

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

ОФЛОКСИН

Регистрационный номер

Торговое название препарата: Офлоксин

Международное непатентованное название: офлоксацин

Химическое название: (+-)-9-Фтор-2,3-Дигидро-3-метил-10-(4-метил-1-пиперазинил)-7-оксо-7Н-пиридо[1,2,3,-de]-1,4-бензоксазин-6-карбоновая кислота.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой.

Состав

Активное вещество: офлоксацин - 400 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, повидон, кросповидон, полоксамер, магния стеарат, тальк; оболочка: гипромеллоза, макрогол, титана диоксид, тальк.

Описание

Белые или почти белые, двояковыпуклые, продолговатые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с риской для деления с обеих сторон и гравировкой "400" с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство, фторхинолон.

Код АТХ: [J01MA01].

Фармакологические свойства

Фармакодинамика:

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*, *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*, *Campilobacter 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:

Абсорбция после приема внутрь быстрая и полная (95%). Биодоступность - свыше 96%, связь с белками плазмы - 25%, время достижения максимальной концентрации (Т_{Стах}) при пероральном приеме - 1-2 ч, максимальная концентрация (С_{тах}) 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. Пища может замедлять всасывание, но не оказывает существенного влияния на биодоступность.

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

Метаболизируется в печени (около 5%) с образованием N-оксид офлоксацина и диметилофлоксацина. Период полувыведения - 4.5-7 ч (независимо от дозы). Выводится почками - 75-90% (в неизмененном виде), около 4% - с желчью. Внепочечный клиренс - менее 20%.

После однократного применения в дозе 200 мг в моче обнаруживается в течение 20-24 ч. При почечной/печеночной недостаточности выведение может замедляться. Не кумулирует. При гемодиализе удаляется 10-30% препарата.

Показания к применению

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

Противопоказания

Гиперчувствительность, 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); возраст до 18 лет (пока не завершено формирование скелета), беременность, период лактации.

С осторожностью - атеросклероз сосудов головного мозга, нарушения мозгового кровообращения (в анамнезе), хроническая почечная недостаточность, органические поражения центральной нервной системы.

Способ применения и дозы

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

Взрослым - по 200-800 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. При гонорее - 400 мг однократно.

У пациентов с нарушениями функции почек (при клиренсе креатинина 50-20 мл/мин) разовая доза должна составлять 50% от средней дозы при кратности назначения 2 раза в сутки, или полную разовую дозу вводят 1 раз в сутки. При клиренсе креатинина менее 20 мл/мин разовая доза - 200 мг, затем - по 100 мг в сутки через день.

При гемодиализе и перитонеальном диализе - по 100 мг каждые 24 ч. Максимальная суточная доза при печеночной недостаточности - 400 мг/сут.

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.

Побочные эффекты

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 цветовосприятия, диплопия, нарушения вкуса, обоняния, слуха и равновесия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение артериального давления, васкулит, коллапс.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, аллергический пневмонит, аллергический нефрит, эозинофилия, лихорадка, отек Квинке, бронхоспазм, синдром Стивенса-Джонсона и Лайелла, фотосенсибилизация, мультиформная эксудативная эритема, анафилактический шок.

Со стороны кожных покровов: точечные кровоизлияния (петехии), дерматит буллезный геморрагический, 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.

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

Передозировка

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

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия. При гемодиализе удаляется 10 - 30% препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Пищевые продукты, антациды, содержащие Al^{3+} , Ca^{2+} , Mg^{2+} или соли железа, снижают всасывание офлоксацина, образуя нерастворимые комплексы (интервал времени между назначением этих препаратов должен быть не менее 2 ч).

Снижает клиренс теофиллина на 25% (при одновременном применении следует уменьшать дозу теофиллина).

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

Увеличивает концентрацию глибенкламида в плазме.

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

При назначении с нестероидными противовоспалительными препаратами, производными нитроимидазола и метилксантинов повышается риск развития нейротоксических эффектов.

При одновременном назначении с глюкокортикостероидами 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

Не является препаратом выбора при пневмонии, вызываемой пневмококками. Не показан при лечении острого тонзиллита.

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

В случае возникновения побочных эффектов со стороны центральной нервной системы,

аллергических реакций, псевдомембранозного колита необходима отмена препарата. При псевдомембранозном колите, подтвержденном колоноскопически и/или гистологически, показано пероральное назначение ванкомицина и метронидазола.

Редко возникающий тендинит может приводить к разрыву сухожилий (преимущественно ахиллово сухожилие), особенно у пожилых пациентов. В случае возникновения признаков тендинита, необходимо немедленно прекратить лечение, произвести иммобилизацию ахиллова сухожилия и проконсультироваться у ортопеда.

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

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

На фоне лечения возможно ухудшение течения миастении, учащение приступов порфирии у предрасположенных больных.

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

У больных с нарушениями функции печени или почек необходим контроль концентрации офлоксацина в плазме. При тяжелой почечной и печеночной недостаточности повышается риск развития токсических эффектов (требуется коррекция дозы).

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

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой, по 400мг.

По 10 таблеток в блистер из фольги алюминиевой/ПВХ-пленки. Каждый блистер вместе с инструкцией по применению помещен в картонную пачку.

Условия хранения:

Список Б. В сухом месте, при температуре от 10°C до 25°C. Хранить в недоступных для детей местах.

Срок годности:

3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек: По рецепту.

Название и адрес производителя

"ЗЕНТИВА а.с", Чешская Республика.

У кабеловны 130, Долни Мехолупы Прага 10, 102 37.

Представительство в России: 119034, г.Москва, ул.Пречистенка, дом 40/2, стр.1