальні фолікули, сухість ока, еритема повік та фотофобія.

Відкладення на рогівці у клінічних дослідженнях не спостерігалися.

Розлади імунної системи

Рідкісні (>1/10000, <1/1000): зовнішні алергічні реакції, у тому числі висипання на шкірі.

Дуже рідкісні (< 1/10000), у тому числі окремі повідомлення : анафілаксія.

Розлади нервової системи

Непоширені(>1/1000, <1/100): головний біль.

Розлади дихальної системи, торокальні та медіастинальні порушення

Непоширені(>1/1000, <1/100): риніт.

Дуже рідкісні (< 1/10000), невідомі, <не можна оцінити на підставі наявних даних>: набряк гортані.

Передозування.

Кількість левофлоксацину у флаконі очних крапель занадто мала, щоб спричинювати токсичні ефекти після випадкового прийому внутрішньо. Якщо необхідно, пацієнта слід клінічно обстежити та вжити підтримуючих заходів.

Після місцевого передозування препарату очі необхідно промити чистою водою кімнатної температури.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Офтаквікс протипоказаний для застосування під час вагітності та у період годування груддю.

Діти.

Препарат не застосовують дітям віком до 1 року.

Особливості застосування.

Препарат не можна вводити під кон'юнктиву.

Розчин не слід вводити безпосередньо у передній відділ ока.

При появі реакцій гіперчутливості застосування препарату слід припинити.

При погіршенні стану пацієнта слід припинити застосування препарату та розпочати альтернативний метод лікування.

Як і для інших протиінфекційних засобів, тривале застосування препарату може викликати появу надмірної кількості нечутливих мікроорганізмів, у тому числі грибків. При погіршенні стану або якщо протягом певного періоду часу покращання не спостерігається, слід припинити застосування препарату або шукати альтернативне лікування. За клінічними показаннями хворого слід обстежити за допомогою збільшувальних приладів, наприклад, біомікроскопа з щільним розрізом для лампи та, при потребі, фарбуванням флуоресцеїном.

Застосування пацієнтам літнього віку.

Немає необхідності коригувати дозу для пацієнтів літнього віку.

Контактні лінзи.

Хворим на бактеріальну зовнішню очну інфекцію не слід носити контактні лінзи. Очні краплі містять консервант бензалконію хлорид, що може спричинити подразнення очей.

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

Можливе тимчасове затуманення зору після застосування препарату, необхідно зачекати, доки зір проясниться, до того як керувати автомобілем або оперувати механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Не проводилося спеціальних досліджень щодо взаємодії препарату з іншими ліками.

Оскільки максимальні концентрації левофлоксацину у плазмі крові після введення в очі щонайменше у 1000 разів менші за ті, що спостерігалися після стандартних доз при введенні внутрішньо, тому взаємодії, зазначені для системного застосування, навряд чи будуть клінічно значущі при застосуванні очних крапель Офтаквікс .

При паралельному застосуванні різних місцевих очних лікарських засобів інтервал між введеннями має становити щонайменше 15 хвилин.

Фармакологічні властивості.**Фармакодинаміка.**

Левофлоксацин є L-ізомером рацемічної лікарської речовини офлоксацину. Протибактеріальну дію має переважно L-ізомер офлоксацину.

Левофлоксацин - протибактеріальним засіб з групи флуорохінолонів, пригнічує активність топоізомераз II типу — ДНК-гіраз та топоізомераз IV бактерій. Дія левофлоксацину у грамнегативних бактерій спрямована переважно на DNA-гіразу, а у грампозитивних бактерій – на топоізомеразу IV.

Механізм виникнення резистентності

Існують два основні механізми виникнення резистентності бактерій до левофлоксацину: зниження концентрації препарату всередині бактеріальної клітини або зміни в наборі ферментів, проти яких спрямована дія препарату. Такі зміни виникають внаслідок мутацій в хромосомальних генах, які кодують ДНК-гіразу (*gyrA* and *gyrB*) та топоізомеразу IV (*parC* та *parE*; *grlA* та *grlB* у *Staphylococcus aureus*). Причинами виникнення резистентності через зниження концентрації препарату всередині бактеріальної клітини є зміни поринів зовнішньої мембрани (OmpF), що зменшує можливість проникнення флуорохінолонів всередину грам- негативних бактерій, або насоси, які сприяють відтоку речовин. Резистентність через відтік речовин описана у пневмококів (PmrA), стафілококів (NorA), анаеробних та грамнегативних бактерій. Повідомляється про резистентність до хінолонів через плазми (яка визначається геном *qnr*) у *Klebsiella pneumoniae* та *E. coli*.

Перехресна резистентність

Можливе виникнення перехресної резистентності між флуорохінолонами. Одиначна мутація не викликає клінічної резистентності, але множинні мутації зазвичай спричиняють клінічну резистентність до всіх лікарських засобів класу флуорохінолонів. Зміни поринів зовнішньої мембрани та системи відтоку речовин можуть мати широку специфічність до субстратів, бути спрямовані проти кількох класів протибактеріальних засобів і призвести до виникнення множинної резистентності.

Контрольні точки

Контрольні точки мінімальної пригнічуючої концентрації , які відділяють чутливі організми та організми з проміжною чутливістю від резистентних, мають такі значення:

Pseudomonas spp., *Staphylococcus* spp., *Streptococcus* A,B,C,G: чутливі \leq 1мг/л, резистентні $>$ 2мг/л;

Streptococcus pneumoniae: чутливі \leq 2 мг/л, резистентні $>$ 2мг/л;

Haemophilus influenzae, *Moraxella catarrhalis*: чутливі \leq 1мг/л, резистентні $>$ 1мг/л.

Решта патогенних мікроорганізмів: чутливі \leq 1мг/л, резистентні $>$ 2мг/л.

Спектр антибактеріальної дії

Поширеність набутої резистентності в окремих видів може варіювати в різних географічних точках та в часі, тому бажано мати місцеву інформацію щодо резистентності, особливо під час лікування тяжких інфекцій. Отже, наведена інформація може слугувати лише приблизним керівництвом щодо можливої чутливості мікроорганізмів до левофлоксацину. Якщо поширеність резистентності на місці є такою, що застосування препарату проти принаймні деяких видів інфекції є сумнівним, при необхідності слід звернутися до фахівця.

У наведеній нижче таблиці подані види бактерій, які зазвичай викликають зовнішні інфекційні захворювання очей, такі як кон'юнктивіт.

Спектр антибактеріальної дії – категорії чутливості та характеристики резистентності згідно з вимогами EUCAST

Категорія I: поширені чутливі види	
Аеробні грампозитивні мікроорганізми	
<i>Staphylococcus aureus</i> (MSSA)*	
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	
<i>Streptococcus pyogenes</i>	
Viridans group streptococci	
Аеробні грамнегативні мікроорганізми	
<i>Escherichia coli</i>	
<i>Haemophilus influenzae</i>	
<i>Moraxella catarrhalis</i>	
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	(Ізоляти з громадських місць)
Інші мікроорганізми	
<i>Chlamydia trachomatis</i>	(При лікуванні хворих на хламідійний кон'юнктивіт слід одночасно проводити системне протимікробне лікування)
Категорія II: види, які можуть створювати проблеми через набуту резистентність	
Аеробні грампозитивні мікроорганізми	
<i>Staphylococcus aureus</i> (MRSA)**	
<i>Staphylococcus epidermidis</i>	
Аеробні грамнегативні мікроорганізми	
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	(Ізоляти з лікарень)

* MSSA = штами *Staphylococcus aureus*, чутливі до метициліну

** MRSA = штами *Staphylococcus aureus*, резистентні до метициліну

Дані з резистентності, представлені у таблиці, базуються на результатах багатоцентрового дослідження зі спостереження (офтальмологічне дослідження) поширеності резистентності в ізолятах бактерій, взятих у хворих з очними інфекціями в Німеччині, червень – листопад 2004 р.

Мікроорганізми класифікували як чутливі до левофлоксацину на підставі чутливості, визначеної *in vitro*, та концентрації у плазмі після системної терапії. При місцевому застосуванні були досягнуті вищі пікові концентрації, ніж визначені у плазмі крові. Проте невідомо, чи може кінетика препарату після місцевого застосування в око змінити протибактеріальну дію левофлоксацину і яким чином.

Фармакокінетика.

Після застосування левофлоксацину добре зберігається у слізній плівці.

Середні концентрації левофлоксацину у слізній плівці, виміряні через 4 і 6 годин після місцевого дозування, становили 17 і 6,6 мкг/мл відповідно. Через 4 години після введення дози у п'яти з шести досліджуваних добровольців концентрації становили 2 мкг/мл і вище; у чотирьох з шести досліджуваних добровольців ця концентрація спостерігалася і через 6 годин після введення дози.

Концентрацію левофлоксацину в плазмі крові вимірювали у 15 здорових добровольців у різні моменти часу протягом 15-денного курсу застосування препарату. Середня концентрація левофлоксацину у плазмі крові через годину після прийому дози варіювалась від 0,86 нг/мл у 1-й день до 2,05 нг/мл на 15-й день. Найвищу максимальну концентрацію левофлоксацину – 2,25 нг/мл – було зафіксовано на 4-й день після 2 днів прийому кожні 2 години (загалом 8 доз на день).

Максимальні концентрації левофлоксацину зростали від 0,94 нг/мл у 1-й день до 2,15 нг/мл на 15-й день, що у 1 000 разів менше, ніж повідомлені концентрації після стандартних доз при прийомі левофлоксацину внутрішньо.

Концентрація левофлоксацину у плазмі крові після застосування в уражене око поки що невідома.

Фармацевтичні характеристики.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

ЗАТВЕРДЖЕНО

Сторінка 5 з 5. Видавець: Державний експертний центр МОЗ України

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий розчин від світло-жовтого до світлого зелено-жовтого, практично вільний від видимих механічних часток.

Термін придатності. 3 роки.

Після розкриття флакона препарат повинен бути використаний протягом місяця.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 5 мл у пластиковому флаконі з крапельницею; по 1 флакону у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Сантен АТ, Фінляндія/Santen Oy, Finland.

Місцезнаходження.

Ніттіхаанкату, 20, п.с. 33, 33721, Тампере, Фінляндія/

Niittyhaankatu 20, box 33, 33721, Tampere, Finland.