

ИНСТРУКЦИЯ
(информация для специалистов)
по медицинскому применению препарата

ОФЛОКСАЦИН

Регистрационный номер: Р № 001953/01-2002

Торговое название препарата: Офлоксацин

Международное непатентованное название (МНН): Офлоксацин

Химическое название:

(±)-9-Фторо-2,3-дигидро-3-метил-10-(4-метил-1-пиперазинил)-7-оксо-7Н-пиридо[1,2,3-де]-1,4-бенз
оксазин-6-карбоксилловая кислота

Лекарственная форма:

таблетки, покрытые оболочкой.

Состав:

Одна таблетка содержит активного вещества офлоксацина – 200 мг, а также вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, поливинилпирролидон низкомолекулярный, магний стеариновоокислый, оксипропилцеллюлоза импортная, титан диоксид, твин-80.

Описание:

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой белого цвета. На поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой (ядро) белого цвета с желтоватым оттенком.

Фармакологические свойства

Фармакотерапевтическая группа:

Противомикробное средство, фторхинолон.

Код АТС J01MA01

Фармакодинамика

Противомикробное средство широкого спектра действия из группы фторхинолонов, оказывает бактерицидный эффект. Действует на бактериальный фермент ДНК-гиразу и обеспечивает стабильность ДНК бактерий (вызывает дестабилизацию цепей ДНК и приводит к гибели микроорганизмов).

Активен в отношении микроорганизмов, продуцирующих бета-лактамазы и быстрорастущих атипичных микобактерий.

Чувствительны к офлоксацину: *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Escherichia coli*, *Citrobacter*, *Klebsiella* spp. (включая *Klebsiella pneumoniae*), *Enterobacter* spp., *Hafnia*, *Proteus* spp. (включая *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris* - индол-положительные и индол-отрицательные), *Salmonella* spp., *Shigella* spp. (включая *Shigella sonnei*), *Yersinia enterocolitica*, *Campylobacter jejuni*, *Aeromonas hydrophila*, *Plesiomonas aeruginosa*, *Vibrio cholerae*, *Vibrio parahaemolyticus*, *Haemophilus influenzae*, *Chlamydia* spp., *Legionella* spp., *Serratia* spp., *Providencia* spp., *Haemophilus ducreyi*, *Bordetella parapertussis*, *Bordetella pertussis*, *Moraxella catarrhalis*, *Propionibacterium acnes*, *Staphylococcus* spp., *Brucella* spp.

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

Gardnerella vaginalis.

В большинстве случаев нечувствительны: *Nocardia asteroides*, анаэробные бактерии (например, *Bacteroides* spp., *Peptococcus* spp., *Peptostreptococcus* spp., *Eubacterium* spp., *Fusobacterium* spp., *Clostridium difficile*). Не действует на *Treponema pallidum*.

Фармакокинетика

Хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте (абсорбция - 95%). Пища может замедлять всасывание, но не оказывает существенного влияния на биодоступность. Биодоступность - 96%.

Время достижения максимальной концентрации (C_{max}) при пероральном приеме - 1-2 ч, C_{max} после приема в дозе 100 мг, 300 мг 600 мг составляет 1, 3, 4 и 6.9 мг/л и зависит от дозы: после однократного приема 200 мг и 400 мг она составляет 2.5 мкг/мл и 5 мкг/мл, соответственно.

Связь с белками плазмы - 25%. Кажущийся объем распределения - 100 л.

Распределение: 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 (ГЭБ), плацентарный барьер, секретируется с материнским молоком. Проникает в спинномозговую жидкость (СМЖ) при воспаленных и невоспаленных мозговых оболочках (14-60%).

Метаболизируется в печени (около 5%) с образованием метаболитов (N-оксид офлоксацин и диметилфлоксацин).

Период полувыведения ($T_{1/2}$) - 4.5-7 ч (независимо от дозы).

Выводится из организма преимущественно почками - 75-90% (в неизменном виде), около 4% - с фекалиями. Внепочечный клиренс - менее 20%. После однократного применения в дозе 200 мг в моче обнаруживается в течение 20-24 ч. При почечной или печеночной недостаточности выведение может замедляться. Не кумулирует.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

- инфекции ЛОР-органов (синусит, фарингит, средний отит, ларингит, трахеит);
- инфекции дыхательных путей (бронхит, пневмония);
- инфекционно-воспалительные заболевания брюшной полости и желчевыводящих путей (за исключением бактериального энтерита);
- инфекции почек (пиелонефрит), мочевыводящих путей (цистит, уретрит), органов малого таза (эндометрит, сальпингит, оофорит, цервицит, параметрит, простатит), половых органов (кольпит, орхит, эпидидимит), гонорея, хламидиоз;
- менингит; профилактика инфекций у больных с нарушением иммунного статуса (в т.ч. при нейтропении);
- инфекционно-воспалительные заболевания кожи, мягких тканей, костей, суставов.

Противопоказания

Гиперчувствительность к компонентам препарата, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, эпилепсия (в т.ч. в анамнезе), снижение судорожного порога (в т.ч. после черепномозговой травмы, инсульта или воспалительных процессов в центральной нервной системе); возраст до 18 лет (пока не завершён рост скелета), беременность, период лактации.

Применяют с осторожностью при атеросклерозе сосудов головного мозга, хронической почечной недостаточности, органических поражениях центральной нервной системы.

Способ применения и дозы

Дозы подбираются индивидуально в зависимости от локализации и тяжести течения инфекции, а также чувствительности микроорганизмов, общего состояния больного и функции печени и почек.

Назначают внутрь: взрослым - по 200-400 мг в сутки, курс лечения - 7-10 дней, кратность применения - 2 раза в день. Дозу до 400 мг в сутки можно назначать в 1 прием, предпочтительно утром. Суточная доза - 200-800 мг.

При гонорее назначают 400 мг однократно.

При нарушении функции печени максимальная суточная доза - 400 мг. При нарушении функции почек доза зависит от клиренса креатинина (КК): при КК 50-20 мл/мин - 200 мг/сут (в 2 приема или 1 раз в сутки); при КК менее 20 мл/мин - 200 мг каждые 48 ч.

При гемодиализе и перитонеальном диализе - по 100 мг каждые 24 ч.

Таблетки принимают целиком, запивая водой до или во время еды. Длительность курса лечения определяется чувствительностью возбудителя и клинической картиной; лечение следует продолжать еще минимум 3 дня после исчезновения симптомов заболевания и полной нормализации температуры. При лечении сальмонеллез курс лечения - 7-8 дней, при неосложненных инфекциях нижних мочевыводящих путей курс лечения - 3-5 дней.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, анорексия, тошнота, рвота, диарея, метеоризм, абдоминальные боли, повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, холестатическая желтуха, псевдомембранозный энтероколит.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, неуверенность движений, тремор, судороги, онемение и парестезии конечностей, интенсивные сновидения, "кошмарные" сновидения, психотические реакции, тревожность, состояние возбуждения, фобии, депрессия, спутанность сознания, галлюцинации, повышение внутричерепного давления.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: тендинит, миалгии, артралгии, тендосиновит, разрыв сухожилия.

Со стороны органов чувств: нарушение цветового видения, диплопия, нарушения вкуса, обоняния, слуха и равновесия.

Со стороны кожных покровов: точечные кровоизлияния (петехии), папулезная сыпь с коркой, свидетельствующие о поражении сосудов (васкулит).

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, агранулоцитоз, анемия, тромбоцитопения, панцитопения, гемолитическая и апластическая анемия.

Со стороны мочевыделительной системы: острый интерстициальный нефрит, нарушение функции почек, гиперкреатининемия, повышение содержания мочевины.

Аллергические реакции:

кожная сыпь, зуд, крапивница, аллергический пневмонит, аллергический нефрит, эозинофилия, лихорадка, отек Квинке, бронхоспазм, многоформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона) и Лайелла, фотосенсибилизация, полиформная эритема, васкулит, редко - анафилактический шок.

Прочие:

дисбактериоз кишечника, суперинфекция, гипогликемия (у больных сахарным диабетом), вагинит.

Передозировка

Симптомы: головокружение, спутанность сознания, заторможенность, дезориентация, сонливость, рвота.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Пищевые продукты, антациды, содержащие алюминий, кальций, магний или соли железа, снижают всасывание офлоксацина, образуя нерастворимые комплексы (интервал времени между назначением этих препаратов должен быть не менее 2 ч).

При одновременном применении офлоксацина с теофиллином, следует уменьшать дозу последнего (т.к. офлоксацин снижает клиренс теофиллина на 25%).

Циметидин, фуросемид, метотрексат и препараты, блокирующие канальцевую секрецию - повышают концентрацию офлоксацина в плазме крови.

При совместном применении с глибенкламидом необходимо контролировать уровень гликемии, т.к. офлоксацин увеличивает концентрацию глибенкламида в плазме крови.

При одновременном приеме с антагонистами витамина К необходимо осуществлять контроль свертывающей системы крови.

При назначении с НПВП, производными нитроимидазола и метилксантинов повышается риск развития нейротоксических эффектов.

При одновременном назначении с ГКС повышается риск разрыва сухожилий, особенно у пожилых людей.

При назначении с препаратами, ощелачивающими мочу (ингибиторы карбоангидразы, цитраты, натрия бикарбонат), увеличивается риск кристаллурии и нефротоксических эффектов.

Особые указания

Офлоксацин не является препаратом выбора при пневмонии, вызываемой пневмококками; не показан при лечении острого тонзиллита.

Не рекомендуется применять более 2 мес и подвергаться воздействию солнечных лучей, облучению УФ лучами (ртутно-кварцевые лампы, солярий).

В случае возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС, аллергических реакций, псевдомембранозного колита необходима отмена препарата. При псевдомембранозном колите, подтвержденном колоноскопически и/или гистологически, показано пероральное назначение ванкомицина и метронидазола.

При применении препарата женщинам не рекомендуется употреблять тампоны типа "Тампакс", в связи с повышенным риском развития молочницы.

Может приводить к ложноотрицательным результатам при бактериологической диагностике туберкулеза (препятствует выделению *Mycobacterium tuberculosis*).

У детей применяется только при угрозе жизни, с учетом предполагаемой пользы и потенциального риска развития побочных эффектов, когда невозможно применить др., менее токсичные препараты. Средняя суточная доза в этом случае - 7.5 мг/кг, максимальная - 15 мг/кг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой по 200 мг.

По 10 таблеток в блистере из ПВХ-алюминиевой фольги.

1 блистер с инструкцией по применению препарата в картонную коробку.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать позже даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

ЗАО «Макиз-Фарма»

109029, г.Москва Автомобильный проезд, д. 6