

Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства
ОФЛОКСАЦИН

Торговое название

Офлоксацин

Международное непатентованное название

Офлоксацин

Лекарственная форма

Раствор для инфузий 2 мг/мл

Состав

100 мл препарата содержит
активное вещество - офлоксацин 200 мг.
вспомогательные вещества - натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание

Прозрачная жидкость светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Антибактериальные препараты для системного использования. Производные хилолона. Фторхинолоны.

Офлоксацин.

Код АТХ J01MA01

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

После разовой инфузии препарата в дозе 200 мг в течение 60 мин максимальная концентрация в плазме крови составляет 2,7 мкг/мл, через 12 ч после введения концентрация офлоксацина в плазме крови составляет 0,3 мкг/мл.

Равновесные концентрации достигаются после 4 инфузий препарата.

При внутривенном введении офлоксацина в дозе 200 мг каждые 12 ч в течение 7 дней средние максимальные и минимальные равновесные концентрации составляют 2,9 и 0,5 мкг/мл соответственно. Связь с белками плазмы крови составляет 20 - 25 %.

Распределение офлоксацина: клетки (лейкоциты, альвеолярные макрофаги), кожа, мягкие ткани, кости, органы брюшной полости и малого таза, дыхательная система, моча, слюна, желчь, секрет предстательной железы, хорошо проникает через гематоэнцефалический барьер, плацентарный барьер, секретируется с материнским молоком.

Проникает в спинномозговую жидкость (14 - 60 %).

Офлоксацин частично (5 %) биотрансформируется в печени. Период полувыведения - 6 - 7 ч. До 80 % дозы выводится почками в неизмененном виде, небольшая часть через желудочно-кишечный тракт.

При гемодиализе удаляется 10 - 30 % препарата. У пациентов с нарушениями функции почек (клиренс креатинина 50 мл/мин и менее) период полувыведения офлоксацина увеличивается. Не кумулирует.

Фармакодинамика

Офлоксацин - противомикробное средство широкого спектра действия из группы фторхинолонов, действует на бактериальный фермент ДНК-гиразу, обеспечивающую сверхспирализацию и, таким образом, стабильность ДНК бактерий (дестабилизация цепей ДНК приводит к их гибели). Оказывает бактерицидный эффект. Активен в отношении микроорганизмов, продуцирующих бета-лактамазы и быстрорастущих атипичных микобактерий. Чувствительны: Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Escherichia coli, Citrobacter spp., Klebsiella spp. (включая Klebsiella pneumoniae), Enterobacter spp., Proteus spp. (включая Proteus mirabilis, Proteus vulgaris - индолположительные и индолотрицательные), Salmonella spp., Shigella spp., (включая Shigella sonnei), Yersinia enterocolitica, Campilobacter jejuni, Aeromonas hydrophila, Plesiomonas shigelloides, Vibrio cholerae, Vibrio parahaemolyticus, Haemophilus influenzae, Chlamydia spp., Legionella spp., Serratia spp., Providencia spp., Haemophilus ducreyi, Bordetella parapertussis, Bordetella pertussis, Moraxella catarrhalis, Propionibacterium acnes, Brucella spp.

Различной чувствительностью к препарату обладают: Enterococcus faecalis, Streptococcus pyogenes, pneumoniae и viridans, Serratia marcescens, Pseudomonas spp., Acinetobacter spp., Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneumoniae, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium fortuitum, Ureaplasma urealyticum, Clostridium perfringens, Corynebacterium spp., Helicobacter pylori, Listeria monocytogenes, Gardnerella vaginalis.

Не чувствительны к офлоксацину в большинстве случаев: Nocardia asteroides, анаэробные бактерии (например, Bacteroides spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Eubacter spp., Fusobacterium spp., Clostridium difficile). Не действует на Treponema pallidum.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными микроорганизмами:

- нижних дыхательных путей (острые и хронические инфекции)
- нижних и верхних мочевых путей (пиелонефрит) (острые и хронические инфекции)
- септицемия
- инфекции кожи и мягких тканей

Способ применения и дозы

Режим дозирования офлоксацина зависит от типа и тяжести инфекции.

Взрослым обычные внутривенные дозы:

Сложные инфекции мочевыводящих путей: 200 мг в сутки.
Инфекции нижних дыхательных путей: 200 мг два раза в сутки.
Сепсис: 200 мг два раза в сутки.

Инфекции кожи и мягких тканей: 400 мг два раза в сутки.

Время инфузии Офлоксацина должно быть не менее 30 мин. на 200 мг.

Разовые дозы, как правило, вводят через приблизительно равные интервалы.

Доза может быть увеличена до 400 мг два раза в день, при тяжелых и сложных инфекциях.

Пациентам с нарушениями функции почек: после обычной начальной дозы, дозировка должна быть снижена у пациентов с нарушениями функции почек.

Клиренс креатинина	Креатинин сыворотки	Доза
50 - 20 мл/мин	1,5 - 5,0 мг/дл	50 % обычной дозы (100 - 200 мг в сутки)
≤ 20 мл/мин	≥ 5 мг/дл	100 мг каждые 24 часа

Пациентам, перенесшим гемодиализ или перитонеальный диализ, 100 мг каждые 24 часа.

Пациентам с нарушениями функции печени: выведение офлоксацина может быть уменьшено у пациентов с тяжелой печеночной дисфункцией. Не рекомендуется превышать суточную дозу офлоксацина 400 мг/сутки при тяжелом нарушении функции печени.

Пациентам пожилого возраста: корректировка дозы не требуется, за исключением нарушений функции почек или печени, удлинения интервала QT.

Продолжительность лечения: определяется согласно чувствительности микроорганизмов и клинической картины. Лечение Офлоксацином, как для всех антибактериальных средств, следует продолжать не менее 3 дней после нормализации температуры тела и устранения симптомов болезни.

В большинстве случаев острой инфекции, курс лечения 7-10 дней. После улучшения состояния пациента, парентеральное введение заменяют на пероральный прием, обычно не меняя общую суточную дозу.

Побочные действия

Частые - более 1/100, но менее 1/10 (более 1%, но менее 10%)

- флебит при внутривенном введении
- боль, покраснение в месте инфузии

Нечастые - более 1/1000, но менее 1/100 (более 0,1%, но менее 1%)

- грибковая инфекция, резистентность возбудителей
- головная боль
- раздражение глаз
- головокружение (вертиго)
- кашель, ринит, фарингит
- боль в животе, диарея, тошнота, рвота
- зуд, сыпь

Редкие - более 1/10000, но менее 1/1000 (более 0,01%, но менее 0,1%)

- психомоторное возбуждение, расстройство сна, бессонница
- анафилактическая реакция*, анафилактоидные реакции*, отек Квинке
- анорексия
- сонливость, парестезии, нарушения вкуса и обоняния
- нарушение зрения
- тахикардия
- гипотензия
- одышка, бронхоспазм
- энтероколит, иногда геморрагический
- повышение активности печеночных ферментов (аминотрансфераз (АСТ и АЛТ), лактатдегидрогеназы (ЛДГ), гамма-глутамилтрансферазы (ГГТ) и/или щелочной фосфатазы (ЩФ)), увеличение билирубина в крови
- крапивница, приливы, потливость, гнойничковая сыпь
- тендинит
- увеличение креатинина сыворотки
- Очень редкие - менее 1/10000 (менее 0,01%)*
- анемия, гемолитическая анемия, лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения
- анафилактический шок*, анафилактоидный шок*
- психотические расстройства (галлюцинации), беспокойство, спутанное сознание, ночные кошмары, депрессия
- периферическая сенсорная нейропатия*, периферическая сенсорно-моторная нейропатия*, судороги*, экстрапирамидные симптомы или другие нарушения мышечной координации
- шум в ушах, потеря слуха
- псевдомембранозный колит*
- холестатическая желтуха
- мультиформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, реакции фоточувствительности*, ссадистая пурпура, васкулит, который может привести в исключительных случаях к некрозу кожи
- артралгия, миалгия, разрыв сухожилия (например, Ахиллова сухожилия) может произойти в течение 48 часов с начала лечения и может быть двусторонним
- острая почечная недостаточность

*Единичные случаи (не могут быть оценены по имеющимся данным) **

- агранулоцитоз, нарушение функции костного мозга
- гипогликемия у диабетиков, получавших гипогликемические препараты
- психотические расстройства и депрессии, сопровождающиеся опасным для пациента поведением, включая суицидальные мысли или попытки самоубийства
- желудочковые аритмии, включая torsades de pointes (преимущественно у пациентов с факторами риска удлинения QT), удлинение интервала на ЭКГ
- во время инфузии Офлоксацина может возникнуть тахикардия и гипотония, в очень редких случаях, такое снижение артериального давления может быть тяжелым
- аллергический пневмонит, тяжелая одышка
- гепатит, который может быть тяжелым*
- синдром Стивенса - Джонсона, острый генерализованный экзантематозный пустулез, лекарственная сыпь
- рабдомиолиз и/или миопатия, мышечная слабость, растяжение или разрыв мышц
- острый интерстициальный нефрит
- обострение порфирии у больных с порфирией

** пострегистрационный опыт.*

Противопоказания

- повышенная чувствительность к компонентам, входящим в состав препарата, а также к другим фторхинолонам
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы
- эпилепсия, в т.ч. в анамнезе
- снижение судорожного порога, в т.ч. после черепно-мозговой травмы, инсульта или воспалительных процессов в центральной нервной системе
- поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении фторхинолонами
- детский и подростковый возраст до 18 лет
- беременность, период лактации.

Лекарственные взаимодействия

Препараты, удлиняющие интервал QT. Офлоксацин, как и другие фторхинолоны, должен использоваться с осторожностью у пациентов, получающих препараты удлиняющие интервал QT (например, антиаритмические препараты класса IA и III, трициклические антидепрессанты, макролиды, нейролептики). При совместном введении Офлоксацина и антикоагулянтов, сообщалось о продлении времени кровотечения. Возможно дальнейшее снижение порога судорожной готовности головного мозга при одновременном введении хинолонов с другими препаратами, понижающими порог судорожной готовности, например теофиллин. Однако Офлоксацин не вызывает фармакокинетическое взаимодействие с теофиллином, в отличие от некоторых других фторхинолонов. Дальнейшее снижение порога судорожной активности головного мозга может также произойти при совместном применении с некоторыми нестероидными противовоспалительными препаратами. В случае судорожного приступа следует прекратить лечение Офлоксацином. Офлоксацин может вызвать незначительное увеличение концентрации глибенкламида в сыворотке при одновременном введении, в этом случае рекомендуется проводить тщательный мониторинг концентрации глюкозы в плазме.

В случае применения высоких доз хинолонов, может произойти взаимное замедление выведения и увеличение концентрации в сыворотке крови при совместном введении с препаратами, которые выводятся почечными канальцами (пробенецид, циметидин, фуросемид и метотрексат).

Влияние на лабораторные показатели: определение опиаатов или порфиринов в моче может дать ложноположительные результаты во время лечения Офлоксацином. Необходимо подтвердить положительные результаты на опиаат или порфирин более специфическими методами.

Рекомендуется тщательный мониторинг показателей свертываемости крови у пациентов, получающих одновременно антагонисты витамина К, из-за возможного увеличения эффекта производных кумарина.

Совместим с инфузионными растворами: 0.9 % раствор натрия хлорида, раствор Рингера, 5 % раствор декстрозы.

Не смешивать с гепарином (риск преципитации)!

Особые указания

Офлоксацин не является препаратом первого выбора для лечения пневмонии, вызванной *Pneumococci* или *Mycoplasma*, тонзиллита, вызванного β -haemolytic *Streptococci*.

После первого приема фторхинолона возможна гиперчувствительность к препарату и аллергические реакции. Анафилактические и анафилактикоидные реакции могут прогрессировать до угрожающего жизни шока, даже после первого приема. В этих случаях следует прекратить применение Офлоксацина и начать соответствующее лечение.

Clostridium difficile ассоциированные заболевания. Появление диареи, особенно в тяжелой, стойкой и/или кровавой форме, во время или после лечения Офлоксацином, может быть симптомом псевдомембранозного колита. При подозрении на псевдомембранозный колит, следует немедленно прекратить применение Офлоксацина и незамедлительно назначить соответствующую антибактериальную терапию (например, перорально ванкомицин, тейкоплантин или метронидазол). При возникновении этой клинической ситуации противопоказаны продукты, подавляющие перистальтику кишечника.

Пациенты, предрасположенные к появлению судорог. В случае судорожных приступов следует прекратить лечение Офлоксацином.

Сердечные заболевания. Следует проявлять осторожность при применении фторхинолонов, включая Офлоксацин, у пациентов с известными факторами риска удлинения интервала QT:

- врожденный синдром удлинения QT
- лечение другими препаратами, удлиняющими интервал QT (антиаритмические препараты класса IA и III, трициклические антидепрессанты, макролиды, нейролептики)
- некомпенсированные нарушения электролитного баланса крови (гипокалиемия, гипомagneмия)
- болезни сердца (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия).

Пожилые пациенты и женщины могут быть более чувствительны к препаратам, удлиняющим интервал QT. Следует проявлять осторожность при применении фторхинолонов, включая Офлоксацин, в этих популяциях. *Фотосенсибилизация.* В период лечения Офлоксацином, следует избегать прямого воздействия солнечного света и УФ-лучей (рутно-кварцевые лампы, солярии).

Пациенты с психотическими расстройствами. Офлоксацин должен использоваться с осторожностью у пациентов с психотическими расстройствами или психическими заболеваниями. В случае появления психотических реакций, лечение Офлоксацином должно быть прекращено и приняты соответствующие меры.

Пациенты с нарушением функции печени. Офлоксацин должен применяться с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени. Сообщалось о случаях гепатита, который может привести к печеночной недостаточности (в том числе со смертельным исходом). Пациентам следует рекомендовать прекратить лечение и обратиться к врачу, при развитии признаков и симптомов болезни печени (анорексия, желтуха, потемнение мочи).

Антагонисты витамина К. Из-за возможного увеличения показателей свертывания крови (PT/INR) и/или кровотечения у пациентов, получавших фторхинолоны, при применении Офлоксацина, в том числе в комбинации с антагонистом витамина К (например, варфаринами), необходимо осуществлять контроль свертывающей системы крови, в связи с лекарственными взаимодействиями этих препаратов.

Миастения. Офлоксацин должен использоваться с осторожностью у пациентов с миастенией в анамнезе.

Гипотензия. Возможно внезапное снижение артериального давления при совместном введении Офлоксацина с гипотензивными препаратами. В таких случаях, или при одновременном применении с барбитуратами и анестетиками, должна контролироваться функция сердечно-сосудистой системы.

Вторичная инфекция. Длительное введение Офлоксацина, как и при лечении другими антибиотиками, может привести к распространению устойчивых микроорганизмов. Следует проводить регулярно оценку состояния пациента. При возникновении вторичной инфекции, необходимо принять соответствующие меры.

Периферическая нейропатия. Сообщалось о развитии сенсорной или сенсорно-моторной периферической нейропатии у пациентов, получавших фторхинолоны, включая офлоксацин. Применение Офлоксацина должно быть прекращено, при появлении симптомов нейропатии, для предотвращения развития необратимого состояния.

Гипогликемия. При применении офлоксацина, как и всех хинолонов, сообщалось о развитии гипогликемии, особенно у пациентов с сахарным диабетом, получающих пероральные гипогликемические препараты (глибенкламид) или инсулин. У таких пациентов рекомендуется тщательный мониторинг концентрации глюкозы в крови.

Пациенты с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы. Пациенты со скрытым или фактическим дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, могут быть предрасположены к гемолитической реакции при введении хинолонов.

Пациенты с редкими наследственными заболеваниями. При непереносимости глюкозы и галактозы, или мальабсорбции галактозы (галактоземия), дефиците лактазы, не следует применять Офлоксацин.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами.

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Передозировка

Симптомы: со стороны центральной нервной такие как, спутанность сознания, головокружение, нарушения сознания и судорожные припадки, а также реакции со стороны желудочно-кишечного тракта, такие как тошнота и эрозии слизистой оболочки.

Лечение: выведение Офлоксацина путем принудительного диуреза. Симптоматическая терапия. Следует провести мониторинг ЭКГ, учитывая возможность удлинения интервала QT.

Форма выпуска и упаковка

По 100 мл в бутылки стеклянные, укупоренные пробками резиновыми, обжатые колпачками алюминиевыми или комбинированными.

От 1 до 48 бутылок с 1-5 инструкциями по медицинскому применению на государственном и русском языках в ящике из гофрокартона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте!

Не использовать при помутнении.

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель, владелец регистрационного удостоверения

ОАО «Красфарма», Россия

660042, г. Красноярск, ул. 60 лет Октября, д. 2

Тел./факс (391) 261-25-90 / 261-17-44.

Адрес организации, принимающей претензии от потребителей по качеству препарата на территории Республики Казахстан:

ТОО «Медлайн Фармацевтика»

Республика Казахстан, 050054, г. Алматы, ул. Суюнбая, 162 А.

Тел. (727) 225-00-36, 225-00-37.