Офлоксацин Зентива



Код АТХ:

- J01MA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Офлоксацин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Раствор для инфузий прозрачный, со светлым желтовато-зеленоватым оттенком.

	1 мл	**1 фл.**
офлоксацин	2 мг	200 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид - 900 мг, хлористоводородная кислота концентрированная - 562.4 мг, динатрия эдетата дигидрат - 2 мг, вода д/и - до 100 мл.

100 мл - флаконы бесцветного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противомикробный препарат широкого спектра бактерицидного действия из группы фторхинолонов. Основным механизмом действия является специфическое ингибирование бактериального фермента ДНК-гиразы, обеспечивающего репликацию, транскрипцию, репарацию и рекомбинацию ДНК (дестабилизация цепей ДНК ведет к гибели микроорганизмов).

Высоко активен (МИК <0.5 мг/л) в отношении следующих микроорганизмов: Aeromonas hydrophila, Moraxella catarrhalis, Brucella spp., Chlamydia trachomatis, Citrobacter freundii, Clostridium perfringens, Enterobacter aerogenes, Enterobacter cloacae, Escherichia coli, Haemophilus ducreyi, Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae, Campylobacter coli, Campylobacter jejuni, Klebsiella oxytoca, Legionella pneumophila, Morganella morganii, Mycoplasma hominis, Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Plesiomonas spp., Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Salmonella enterica, Serratia marcescens, Shigella spp., Staphylococcus spp. (коагулазонегативный), в т.ч. Staphylococcus aureus

(метициллинчувствительный), Yersinia enterocolitica.

Умеренно чувствительны к офлоксацину Acinetobacter calcoaceticus, анаэробные грамположительные кокки, Bacteroides fragilis, Chlamydia psittaci, Gardnerella vaginalis, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium leprae, Pseudomonas aeruginosa, Streptococcus spp., в т.ч. Streptococcus pneumoniae.

Резистентные микроорганизмы (МИК >1 мг/л): Acinetobacter baumannii, Clostridium difficile, Enterococcus spp., Listeria monocytogenes, Staphylococcus aureus (метициллинрезистентные), Nocardia asteroides.

Не активен в отношении Treponema pallidum.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

C_{max} в сыворотке крови при 30-минутной в/в инфузии препарата достигается в конце инфузии. При курсовом применении офлоксацина концентрация в сыворотке существенно не увеличивается (коэффициент накопления при введении 2 раза/сут составляет 1.5).

Таблица 1. Концентрации офлоксацина в сыворотке крови после 30-минутной в/в инфузии препарата Офлоксацин Зентива

Доза	**Сывороточная концентрация офлоксацина после инфузии**	**Сывороточная концентрация офлоксацина через 4 ч после инфузии**	**Сывороточная концентрация офлоксацина через 12 ч после инфузии**
100 мг	2.9 мг/л	0.5 мг/л	0.2 мг/л
200 мг	5.2 мг/л	1.1 мг/л	0.3 мг/л

Связывание с белками плазмы составляет 20-25%. Офлоксацин хорошо проникает во многие жидкости и ткани организма, в т.ч. в слюну, бронхиальный секрет, желчь, слезную и спинномозговую жидкости, гной, в легкие, предстательную железу, кожу. Проникает через ГЭБ, плацентарный барьер, выделяется с материнским молоком.

Метаболизм и выведение

Офлоксацин подвергается частичному (5%) метаболизму в печени.

$T_{1/2}$ офлоксацина равен 6-7 ч. До 80% введенного препарата экскретируется почками в неизмененном виде, небольшая часть активного вещества выводится через ЖКТ.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

У пациентов с нарушением функции почек (КК 50 мл/мин и менее) $T_{1/2}$ офлоксацина увеличивается.

У пациентов пожилого возраста $T_{1/2}$ увеличивается, но C_{max} в сыворотке крови не изменяется.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к офлоксацину микроорганизмами:

— инфекции дыхательных путей, за исключением случаев установленной пневмококковой инфекции или подозрении на нее (некоторые штаммы пневмококка только частично чувствительны к офлоксацину, поэтому его не следует применять в качестве препарата первого выбора при внебольничной пневмонии, вызванной пневмококком);

— инфекции ЛОР-органов, за исключением острого тонзиллита, вызванного β-гемолитическим стрептококком (некоторые штаммы β-гемолитического стрептококка только частично чувствительны к офлоксацину, поэтому его не следует применять в качестве препарата первого выбора при остром тонзиллите, вызванном β-гемолитическим стрептококком);

— инфекции брюшной полости и желчевыводящих путей;

— инфекции почек и мочевыводящих путей;

— инфекции предстательной железы;

— гонококковый уретрит;

— инфекции костей и суставов;

— инфекции кожи и мягких тканей;

— инфекции женских половых органов;

— септицемия;

— профилактика инфекций, вызываемых чувствительными к офлоксацину микроорганизмами, у пациентов с предрасположенностью к развитию инфекций (например, при нейтропении).

Относится к болезням:

- Инфекции
- Пневмония
- Тонзиллит
- Уретрит

Противопоказания:

— эпилепсия (в т.ч. в анамнезе);

— поражение сухожилий при ранее проводившемся лечении фторхинолонами;

— возраст до 18 лет (т.к. не завершен рост скелета);

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к офлоксацину, другим хинолонам или вспомогательным компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам с атеросклерозом сосудов головного мозга, нарушениями мозгового кровообращения в анамнезе, органическими поражениями ЦНС, хронической почечной недостаточностью, печеночной недостаточностью, миастенией, печеночной порфирией, дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, сахарным диабетом, нарушениями электролитного состава крови (например, гипокалиемия, гипомагниемия), врожденным синдромом удлиненного интервала QT, заболеваниями сердечно-сосудистой системы (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия), психозами и другими психическими нарушениями в анамнезе; при снижении порога судорожной активности (после черепно-мозговой травмы, инсульта, воспалительных процессов в области ЦНС), пациентам пожилого возраста; при одновременном применении лекарственных средств, удлиняющих интервал QT (антиаритмические IA и III классов, трициклические и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики, антибиотики из группы макролидов, противогрибковые - производные имидазола, некоторые антигистаминные, в т.ч. астемизол, терфенадин, эбастин), препаратов для неингаляционной общей анестезии из группы барбитуратов, лекарственных средств, снижающих АД.

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен только для медленного инфузионного введения. В/в инфузия проводится 1 или 2 раза/сут.

Дозы подбирают индивидуально в зависимости от локализации и тяжести течения инфекции, а также от состояния функции почек.

Взрослым с нормальной функцией почек (КК более 50 мл/мин) при лечении инфекций, вызванных чувствительными к офлоксацину микроорганизмами, назначают 200 мг 2 раза/сут или 400 мг 1 раз/сут. Обычно суточная доза составляет 400 мг. При *лечении тяжелых инфекций* или у пациентов с избыточной массой тела суточная доза может быть увеличена до 600 мг.

При *инфекциях мочевыводящих путей* препарат назначают в дозе 100 мг 1-2 раза/сут.

При *инфекциях почек и половых органов* – 100-200 мг 2 раза/сут.

При *инфекциях дыхательных путей, а также ЛОР-органов, инфекциях кожи и мягких тканей, костей и суставов, инфекциях брюшной полости, бактериальном энтерите, септических инфекциях* – 200 мг 2 раза/сут. При необходимости дозу увеличивают до 400 мг 2 раза/сут.

Для *профилактики инфекций* у больных с выраженным снижением иммунитета назначают по 400-600 мг/сут.

Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания. Как всякое лечение противомикробными препаратами, лечение офлоксацином следует продолжать в течение минимум 48-72 ч после нормализации температуры тела или при наличии подтверждения эрадикации бактериального агента.

Через несколько дней после улучшения состояния пациента начатое лечение офлоксацином в виде в/в инфузий может быть продолжено путем применения препарата внутрь в тех же дозах.

При **нарушении функции почек** режим дозирования препарата зависит от КК.

При КК 50-20 мл/мин разовая доза в (мг)*

Клиренс креатинина (КК)	**Разовая доза (мг)***	**Кратность введения**
50-20 мл/мин	100-200	1 раз/сут (каждые 24 ч)
<20 мл/мин** или гемодиализ и перитонеальный диализ	100 или 200	1 раз/сут (каждые 24 ч) 1 раз в 2 суток (каждые 48 ч)

* В соответствии с показаниями.

** Рекомендуется мониторировать сывороточные концентрации офлоксацина у пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек или у пациентов, находящихся на диализе.

При **тяжелых нарушениях функции печени** (например, при циррозе печени с асцитом) не рекомендуется превышать дозу офлоксацина 400 мг/сут.

Возраст пациента, как таковой, не требует коррекции дозы офлоксацина. Однако при применении препарата у **пациентов пожилого возраста** особое внимание следует уделять функции почек, т.к. в случае ее снижения может потребоваться соответствующая коррекция режима дозирования.

Введение препарата

Продолжительность инфузии должна быть не менее 30 мин для каждой дозы раствора офлоксацина 200 мг. Это особенно важно, если офлоксацин вводится одновременно с другими лекарственными средствами, которые могут снижать АД или средствами для неингаляционной общей анестезии из группы барбитуратов.

Суточная доза до 400 мг офлоксацина может вводиться 1 раз/сут. В этом случае предпочтительно введение препарата утром. Суточную дозу свыше 400 мг следует делить на две части и вводить с 12-часовыми интервалами.

Введение препарата Офлоксацин Зентива после вскрытия флакона следует производить незамедлительно.

Побочное действие:

Указанные ниже побочные эффекты даются в соответствии со следующей градацией частоты их возникновения: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения), частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту встречаемости не представляется возможным).

Инфекционные и паразитарные заболевания: нечасто - грибковые инфекции, резистентность патогенных микроорганизмов.

Со стороны обмена веществ: очень редко (отдельные случаи) - гипогликемия у пациентов с сахарным диабетом, получающих лечение гипогликемическими средствами; приступы порфирии у пациентов с порфирией.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - анемия, гемолитическая анемия, лейкопения, тромбоцитопения; в отдельных случаях - агранулоцитоз, панцитопения, угнетение костномозгового кроветворения.

Психические нарушения: нечасто - ажитация, нарушения сна, бессонница; редко - психотические реакции (например, галлюцинации), беспокойство, тревожность, нервозность, спутанность сознания, ночные кошмары, депрессия; в отдельных случаях - психотические реакции и депрессия с причинением себе вреда, в редких случаях, вплоть до суицидальных мыслей или попыток.

Со стороны нервной системы: нечасто - головокружение, головная боль; редко - сонливость, парестезия, дисгевзия (расстройство восприятия вкуса), паросмия (расстройство восприятия запаха); очень редко - периферическая сенсорная невропатия, периферическая сенсорно-моторная невропатия, судороги, эпилептические припадки, экстрапирамидные расстройства, включая тремор, и другие нарушения мышечной координации; частота неизвестна - повышение внутричерепного давления.

Со стороны органа зрения: нечасто - раздражение слизистой оболочки глаз; редко - нарушения зрения.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - вертиго; очень редко - нарушения слуха (звон в ушах), потеря слуха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - флебит; нечасто - артериальная гипотензия (во время инфузии офлоксацина возможно снижение АД, сопровождающееся развитием синусовой тахикардии, которое в очень редких случаях является сильно выраженным вплоть до развития коллапса; в случае значительного снижения АД следует немедленно прекратить инфузию препарата); редко - синусовая тахикардия, "приливы" крови к коже лица; очень редко - удлинение интервала QT, желудочковая аритмия, в т.ч. желудочковая тахисистолическая аритмия типа "пируэт".

Со стороны дыхательной системы: нечасто - сухой кашель, назофарингит, ринит; редко - одышка, бронхоспазм; очень

редко (отдельные случаи) - аллергический пневмонит, выраженная одышка.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - боли в животе, диарея, тошнота, рвота; редко - анорексия, энтероколит (в отдельных случаях геморрагический), повышение активности печеночных ферментов, таких как АЛТ, АСТ, ЛДГ, ГГТ и/или ЩФ, и/или концентраций билирубина в крови; очень редко - холестатическая желтуха; в отдельных случаях - псевдомембранозный колит, гепатит, который может быть тяжелым; частота неизвестна - запор, метеоризм.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - повышение концентрации креатинина в сыворотке крови; очень редко - острая почечная недостаточность; в отдельных случаях - острый интерстициальный нефрит; частота неизвестна - повышение концентрации мочевины в крови.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - зуд, сыпь; редко - крапивница, гипергидроз, пустулезная сыпь; очень редко - реакции фотосенсибилизации, пурпура, васкулит, который в исключительных случаях может приводить к кожным некрозам; частота неизвестна - точечные кровоизлияния (петехии), буллезный геморрагический дерматит.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - тендинит; очень редко - артралгия, миалгия, разрыв сухожилия (в т.ч. ахиллова сухожилия; как при применении других фторхинолонов этот побочный эффект может развиваться в течение 48 ч после начала лечения и может быть двусторонним); в отдельных случаях - рабдомиолиз и/или миопатия, мышечная слабость, что особенно важно для пациентов с псевдопаралитической миастенией.

Аллергические реакции: редко - анафилактические реакции, анафилактоидные реакции, ангионевротический отек; очень редко - многоформная экссудативная эритема, токсический эпидермальный некролиз, лекарственная сыпь, анафилактический шок, анафилактоидный шок; в отдельных случаях - аллергический пневмонит, синдром Стивенса-Джонсона; частота неизвестна - аллергический нефрит, эозинофилия.

Местные реакции: часто - боль и покраснение в месте инфузии, флебит.

Прочие: частота неизвестна - дисбактериоз кишечника, вагинит, выделения из влагалища.

Передозировка:

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

Лечение: промывание желудка; проведение симптоматической терапии. Специфического антидота нет. Выведение препарата может быть ускорено при проведении форсированного диуреза. Около 15-25% препарата выводится при проведении гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препарат совместим со следующими инфузионными растворами: изотонический раствор натрия хлорида, раствор Рингера, 5% раствор фруктозы, 5% раствор декстрозы.

Раствор офлоксацина нельзя смешивать с гепарином (риск преципитации).

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

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, такие как пробенецид, циметидин, фуросемид, метотрексат повышают концентрацию офлоксацина в плазме.

Офлоксацин увеличивает концентрацию глибенкламида в плазме крови.

При одновременном применении с непрямыми антикоагулянтами (производными кумарина, включая варфарин) необходимо контролировать показатели свертывающей системы крови.

При применении с НПВС, производными нитроимидазола и метилксантинов, снижающими порог судорожной активности головного мозга, повышается риск развития нейротоксических эффектов, включая судороги.

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

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

Офлоксацин повышает концентрацию циклоспорина в сыворотке крови.

При одновременном применении с гипогликемическими средствами возможна как гипо-, так и гипергликемия, в связи с чем необходимо контролировать концентрацию глюкозы в плазме крови.

При одновременном применении офлоксацина с препаратами, способными снижать АД и/или лекарственными средствами для неингаляционной общей анестезии из группы барбитуратов возможно резкое и значительное снижение АД, поэтому требуется особенно тщательный мониторинг показателей функционального состояния сердечно-сосудистой системы.

При одновременном применении с препаратами, удлиняющими интервал QT (антиаритмические препараты IA и III классов, трициклические и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики, антибиотики из группы макролидов, противогрибковые препараты - производные имидазола, некоторые антигистаминные препараты, в т.ч. астемизол, терфенадин, эбастин) возможно возникновение пароксизмальной желудочковой тахикардии типа "пируэт".

Особые указания и меры предосторожности:

Офлоксацин Зентива не является препаратом выбора при пневмонии, вызываемой пневмококками.

Препарат не показан для лечения острого тонзиллита.

Не рекомендуется применять препарат Офлоксацин Зентива больше 2 мес.

Во время лечения препаратом следует избегать воздействия солнечных лучей или облучения УФ-лучами (ртутно-кварцевые лампы, солярий).

Как и другие хинолоны, офлоксацин следует с осторожностью применять у пациентов, предрасположенных к развитию судорог (пациенты с поражениями ЦНС в анамнезе; пациенты, принимающие фенбуфен или другие НПВС, снижающие порог судорожной готовности головного мозга, такие как теофиллин).

Пациентам пожилого возраста с нарушениями со стороны ЦНС (например, с эпилепсией, резко выраженным атеросклерозом сосудов головного мозга) следует принимать фторхинолоны только под тщательным наблюдением врача.

В случае возникновения побочных эффектов со стороны ЦНС и/или аллергических реакций препарат необходимо отменить.

У пациентов, получавших фторхинолоны, включая офлоксацин, сообщалось о развитии сенсорной и сенсорно-моторной невропатии, которая может иметь быстрое начало. Если у пациентов появляются симптомы невропатии, лечение офлоксацином следует прекратить (это сведет к минимуму возможный риск развития необратимых состояний).

У пациентов, принимавших фторхинолоны, в очень редких случаях наблюдалось увеличение продолжительности интервала QT. Следует соблюдать осторожность при приеме фторхинолонов, включая офлоксацин, у пациентов с факторами риска удлинения интервала QT, такими как: пожилой возраст, нарушение электролитного баланса (например, гипокалиемия или гипомагниемия), врожденный синдром удлиненного интервала QT, заболевания сердечно-сосудистой системы (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия), одновременное применение препаратов, удлиняющих интервал QT (антиаритмические препараты IA и III классов, трициклические антидепрессанты, антибиотики из группы макролидов).

На фоне лечения возможно ухудшение течения миастении у предрасположенных пациентов.

На фоне лечения препаратом возможно учащение приступов порфирии у предрасположенных пациентов.

Во время лечения офлоксацином возможно появление ложноположительных результатов при определении опиатов и порфиринов в моче.

При псевдомембранозном колите, подтвержденном колоноскопически и/или гистологически, прием препарата следует прекратить немедленно. Показано пероральное назначение ванкомицина и метронидазола.

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

Для профилактики гиперконцентрации мочи и последующей кристаллурии во время лечения рекомендуется проводить адекватную гидратацию.

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 направить пациента к ортопеду.

В период лечения нельзя употреблять алкоголь.

Применение офлоксацина может приводить к ложноотрицательным результатам при бактериологической диагностике туберкулеза (препятствует выделению Mycobacterium tuberculosis).

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения препаратом Офлоксацин Зентива, раствор для инфузий, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 10° до 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ofloksacin_Zentiva