

ИНСТРУКЦИЯ**ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА****Тимилокс®****Регистрационный номер:****Торговое наименование:** Тимилокс®**Международное непатентованное наименование:** моксифлоксацин**Лекарственная форма:** капли глазные**Состав препарата на 1 мл:***Действующее вещество:*

Моксифлоксацина гидрохлорид 5,45 мг

в пересчете на моксифлоксацин 5,0 мг

Вспомогательные вещества:

Натрия хлорид 7,0 мг

Борная кислота 3,0 мг

Раствор натрия гидроксида 10 М до pH 6,3 – 7,5

или раствор хлористоводородной кислоты 1 М

Вода для инъекций до 1 мл

Описание

Прозрачный или слегка опалесцирующий раствор зеленовато-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Противомикробное средство – фторхинолон.

Код АТХ: S01AE07**Фармакологические свойства****Фармакодинамика**

Моксифлоксацин – фторхинолоновый антибактериальный препарат IV поколения, обладает бактерицидным действием. Проявляет активность в отношении широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, анаэробных, кислотоустойчивых и атипичных бактерий.

Механизм действия связан с ингибированием топоизомеразы II (ДНК-гиразы) и топоизомеразы IV. ДНК-гираза – фермент, участвующий в репликации, транскрипции и

репарации ДНК бактерий. Топоизомераза IV – фермент, участвующий в расщеплении хромосомальной ДНК во время деления бактериальной клетки.

Отсутствует перекрестная резистентность с макролидами, аминогликозидами и тетрациклинами.

Сообщалось о развитии перекрестной резистентности между применявшимся системно моксифлоксацином и другими фторхинолонами.

Моксифлоксацин активен в отношении большинства штаммов микроорганизмов (как *in vitro*, так и *in vivo*):

Грамположительные бактерии:

Corynebacterium spp., включая *Corynebacterium diphtheriae*;

Micrococcus luteus (включая штаммы, нечувствительные к эритромицину, гентамицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus aureus (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus epidermidis (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus haemolyticus (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus hominis (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus warneri (включая штаммы, нечувствительные к эритромицину);

Streptococcus mitis (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Streptococcus pneumoniae (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, гентамицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Streptococcus pyogenes viridans (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, тетрациклину и/или триметоприму).

Грамотрицательные бактерии:

Acinetobacter lwoffii; *Haemophilus influenzae* (включая штаммы, нечувствительные к ампициллину); *Haemophilus parainfluenzae*; *Klebsiella* spp.

Другие микроорганизмы:

Chlamydia trachomatis.

Моксифлоксацин действует *in vitro* против большинства нижеперечисленных микроорганизмов, но клиническое значение этих данных неизвестно:

Грамположительные бактерии:

Listeria monocytogenes; *Staphylococcus saprophyticus*; *Streptococcus agalactiae*; *Streptococcus mitis*; *Streptococcus pyogenes*; *Streptococcus группы C, G, F*.

Грамотрицательные бактерии:

Acinetobacter baumannii; *Acinetobacter calcoaceticus*; *Citrobacter freundii*; *Citrobacter koseri*; *Enterobacter aerogenes*; *Enterobacter cloacae*; *Escherichia coli*; *Klebsiella oxytoca*; *Klebsiella pneumoniae*; *Moraxella catarrhalis*; *Morganella morganii*; *Neisseria gonorrhoeae*; *Proteus mirabilis*; *Proteus vulgaris*; *Pseudomonas stutzeri*.

Анаэробные микроорганизмы:

Clostridium perfringens; *Fusobacterium spp.*; *Prevotella spp.*; *Propionibacterium acnes*.

Другие микроорганизмы:

Chlamydia pneumoniae; *Legionella pneumophila*; *Mycobacterium avium*; *Mycobacterium marinum*; *Mycoplasma pneumoniae*.

По эпидемиологическим данным Европейского комитета по определению чувствительности к противомикробным препаратам пороговые значения ингибирующей концентрации моксифлоксацина для различных микроорганизмов следующие:

Corynebacterium – нет данных;

Staphylococcus aureus – 0,25 мг/л;

Staphylococcus, coag-neg. – 0,25 мг/л;

Streptococcus pneumoniae – 0,5 мг/л;

Streptococcus pyogenes – 0,5 мг/л;

Streptococcus viridans group – 0,5 мг/л;

Enterobacter spp. – 0,25 мг/л;

Haemophilus influenzae – 0,125 мг/л;

Klebsiella spp. – 0,25 мг/л;

Moraxella catarrhalis – 0,25 мг/л;

Morganella morganii – 0,25 мг/л;

Neisseria gonorrhoeae – 0,032 мг/л;

Pseudomonas aeruginosa – 4 мг/л;

Serratia marcescens – 1 мг/л.

Фармакокинетика

При местном применении происходит системное всасывание моксифлоксацина: максимальная концентрация моксифлоксацина в плазме крови (C_{max}) составляет 2,7 нг/мл, площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) – 45 нг·ч/мл.

Данные значения примерно в 1600 раз и в 1000 раз меньше, чем $C_{\max}$ и AUC после применения терапевтической дозы моксифлоксацина 400 мг внутрь. Период полувыведения ($T_{1/2}$) моксифлоксацина из плазмы составляет около 13 часов.

Показания к применению

Бактериальный конъюнктивит, вызванный чувствительными к моксифлоксацину микроорганизмами.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к моксифлоксацину, другим хинолонам и к любому из компонентов препарата.
- Детский возраст до 1 года.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Достаточного опыта по применению препарата во время беременности и в период грудного вскармливания нет. Применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания возможно в случае, когда ожидаемый лечебный эффект для матери превышает потенциальный риск для плода и ребенка.

Исследования на животных показали, что после перорального приема моксифлоксацина с грудным молоком экскретируются незначительные количества вещества. Тем не менее, при соблюдении терапевтических доз препарата не ожидается развитие нежелательных реакций у грудных детей.

Тератогенность

При доклинических исследованиях на животных моксифлоксацин не оказывал тератогенного действия в дозах 500 мг/кг/сутки (что примерно в 21,7 раз выше рекомендуемой суточной дозы для человека). Однако отмечалось некоторое снижение массы тела плода и задержка развития скелетно-мышечной системы. На фоне дозы 100 мг/кг/сутки отмечалось повышение частоты уменьшения роста новорожденных.

Способ применения и дозы

Местно, в конъюнктивальный мешок.

Применение у взрослых (в том числе у пожилых пациентов старше 65 лет)

По 1 капле 3 раза в день в пораженный глаз. Улучшение состояния наступает через 5 дней проводимой терапии, но лечение следует продолжать на протяжении еще 2-3 дней. При отсутствии терапевтического эффекта через 5 дней терапии рекомендуется пересмотреть

диагноз и выбор лечебной тактики. Длительность курса терапии зависит от тяжести состояния пациента, клинических и бактериологических особенностей инфекционного процесса.

Применение в педиатрической популяции

Не требуется коррекция режима дозирования при применении у детей.

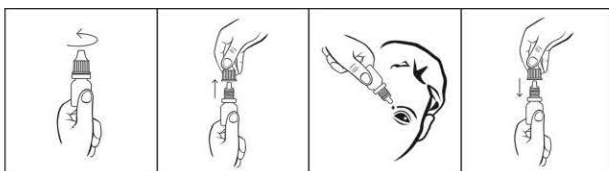
Печеночная и почечная недостаточность

Коррекция дозы не требуется.

В целях предотвращения абсорбции препарата через слизистую оболочку носа необходимо пальцем пережать носослезный канал на 2-3 минуты после инстилляций.

При применении нескольких препаратов для местного применения в офтальмологии интервал между их применением должен составлять не менее 5 минут, глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Порядок работы с флаконом:



1. Вращающими движениями против часовой стрелки открыть флакон и снять колпачок.
2. Осторожно, не касаясь пальцами наконечника флакона, перевернуть флакон, зафиксировать между большим и указательным пальцами одной руки.
3. Запрокинуть голову назад, расположить наконечник флакона над глазом и указательным пальцем другой руки оттянуть нижнее веко вниз. Слегка надавить на флакон и закапать необходимое количество препарата в конъюнктивальный мешок глаза.

Необходимо избегать контактов наконечника открытого флакона с поверхностью глаза и руками.

4. После использования надеть колпачок на флакон и закрыть вращающими движениями по часовой стрелке.

После вскрытия флакона препарат можно использовать в течение 1 месяца. По истечении этого срока препарат следует выбросить.

При видимых повреждениях флакона применять препарат не следует.

Побочное действие

Частота развития нежелательных реакций классифицирована в соответствии с рекомендациями Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 10\%$);

часто ($\geq 1\%$, $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$, $< 1\%$); редко ($\geq 0,01\%$, $< 0,1\%$); очень редко ($< 0,01\%$); частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко – снижение уровня гемоглобина.

Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна – гиперчувствительность.

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль; редко – парестезия; частота неизвестна – головокружение.

Нарушения со стороны органа зрения: часто – боль, раздражение в глазах; нечасто – точечный кератит, синдром сухого глаза, конъюнктивальное кровоизлияние, конъюнктивальная инъекция, зуд в глазах, отек век, ощущение дискомфорта в глазах; редко – дефекты эпителия роговицы, конъюнктивит, блефарит, отек конъюнктивы век и глазного яблока, затуманивание зрения, снижение остроты зрения, астигматизм, эритема век; частота неизвестна – эндофтальмит, язвенный кератит, эрозия роговицы, повышение внутриглазного давления, помутнение роговицы, инфильтраты роговицы, отложения роговицы, аллергические реакции глаз, кератит, отек роговицы, светобоязнь, слезотечение, выделения из глаз, ощущение инородного тела в глазах.

Нарушения со стороны сердца: частота неизвестна – ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – ощущение дискомфорта в носу, фаринголарингеальная боль, ощущение инородного тела в горле; частота неизвестна – диспноэ.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто – дисгевзия; редко – рвота; частота неизвестна – тошнота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: редко – повышение уровня аланинаминотрансферазы и гамма-глутамилтрансферазы.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: частота неизвестна – эритема, сыпь, зуд, крапивница.

Передозировка

Общее содержание моксифлоксацина в препарате слишком мало для развития нежелательных явлений при случайном проглатывании содержимого флакона.

При закапывании избыточного количества препарата необходимо промыть конъюнктивальную полость теплой водой.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Специальных исследований взаимодействия местно назначаемого моксифлоксацина с другими лекарственными средствами не проводилось. В связи с низкой системной концентрацией после местного применения в виде инстилляций взаимодействие с другими лекарственными средствами маловероятно.

Особые указания

Только для офтальмологического применения. Не для инъекций. Препарат предназначен только для местного применения в виде инстилляций. Не допускается введение препарата субконъюнктивально или непосредственно в переднюю камеру глаза.

Были получены сообщения о развитии серьезных и, в некоторых случаях, смертельных реакций гиперчувствительности (анафилактических реакций) у пациентов, систематически принимавших хинолоны; у некоторых пациентов развитие реакции наблюдалось уже после введения первой дозы. Некоторые реакции сопровождались сердечно-сосудистой недостаточностью, потерей сознания, отеком Квинке (включая отек гортани, глотки или лица), обструкцией дыхательных путей, диспноэ, крапивницей и зудом.

При развитии аллергической реакции следует прекратить применение препарата. В случае серьезных острых реакций гиперчувствительности может потребоваться немедленное проведение реанимационных мероприятий. Приборы для возобновления поступления кислорода и восстановления проходимости дыхательных путей применяются только по клиническим показаниям.

Длительное применение антибиотика может приводить к избыточному росту невосприимчивых микроорганизмов, в том числе грибов. В случае возникновения суперинфекции необходимо прекратить применение препарата и назначить адекватную терапию.

Системное применение фторхинолонов, включая моксифлоксацин, может привести к воспалению и разрыву сухожилий, особенно у пациентов пожилого возраста и пациентов, одновременно принимающих кортикостероиды. Таким образом, при появлении первых симптомов воспаления сухожилий следует прекратить прием препарата.

Данные по эффективности и безопасности препарата для лечения конъюнктивитов у новорожденных ограничены. Поэтому не рекомендуется использование препарата для лечения конъюнктивитов у новорожденных.

Препарат не рекомендуется применять для профилактики или эмпирической терапии гонококковых конъюнктивитов, в том числе гонококковой офтальмии новорожденных, из-за фторхинолоновой резистентности гонококков *Neisseria gonorrhoeae*. Пациенты с глазными инфекциями, вызванными гонококками *Neisseria gonorrhoeae*, должны получать соответствующее системное лечение.

Моксифлоксацин не рекомендуется применять для лечения глазных инфекций, вызванных *Chlamydia trachomatis*, у пациентов в возрасте младше 2 лет, так как соответствующие исследования не проводились. Пациенты в возрасте старше 2 лет с глазными инфекциями, вызванными *Chlamydia trachomatis*, должны получать соответствующее системное лечение.

Новорожденные с офтальмией новорожденных должны получать соответствующее лечение исходя из их состояния, например, системное лечение в случаях, вызванных гонококками *Chlamydia trachomatis* или *Neisseria gonorrhoeae*.

Пациентам не рекомендуется носить контактные линзы, если у них есть признаки инфекционных заболеваний глазного яблока.

При использовании препарата следует избегать соприкосновения наконечника флакона с какой-либо поверхностью во избежание микробного загрязнения флакона и его содержимого.

В случае одновременного применения других офтальмологических препаратов необходимо соблюдать интервал между инстилляцией не менее 5 минут; глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Применение любых глазных капель может вызвать временную нечеткость или другие нарушения зрения. Не следует управлять транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, до исчезновения симптомов снижения остроты зрения.

Форма выпуска

Капли глазные 0,5 %.

По 5 мл во флакон с капельницей из полиэтилена низкой плотности и крышкой с контролем первого вскрытия, или во флакон-капельницу из полиэтилена высокого давления в комплекте с крышкой навинчиваемой и пробкой-капельницей, или во флакон из полиэтилена низкой плотности в комплекте с пробкой-капельницей и крышкой с

контролем первого вскрытия, или во флакон из полиэтилентерефталата с капельницей пластиковой и крышкой с контролем первого вскрытия.

По 1 флакону в пакете из фольгированной пленки или без него.

По 1 флакону или по 1 пакету из фольгированной пленки вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. После вскрытия флакона – 1 месяц.

Не применять после окончания срока годности!

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

Производитель/Организация, принимающая претензии

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

www.solopharm.com

www.timilox.ru