

**Дәрілік заттың медицинада қолданылуы
жөніндегі нұсқаулық
ОФЛОКСАЦИН**

Саудалық атауы

Офлоксацин

Халықаралық патенттелмеген атауы

Офлоксацин

Дәрілік түрі

Инфузияға арналған 2 мг/мл ерітінді

Құрамы

100 мл препараттың құрамында

белсенді зат - 200 мг офлоксацин.

қосымша заттар - натрий хлориді, инъекцияға арналған су.

Сипаттамасы

Ашық-сары түсті мөлдір сұйықтық.

Фармакотерапиялық тобы

Бактерияға қарсы жүйелі пайдалануға арналған препараттар. Хинолон туындылары. Фторхинолондар. Офлоксацин.

АТХ коды J01MA01

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

200 мг дозадағы препараттың 60 минут ішіндегі бір реттік инфузиясынан кейін қан плазмасындағы ең жоғары концентрациясы 2,7 мг/мл құрайды, енгізгеннен кейін 12 сағаттан соң қан плазмасындағы офлоксацин концентрациясы 0,3 мг/мл құрайды.

Тепе-тең концентрацияларына препарат 4 инфузиядан кейін жетеді.

Офлоксацин 200 мг дозада 7 күн бойы әр 12 сағат сайын көктамыр ішіне енгізілгеннен кейін орташа ең жоғары және ең төмен тепе-тең концентрациялары, тиісінше, 2,9 және 0,5 мг/мл құрайды. Қан плазмасы ақуыздарымен байланысуы 20 - 25 % құрайды.

Офлоксацин жасушалар (лейкоциттер, альвеолярлы макрофагтар), тері, жұмсақ тіндер, сүйектер, құрсақ қуысы және кіші жамбас ағзалары, тыныс алу жүйесі, несеп, сілекей, өт, қуық асты безінің секретінде таралады; гематозенцефалдық бөгет, плаценталық бөгет арқылы жақсы өтеді, ана сүтімен бөлініп шығады.

Жұлын сұйықтығына өтеді (14 - 60 %).

Офлоксацин бауырда ішінара (5 %) биоөзгеріске ұшырайды. Жартылай шығарылу кезеңі - 6 - 7 сағат. 80 % дозаға дейін өзгермеген күйде бүйрекпен, аздаған бөлігі асқазан-ішек жолы арқылы шығарылады. Гемодиализ кезінде 10 - 30 % препарат шығарылады. Бүйрек функциясы бұзылған емделушілерде (креатинин клиренсі 50 мл/мин және одан аз) офлоксациннің жартылай шығарылу кезеңі ұзарады. Жинақталмайды.

Фармакодинамикасы

Офлоксацин - фторхинолондар тобына жататын әсер ету ауқымы кең микробқа қарсы дәрі. аса жоғары спиральдануды, осыялайша, бактериялардың ДНҚ тұрақтылығын қамтамасыз ететін бактериялық ДНҚ-гираза ферментіне әсер етеді (ДНҚ тізбектерінің тұрақсыздануы олардың жоюылуына әкеледі). Бактерицидті әсер көрсетеді.

Бета-лактамаза өндіретін микроорганизмдерге және тез өсетін атипиялық микобактерияларға қатысты белсенді. Сезімталдары: Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Escherichia coli, Citrobacter spp., Klebsiella spp. (Klebsiella pneumoniae қоса), Enterobacter spp., Proteus spp. (Proteus mirabilis, Proteus vulgaris - индол-оң және индол-терістерді қоса), Salmonella spp., Shigella spp. (Shigella sonnei қоса), Yersinia enterocolitica, Campylobacter 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.

Препаратқа сезімталдығы әртүрлі болып келетіндері: Enterococcus faecalis, Streptococcus pyogenes, pneumoniae және viridans, Serratia marcescens, Pseudomonas spp., Acinetobacter spp., Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneumoniae, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium fortuitum, Ureaplasma urealyticum, Clostridium perfringens, Corynebacterium spp., Helicobacter pilori, Listeria monocytogenes, Gardnerella vaginalis.

Офлоксацинге көптеген жағдайларда сезімтал еместері: Nocardia asteroides, анаэробты бактериялар (мысалы, Bacteroides spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Eubacter spp., Fusobacterium spp., Clostridium difficile). Treponema pallidum-ге әсер етпейді.

Қолданылуы

Сезімтал микроорганизмдер туғызған жұқпалы-қабыну ауруларында:

- төменгі тыныс жолдарында (жедел және созылмалы жұқпалар)
- төменгі және жоғарғы несеп жолдарында (пиелонефрит) (жедел және созылмалы жұқпалар)
- септицемияда
- терінің және жұмсақ тіндердің жұқпаларында

Қолдану тәсілі және дозалары

Офлоксацинді дозалау режимі жұқпа типіне және ауырлығына байланысты.

Ересектерге әдеттегі көктамырішілік дозалары:

Сипес шығару жолдарының күрделі жұқпалары: тәулігіне 200 мг.

Төменгі тыныс жолдарының жұқпалары: тәулігіне екі рет 200 мг.

Сипес: тәулігіне екі рет 200 мг.

Терінің және жұмсақ тіндердің жұқпалары: тәулігіне екі рет 400 мг.

Офлоксацин инфузиясының уақыты 200 мг үшін 30 минуттан кем болмауы тиіс. Бір реттік дозаларын, әдетте, шамамен тең аралықтар арқылы енгізеді.

Ауыр және күрделі жұқпалар кезінде дозаны күніне екі рет 400 мг дейін арттыруға болады.

Бүйрек функциясы бұзылған емделушілерге: әдеттегі бастапқы дозасынан кейін бүйрек функциясы бұзылған емделушілерге төмен дозалануы тиіс.

Креатинин клиренсі	Сарысу креатинині	Дозасы
50 - 20 мл/мин	1,5 - 5,0 мг/дл	әдеттегі дозадан 50 % (тәулігіне 100 - 200 мг)
≤ 20 мл/мин	≥ 5 мг/дл	әр 24 сағат сайын 100 мг

Гемодиализ және перитонеальді диализ жасалған емделушілерге - әр 24 сағат сайын 100 мг.

Бауыр функциясы бұзылған емделушілерге: бауырының ауыр дисфункциясы бар емделушілерде офлоксацин аз шығарылуы мүмкін. Бауыр функциясының ауыр бұзылуында офлоксациннің тәуліктік дозасын 400 мг/тәуліктен асыру ұсынылмайды.

Егде жастағы емделушілерге: бүйрек немесе бауыр функциясының бұзылуын, QT аралығының ұзаруын қоса, дозаны түзету қажет емес.

Емдеу ұзақтығы: микроорганизмдер сезімталдығына және клиникалық көрініске сай белгіленеді. Офлоксацинмен емдеуді, бактерияға қарсы барлық дәрілер сияқты, дене температурасы қалпына түскеннен кейін және ауру симптомдары жойылған соң кемінде 3 күн жалғастырылған жөн.

Жедел жұқпаның көптеген жағдайларында емдеу курсы - 7-10 күн. Емделушінің жағдайы жақсарғаннан кейін, әдетте, жалпы тәуліктік дозасын өзгертпестен парентеральді енгізуді ішу арқылы қабылдауға алмастырады.

Жағымсыз әсерлері

Жиі - 1/100-ден аса, бірақ 1/10-нан аз (1 %-дан аса, бірақ 10%-дан аз)

- көктамыр ішіне енгізген кездегі флебит

- инфузия орнындағы ауыру, қызару

Жиі емес - 1/1000-нан аса, бірақ 1/100-ден аз (0,1 %-дан аса, бірақ 1 %-дан аз)

- зең жұқпасы, қоздырғыштардың төзімділігі

- бас ауыру

- көздің тітіркенуі

- бас айналу (вертиго)

- жөтел, ринит, фарингит

- іштің ауыруы, диарея, жүрек айну, құсу

- қышыну, бөртпе

Сирек - 1/10000-нан аса, бірақ 1/1000-нан аз (0,01 %-дан аса, бірақ 0,1 %-дан аз)

- психомоторлық қозу, ұйқы бұзылыстары, ұйқысыздық

- анафилактікалық реакция*, анафилактоидтық реакциялар*, Квинке ісінуі

- анорексия

- ұйқышылдық, парестезиялар, дем сезудің және иіс сезудің бұзылуы

- көрудің нашарлауы

- тахикардия

- гипотензия

- ентігу, бронх түйілу

- энтероколит, кейде геморрагиялық

- бауыр ферменттері (аминотрансферазалар (АСТ және АЛТ), лактатдегидрогеназа (ЛДГ), гамма-глутамилтрансфераза (ГГТ) және/немесе сілтілік фосфатаза (СФ)) белсенділігінің жоғарылауы, қандағы билирубиннің артуы

- есеюкем, ысынулар, тершеңдік, іріңді бөртпе

- тендинит

- сарысудағы креатининнің көтерілуі

Өте сирек - 1/10000-нан аз (0,01 %-дан аз)

- анемия, гемолитикалық анемия, лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения

- анафилактікалық шок*, анафилактоидтық шок*

- психоздық бұзылыстар (елестеулер), мазасыздық, сананың шатасуы, түнгі шым-шытырық түстер, депрессия

- шеткергі сенсорлы нейропатия*, шеткергі сенсорлы-моторлы нейропатия*, құрысулар*, экстрапирамидалық

симптомдар немесе бұлшықеттік қозғалыс үйлесімінің басқа да бұзылулары

- құлақтың шуылдауы, өстімей қалу

- жалған жарғақшалы колит*

- холестатикалық сарғаю

- мультиформалы эритема, уытты эпидермалық некролиз, фотосезімталдық реакциялары*, қантамырлық пур-

пура, айрықша жағдайларда тері некрозына әкелуі мүмкін васкулит

- артралгия, миалгия, сіңірлердің (мысалы, Ахилл сіңірлері) үзілуі емдеудің басталуынан 48 сағат өткенде және екі жақты болуы мүмкін

- жедел бүйрек жеткіліксіздігі

*Бірлі-жарым жағдайлар (қолда бар деректер бойынша бағалау мүмкін емес)**

- агранулоцитоз, сүйек кемігі функциясының бұзылуы
- гипогликемиялық препараттар алатын диабетиктердегі гипогликемия
- суицидтік ойларды немесе өзін-өзі өлтіру әрекеттерін қоса, психоздық бұзылыстар және емделушіге қауіпті мінез-құлықпен қатар жүретін депрессиялар
- қарыншалық аритмиялар, torsades de pointes қоса (көбінесе QT ұзаруының қауіп факторлары бар емделушілерде), ЭКГ-да аралықтың ұзаруы
- Офлоксацин инфузиясы кезінде тахикардия мен гипотония пайда болуы мүмкін, өте сирек жағдайларда артериялық қысымның осылай төмендеуі ауыр болуы мүмкін
- аллергиялық пневмонит, ауыр енгізу
- ауыр болуы мүмкін гепатит*
- Стивенс-Джонсон синдромы, жедел жайылған экзантематозды пустулез, дерілік бөртпе
- рабдомиолиз және/немесе миопатия, бұлшықет әлсіздігі, бұлшықеттердің созылуы немесе жыртылуы
- жедел интерстициальді нефрит
- порфириясы бар науқастарда порфирияның өршуі

** тіркеуден кейінгі тәжірибе.*

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- препарат құрамына кіретін компоненттерге, сондай-ақ басқа фторхинолондарға жоғары сезімталдық
- глюкоза-6-фосфатдегидрогеназа тапшылығы
- эпилепсия, соның ішінде сыртартқыдағы
- құрысу шегінің төмендеуінде, соның ішінде бассүйек-ми жарақатынан, инсульттен немесе орталық жүйке жүйесіндегі қабыну үдерістерінен кейін
- бұрын жүргізілген фторхинолондармен емдеу кезінде сіңірлердің зақымдануы
- 18 жасқа дейінгі балалар мен жасөспірімдерге
- жүктілік, лактация кезеңі.

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

QT аралығын ұзартатын препараттар. Офлоксацин, басқа да фторхинолондар сияқты, QT аралығын ұзартатын препараттарды (мысалы, IA және III класты аритмияға қарсы препараттар, үш циклды антидепрессанттар, макролиттер, нейролептиктер) алатын емделушілерде сақтықпен пайдаланылуы тиіс.

Офлоксацин мен антикоагулянттар бірге енгізілгенде қан кету уақытының ұзаруы хабарланды.

Хинолондарды құрысуға дайындық шегін төмендететін басқа препараттармен, мысалы, теофиллинмен бір мезгілде енгізгенде мидың құрысуға дайындық шегі әріқарай төмендеуі мүмкін.

Алайда, кейбір басқа фторхинолондардан ерекшелігі, Офлоксацин теофиллинмен фармакокинетикалық өзара әрекеттесуге түспейді. Мидың құрысуға дайындық шегінің әріқарай төмендеуі кейбір қабынуға қарсы стероидты емес препараттармен бірге қолданған кезде де болуы мүмкін. Құрысу ұстамасы жағдайында Офлоксацинмен емдеуді тоқтату керек.

Офлоксацин бір мезгілде енгізілгенде сарысудағы глибенкламид концентрациясын мардымсыз жоғарылатуы мүмкін, бұл жағдайда тағамдағы глюкоза концентрациясына мұқият мониторинг жасау ұсынылады.

Хинолондардың жоғары дозаларын қолданған жағдайда бүйрек өзекшелерімен шығарылатын препараттармен (пробенецид, циметидин, фуросемид және метотрексат) бірге енгізілгенде шығарылуының өзара баяулауы және қан сарысуындағы концентрацияларының ұлғаюы мүмкін.

Зертханалық көрсеткіштерге ықпалы: Офлоксацинмен емделу кезінде несептегі апиындар немесе порфиринді анықтау жалған оң нәтижелер беруі мүмкін. Апиын немесе порфиринге оң нәтижелерін мейлінше спецификалық әдістермен растау қажет.

Кумарин туындылары әсерінің артуы мүмкін екендіктен, К витамині антагонистерін бір мезгілде алатын емделушілерде қанның үю көрсеткіштеріне мұқият мониторинг жасау ұсынылады.

Мына инфузиялық ерітінділермен: 0.9 % натрий хлориді ерітіндісі, Рингер ерітіндісі, 5 % декстроза ерітіндісімен үйлеспеді.

Гепаринмен араластыруға болмайды (преципитация қаупі)!

Айрықша нұсқаулар

Офлоксацин Rheumococci немесе Mycoplasma туғызған пневмонияны, β-haemolytic Streptococci туғызған тонзиллитті емдеуге арналған алғашқы таңдау препараты болып табылмайды.

Фторхинолон алғаш қабылданғаннан кейін препаратқа аса жоғары сезімталдық және аллергиялық реакциялар болуы мүмкін. Анафилактикалық және анафилактоидтық реакциялар, тіпті бірінші қабылдағаннан кейін де, өмірге қатер төндіретін шоққа дейін үдеуі мүмкін. Бұл жағдайларда Офлоксацин қолдануды тоқтатып, тиісті емді бастау керек.

Clostridium difficile астасқан аурулар. Офлоксацинмен емделу кезінде немесе одан кейін, әсіресе, ауыр, тұрақты және/немесе қан аралас түрдегі диарея пайда болуы жалған жарақашалы колиттің симптомны болуы мүмкін. Жалған жарақашалы колиттен күдіктенгенде, Офлоксацин қолдану дереу тоқтатылып, бактерияға қарсы тиісті ем (мысалы, ішуге арналған ванкомицин, тейкопланин немесе метронидазол) шұғыл тағайындалу керек. Осы клиникалық жағдай туындағанда ішек перистальтикасын бәсеңдететін өнімдер қарсы көрсетілмді.

Құрысулардың пайда болуына бейімді емделушілер. Құрысу ұстамалары жағдайында Офлоксацинмен емдеуді тоқтату керек.

Жүрек аурулары. QT аралығы ұзаруының қауіп факторлары бар емделушілерде, Офлоксацинді қоса, фторхинолондарды қолданғанда сақтық таныту керек:

- туа біткен QT ұзару синдромы

- QT аралығын ұзартатын басқа препараттармен (IA және III класты аритмияға қарсы препараттар, үш циклды антидепрессанттар, макролиттер, нейролептиктер) емдеу

- қанның электролиттік теңгерімінің қалпына келмейтін бұзылулары (гипокалиемиия, гипомagneмия)

- жүрек аурулары (жүрек жеткіліксіздігі, миокард инфарктісі, брадикардия).

Егде жастағы емделушілер мен өмілерде QT аралығын ұзартатын препараттарға аса сезімтал болуы мүмкін. Осы қауымдарда, Офлоксацинді қоса, фторхинолондарды қолданғанда сақтық таныту керек.

Фотосенсибилизация. Офлоксацинмен емделу кезеңінде тіке түсетін күн сәулесінің және УК-сәулелер (сынап-кварц шамдары, солярйлер) әсерлеріне ұшырамаған дұрыс.

Психоздық бұзылыстары бар емделушілер. Офлоксацин психоздық бұзылыстары немесе психикалық аурулары бар емделушілерде абайлап пайдаланылуы тиіс. Психоздық реакциялар пайда болған жағдайда, Офлоксацинмен емдеу тоқтатылып, тиісті шаралар қабылдануы тиіс.

Бауыр функциясы бұзылған емделушілер. Офлоксацин бауыр функциясының бұзылулары бар емделушілерде сақтықпен қолданылуы тиіс. Бауыр жеткіліксіздігіне (соның ішінде өліммен аяқталатын) әкелуі мүмкін гепатит жағдайлары хабарланды. Емделушілерге бауыр ауруының белгілері мен симптомдары (анорексия, сарғаю, несептің құңғірттенуі) дамығанда емдеуді тоқтатуға және дәрігерге қаралуға кеңес беру керек.

К витаминінің антагонисттері. Қанның үю көрсеткіштерінің (PT/INR) жөнінде емес/немесе қан кетудің артуы мүмкін екендіктен, фторхинолондар алған емделушілерде Офлоксацин, соның ішінде К витамині антагонисімен (мысалы, варфариндермен) біріктіріп қолданылғанда, осы препараттардың дәрілік өзара әрекеттесулеріне байланысты, қанның үю жүйесіне бақылау жүргізу қажет.

Миастения. Офлоксацин сыртартқыдағы миастениясы бар емделушілерде сақтықпен пайдаланылуы тиіс.

Гипотензия. Офлоксацинді гипотензиялық препараттармен бірге енгізгенде артериялық қысым күрт төмендеуі мүмкін. Мұндай жағдайларда немесе барбитураттармен және анестетиктермен бір мезгілде қолданғанда жүрек-қантамыр жүйесінің функциясы бақылауда болуы тиіс.

Салдарлы жұқта. Офлоксацинді ұзақ уақыт енгізу, басқа антибиотиктермен емдеу кезіндегідей, төзімді микроорганизмдердің таралуына әкелуі мүмкін. Емделушінің жай-күйін ұдайы бағалап отыру керек. Салдарлы жұқта пайда болғанда тиісті шаралар қабылдау қажет.

Шеткергі нейроталпия. Офлоксацинді қоса, фторхинолондар алған емделушілерде сенсорлы немесе сенсорлы-моторлы шеткергі нейроталпияның дамуы хабарланды. Қайтымсыз жағдайдың дамуын болдырмау үшін нейроталпия симптомдары білінгенде Офлоксацин қолдану тоқтатылуы тиіс.

Гипогликемия. Офлоксацин қолданылғанда, барлық хинолондар сияқты, әсіресе, ішуге арналған гипогликемиялық препараттар (глибенкламид) немесе инсулин алатын қант диабеті бар емделушілерде гипогликемияның дамуы хабарланды. Мұндай емделушілерде қандағы глюкоза концентрациясына мұқият мониторинг жасау ұсынылады.

Глюкоза-6-фосфатдегидрогеназа тапшылығы бар емделушілер. Глюкоза-6-фосфатдегидрогеназаның жасырын немесе нақтылы тапшылығы бар емделушілер хинолондар енгізу кезінде гемолитикалық реакцияға бейім болуы мүмкін.

Сирек тұжым қуалайтын аурулары бар емделушілер. Глюкоза мен галактозаны көтере алмаушылықта немесе галактоза (галактоземия) мальабсорбциясында, лактаза тапшылығында Офлоксацин қолдануға болмайды.

Дерілік заттың көлік қралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсер ету ерекшеліктері.

Емделу кезеңінде автокөлік жүргізуден және жоғары зейін шоғырландыру мен психомоторлық реакциялар шапшаңдығын талап ететін аса қауіпті қызмет түрлерімен айналысудан бас тарту қажет.

Артық дозалануы

Симптомдары: орталық жүйке жүйесі тарапынан сананың шатасуы, бас айналу, сананың бұзылуы және құрысу ұстамалары сияқты, сондай-ақ асқазан-ішек жолы тарапынан жүрек айну мен шырышты қабық эрозиясы сияқты реакциялар.

Емі: Офлоксацинді еріксіз диурез арқылы шығару. Симптоматикалық ем. QT аралығының ұзару мүмкіндігін ескеріп, ЭКГ мониторинг жасаған жөн.

Шығарылу түрі және қаптамасы

Алюминий немесе біріктірілген қалпақшалармен қаусырылған, резеңке тығындармен тығындалған шыны бөтелкелерде 100 мл.

1-ден 48 бөтелкеге дейін медицинада қолданылуы жөніндегі мемлекеттік және орыс тілдеріндегі 1 -5 нұсқаулықпен бірге гофрокартоннан жасалған жәшікте.

Сақтау шарттары

Жарықтан қорғалған жерде, 25 °C-ден аспайтын температурада сақтау керек. Мұздатып қатыруға болмайды. Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Бұлыңғырланған кезде пайдалануға болмайды.

Сақтау мерзімі

2 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

Деріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші, тіркеу куәлігінің иесі

«Красфарма» ААҚ, Ресей

660042, Красноярск қ., 60 лет Октября к-сі, 2 үй

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

Қазақстан Республикасы аумағында тұтынушылардан препарат сапасына қатысты шағымдар қабылдайтын ұйымның мекенжайы:

«Медлайн Фармацевтика» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050054, Алматы қ., Сүйінбай к-сі, 162 А.

Тел. (727) 225-00-36, 225-00-37.