ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)
по медицинскому применению препарата

ЗОФЛОКС

Регистрационный номер

Торговое название препарата: Зофлокс

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 – 200 или 400 мг. Вспомогательные вещества: лактоза, гидроксипропилцеллюлоза, крахмал, натрия карбоксиметилцеллюлоза, магния стеарат; оболочка: пленочное покрытие OPADRY (Y-1-7000).

Описание: таблетки белого цвета, в форме капсул (продолговатые), на изломе однородной консистенции белого цвета, с поперечной риской.

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 pneumonia), 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, Serratio marcescens, Pseudomonas aeruginosa, Acinetobacter, Mycoplasma hominis и pneumoniae, Mycobacterium tuberculosis, а также Mycobacterium fortuim, 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 (TCmax) при пероральном приеме – 1-2 ч, максимальная концентрация (Cmax) 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 спиномозговую 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 черепномозговой травмы, инсульта или воспалительных процессов в центральной нервной системе); возраст до 18 лет (пока не завершен рост 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 сальмонеллезов 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 Al3+, Ca2+, Mg2+ 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 препартами, 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 200 и 400 мг.

1 блистер содержит 10 таблеток по 200 мг.

1 блистер содержит 5 таблеток по 400 мг.

По 1 блистеру в картонную коробку с инструкцией по применению.

Условия хранения

Список Б. При температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Изготовитель:

«Мустафа Невзат Илач Санаи А.Ш.», Турция.

№5/1 34349, Гейреттепе, Стамбул, Турция. Телефон/факс: +902122757956.

Директор ИДКЭЛС, профессор В.В.Чельцов

Представитель фирмы: