

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОФЛОКСАЦИН
(OFLOXACIN)

Склад:

діюча речовина: офлоксацин;

1 таблетка містить офлоксацину 200 мг (0,2 г);

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль картопляний, магнію стеарат, стеаринова кислота, натрію кроскармелоза.

Лікарська форма. Таблетки.

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

Клінічні характеристики.

Показання.

Інфекції, спричинені чутливими до препарату 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 або до інших похідних фторхінолонів;
- ураження зі зниженим судомним порогом (після черепно-мозкової травми, інсульту, запальних захворювань головного мозку);
- епілепсія;
- дефіцит глюкозо-6-фосфатдегідрогенази;
- тендиніти в анамнезі.

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

Спосіб застосування та дози.

Середньодобову дозу препарату Офлоксацин слід підбирати 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. У такому випадку дозу слід розподілити на 2 прийоми та давати пацієнту через рівні інтервали часу. Таблетки слід приймати цілими, не розжовуючи, запиваючи водою як до, так і після прийому 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.

Пацієнти з печінковою недостатністю.

Максимальна добова доза препарату не має перевищувати 400 мг.

Пацієнти з порушенням функції нирок.

Для пацієнтів із порушеною функцією нирок рекомендуються нижчезазначені дози.

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

Для дозування по 100 мг слід застосовувати препарати офлоксацину у відповідних лікарських формах.

Побічні реакції.

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. Одразу після введення офлоксацину можуть розвинути анафілактичні або анафілактоїдні реакції (ознаки анафілаксії – тахікардія, гарячка, задишка, шок, ангіоневротичний набряк, васкуліт, еозинофілія). У випадку такої реакції введення Офлоксацину слід припинити і розпочати альтернативну терапію.

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 травного тракту: нудота, блювання, діарея, яка може бути симптомом геморагічного ентероколіту, метеоризм, біль та різь у животі, анорексія (відсутність апетиту); рідко – холе-статична жовтяниця, гепатит або тяжке ураження печінки, підвищення рівня печінкових ферментів та білірубіну у плазмі крові, псевдомембранозний коліт. У випадку виникнення псевдомембранозного коліту прийом препарату слід припинити і призначити відповідну терапію. У 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.

З боку кровотворної системи: дуже рідко – лейкопенія, агранулоцитоз, еозинофілія, тромбоцитопенія, панцитопенія, пригнічення кісткومозкового кровотворення; у поодиноких випадках – анемії, у т. ч. гемолітична анемія.

Порушення метаболізму: гіперглікемія або гіпоглікемія (у хворих на цукровий 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 має 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.

Офлоксацин протипоказаний жінкам у період вагітності або годування груддю у зв'язку з недостатністю досвіду застосування препарату. Екскреція офлоксацину у грудне молоко значна.

У разі необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити на період лікування.

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; після отримання результатів тестів адекватна терапія має бути продовжена. Під час лікування офлоксацином, як і іншими лікарськими засобами цієї групи, резистентність деяких штамів *Pseudomonas aeruginosa* може розвинути досить швидко.

При застосуванні Офлоксацину 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 призначену дозу офлоксацину необхідно скорегувати, враховуючи уповільнене 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 слід припинити.

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

У випадку виникнення тяжкої артеріальної гіпотензії слід припинити застосування препарату.

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

Пацієнтам із порушенням функції центральної нервової системи (порушення мозкового кровообігу, епілесія) Офлоксацин слід призначати з обережністю через небезпеку виникнення судом або зниження судомного порога.

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 не слід вживати алкоголь.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід застосовувати препарат.

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

Під час лікування препаратом Офлоксацин 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 з препаратами, які подовжують інтервал QT (антиаритмічні засоби класу IA – хінін, прокаїнамід та класу III – аміодарон, соталол, трициклічні антидепресанти, макроліди).

При застосуванні Офлоксацину одночасно з нестероїдними протизапальними засобами, похідними нітроїмідазолу та метилксантинів, підвищується ризик розвитку нейтротоксичних ефектів, зокрема зниження судомного порога, 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.

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

При одночасному застосуванні офлоксацину з варфарином необхідно здійснювати постійний контроль системи згортання крові.

При застосуванні офлоксацину з препаратами, що олузняють 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 у плазмі крові.

При одночасному застосуванні офлоксацину з пероральними протидіабетичними засобами, інсуліном можлива гіпоглікемія або гіперглікемія. Тому необхідно обов'язково проводити моніторинг параметра їх компенсації.

Одночасне застосування препарату з антацидами, що вміщують кальцій, магній або алюміній, із сукральфатом, із двовалентним або тривалентним залізом, з мультивітамінами, що мають у своєму складі цинк, знижує інтенсивність всмоктування офлоксацину. Тому інтервал між прийомами цих препаратів має 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 spp.*, *Yersinia spp.*, *Vibrio spp.*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus ducreyi*, *Aeromonas hydrophila*, *Bordetella pertussis*, *Moraxella catarrhalis*, *Propionibacterium acnes*, *Brucella spp.*, *Legionella spp.*; *Staphylococcus spp.*, *Streptococcus aureus*, *Chlamydia trachomatis*, *Mycoplasma spp.*, атипові 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, актиноміцети, фузобактерії, ентерококи, метицилінрезистентні стафілококи, нокардії.

Фармакокінетика

Максимальна концентрація офлоксацину у плазмі крові залежить від дози і спостерігається вже через 1-2 години після прийому. Прийоміжі 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 застосованого препарату може вільно проникати у клітини, забезпечуючи високі концентрації в органах, тканинах і рідинах організму – у 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 у незміненому вигляді; близько 4 % виводиться з калом.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого з жовтуватим відтінком кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

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

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 блістеру у пачці; або по 50 або по 100 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

АТ «Лекхім-Харків».

Місцезнаходження.

Україна, 61115, м. Харків, вул. 17-го Партз'їзду, 36.