ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ФЛОКСУРОЛ

Торговое название препарата: Флоксурол
Действующее вещество (МНН): офлоксацин
Лекарственная форма: раствор для инфузий
Состав:
активное вещество: офлоксацина - 2 г.
вспомогательные вещества: натрия хлорида – 9,0 г; 5М хлористоводородной кислоты до pH 4,0-7,0; воды для инъекций - до 1000 мл.
Описание : прозрачная жидкость желтого цвета
Фармакотерапевтическая группа: Антибактериальные синтетические средства (группа фторхинолонов).
Код АТХ: J01MA01

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Противомикробный препарат широкого спектра бактерицидного действия из группы фторхинолонов. Действует на фермент ДНК-гиразу, обеспечивающий сверхспирализацию и, таким образом, стабильность ДНК бактерий (дестабилизация цепей ДНК ведёт к гибели микроорганизмов).
Активен в отношении микроорганизмов, продуцирующих β-лактамазы, и быстрорастущих атипичных микобактерий.
Микроорганизмы чувствительные к офлоксацину:
Citrobacter spp., Enterobacter spp., Escherichia coli, Klebsiella spp.(включая Klebsiella pneumoniae), Proteus spp. (включая Proteus mirabilis, Proteus vulgaris), Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis, Staphylococcus spp. (коагулазонегативный), Staphylococcus aureus (метициллинчувствительный), Staphylococcus epidermidis, Salmonella spp., Shigella spp. (включая Shigella sonnei), Yersinia enterocolitica, Campylobacter jejuni, Aeromonas hydrophila, Pseudomonas aeruginosa, Vibrio cholerae, Vibrio parahaemolyticus, Haemophilus influenzae, Chlamydia spp., Legionella spp., Serratia spp., Providencia spp., Bordetella parapertussis, Bordetella pertussis, Brucella spp., Moraxella catarrhalis, Haemophilus ducreyi,, Hafnia spp., Propionibacterium acnes, Edwardsiella tarda.
Различной чувствительностью к препарату обладают:
Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans, Enterococcus faecalis, Serratia marcescens, Acinetobacter, Clostridium perfringens, Mycoplasma hominis, Mycoplasma pneumoniae, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium fortuitum, Ureaplasma urealyticum, Corynebacterium spp., Helicobacter pylori, Gardnerella vaginalis, Listeria monocytogenes.
Микроорганизмы резистентные к офлоксацину: Nocardia asteroides, анаэробные бактерии (Bacteroides spp.,Clostridium difficile, Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Eubacterium spp., Fusobacterium spp.), Staphylococcus aureus (метициллинрезистентный).
Неактивен в отношении Treponema pallidum.
Фармакокинетика
Распределение:
После разовой инфузии 200 мг офлоксацина в течение 60 минут максимальная концентрация в крови (C_{max}) составляет 2,7 мкг/мл, через 12 часов после введения концентрация офлоксацина составляет 0,3 мкг/мл.
Равновесные концентрации достигаются после введения 4 доз. При внутривенном (в/в) введении офлоксацина в дозе 200 мг каждые 12 часов в течение 7 дней средние

максимальные и минимальные равновесные концентрации составляют 2,9 и 0,5 мкг/мл соответственно.

Объем распределения равен 120 л. Офлоксацин широко проникает во многие ткани и жидкие среды организма: слюну, бронхиальный секрет, желчь, слезную и спинномозговую жидкость, гной, в лёгкие, мягкие ткани, кости, суставы, органы брюшной полости и малого таза, предстательную железу и кожу, в клетки (лейкоциты, альвеолярные макрофаги). Хорошо проходит через ГЭБ, проникает в спинномозговую жидкость (14-60%) при воспаленных и невоспаленных мозговых оболочках, достигая терапевтических концентраций. Проникает через гематоплацентарный барьер в высоких концентрациях, экскретируется с материнским молоком.

Связывание с белками плазмы крови составляет 20-25%.

Метаболизм и выведение:

Офлоксацин частично метаболизируется в печени (около 5%) с образованием двух основных метаболитов: N-оксид офлоксацина и диметилофлоксацина. Время полувыведения равен 5-8 часам. До 75-90% дозы выводится почками в неизмененном виде (через 24-48 ч), менее 5% - в виде метаболитов; с желчью - до 4-8%. Почечный клиренс препарата составляет 173 мл/мин, общий 214 мл/мин. Не кумулирует. Офлоксацин оказывает постантибиотическое действие.

Фармакокинетика в особых клинических случаях:

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) 50 мл/мин и менее) *печеночной недостаточностью* период полувыведения офлоксацина увеличивается.

После в/в введения при почечной недостаточности в зависимости от степени тяжести возможно увеличение T1/2 до 15-60 ч. На фоне приема препарата внутрь при гемодиализе удаляется 15-25% препарата, T1/2 в течение сеанса гемодиализа составляет 8-12 ч.

При проведении перитонеального диализа T1/2 составляет около 22 ч.

У пациентов пожилого возраста период полувыведения увеличивается, но максимальная сывороточная концентрация не изменяется.

Показания к применению

- инфекции кожи и мягких тканей
- инфекции костей и суставов;
- инфекционно-воспалительные заболевания брюшной полости и желчевыводящих путей **(за исключением бактериального энтерита);**
- инфекции почек (пиелонефрит) и мочевыводящих путей (цистит, уретрит);
- инфекции ЛОР-органов (за исключением случаев острого тонзиллита, вызванного β-гемолитическим стрептококком);
- инфекции дыхательных путей (за исключением случаев установленной пневмококковой инфекции или при подозрении на нее) ;
- инфекции органов малого таза (эндометрит, сальпингит, оофорит, цервицит параметрит, простатит) и половых органов (кольпит, орхит, эпидидимит)
- гонорея;
- хламидиоз;
- септицемия;
- менингит;
- профилактика инфекций у пациентов с нарушением иммунного статуса (в т. ч. при нейтропении);

Способ применения и дозы

Препарат вводят в/в капельно (следует вводить медленно, продолжительность инфузии должна быть не менее 30 минут для каждой дозы раствора 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.
Введение препарата Флоксурол после вскрытия флакона следует производить незамедлительно. Внутривенная инфузия проводится один или два раза в сутки.
Доза зависит от тяжести и локализации и типа инфекции, состояния организма, возраста, веса и функции почек.
При лечении инфекций, вызванных чувствительными к офлоксацину микроорганизмами, рекомендуемая доза составляет 200 мг 2 раза в сутки или 400 мг 1 раз в сутки. Обычно суточная доза составляет 400 мг. В случае лечения тяжелых инфекций или у больных с избыточной массой тела суточная доза может быть увеличена до 600 мг. Для профилактики инфекций у больных с выраженным снижением иммунитета назначается по 400-600 мг в сутки.
Кратность приема. Суточная доза до 400 мг офлоксацина может вводиться 1 раз в сутки. В этом случае предпочтительно введение препарата утром. Суточную дозу свыше 400 мг следует делить на две части и вводить с 12-часовыми интервалами.
Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания. Как всякое лечение противомикробными препаратами, лечение офлоксацином должно продолжаться в течение минимум 48-72 часов после нормализации температуры тела или при наличии подтверждения эрадикации бактериального агента.
Через несколько дней после улучшения состояния больного начатое лечение офлоксацином в виде внутривенных инфузий может быть продолжено путем приема офлоксацина внутрь в тех же дозах.
Способ применения и дозы в особых клинических случаях
У пациентов с нарушениями функции почек (при КК от 50 до 20 мл/мин) разовая доза должна составлять 50% от средней рекомендуемой при кратности назначения 2 раза/сут. Можно вводить полную разовую дозу 1 раз/сут. При КК менее 20 мл/мин разовая начальная доза составляет 200 мг, затем препарат вводят по 100 мг/сут через день.
При перитонеальном диализе и гемодиализе препарат вводят по 100 мг каждые 24 часа.
Режим дозирования при нарушении функции печени. При печеночной недостаточности максимальная суточная доза составляет 400 мг.

Побочные действия
Аллергические реакции: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, аллергический пневмонит, аллергический нефрит, эозинофилия, лихорадка, ангионевротический отёк (отёк Квинке), бронхоспазм, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, фотосенсибилизация, анафилактический шок.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение артериального давления (при резком снижении АД введение прекращают), васкулит, коллапс.
Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, неуверенность движений, тремор, судороги, онемение и парестезии конечностей, интенсивные и кошмарные сновидения, психотические реакции, тревожность, психомоторное возбуждение, фобии, депрессия, спутанность сознания, галлюцинации, повышение внутричерепного давления.
Со стороны органов чувств: нарушение цветовосприятия, диплопия, нарушение вкуса, обоняния и равновесия.
Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, анорексия, тошнота, рвота, диарея, метеоризм, абдоминальные боли, повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия, холестатическая желтуха, псевдомембранозный энтероколит.
Со стороны мочевыделительной системы: острый интерстициальный нефрит, нарушение функции почек, гиперкреатининемия, повышение содержания мочевины.
Со стороны опорно-двигательной системы: тендинит, миалгии, артралгии, тендосиновит, разрыв сухожилия.

Со стороны кроветворной системы: лейкопения, агранулоцитоз, анемия, тромбоцитопения, панцитопения, гемолитическая и апластическая анемия.
Дерматологические реакции: точечные кровоизлияния, дерматит буллезный геморрагический, папулезная сыпь, свидетельствующая о поражении сосудов (васкулит).
Местные реакции: боль, покраснение в месте введения, тромбофлебит.
Прочие: слабость, дисбактериоз, суперинфекция, гипогликемия (у больных сахарным диабетом), вагинит.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к препарату или другим хинолонам;
- эпилепсия (в т. ч. в анамнезе);
- снижение судорожного порога (в т. ч. после черепно-мозговой травмы, инсульта или воспалительных процессов в ЦНС);
- беременность и лактация;
- детский и подростковый возраст до 18 лет;
- поражения сухожилий при приеме фторхинолонов в анамнезе;
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (риск гемолитической реакции при введении хинолонов).

С осторожностью:

- атеросклероз сосудов головного мозга;
- нарушения мозгового кровообращения (в т. ч. в анамнезе);
- органические поражения ЦНС;
- травмы головного мозга в анамнезе;
- у пациентов, одновременно получающих препараты, снижающие порог судорожной готовности головного мозга, такие как фенбуфен, теофиллин;
- печеночная недостаточность;
- печеночная порфирия;
- почечная недостаточность;
- миастения;
- у пациентов с сахарным диабетом, получающих пероральные гипогликемические средства (например, глибенкламнд) или инсулин (возрастает риск развития гипогликемии).
- у пациентов с известными факторами риска удлинения интервала QT: у пациентов пожилого возраста, у пациентов с нескорректированными электролитными нарушениями (с гипокалиемней, гипомагниемией); с синдромом врождённого удлинения интервала QT; с заболеваниями сердца (сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия); при одновременном приеме лекарственных средств, способных удлинять интервал QT;
- у пациентов с психозами и другими психическими нарушениями в анамнезе;
- При одновременном приеме препаратов, способных снижать артериальное давление, лекарственных средств для неингаляционной общей анестезии из группы барбитуратов (повышенный риск развития гипотонии).

Лекарственные взаимодействия

- Офлоксацин снижает клиренс теофиллина на 25% (при одновременном применении следует снизить дозу теофиллина).
- При одновременном применении циметидин, фуросемид, метотрексат , пробенецид и препараты, блокирующие канальцевую секрецию, повышают концентрацию офлоксацина в плазме.

- При одновременном применении офлоксацина с инсулином, глибенкламидом и другими пероральными гипогликемическими препаратами увеличивается риск развития гипогликемии, требуется более тщательный мониторинг концентрации глюкозы в крови.
- При одновременном приёме с непрямыми антикоагулянтами (варфарин) необходим тщательный мониторинг показателей свертываемости крови, в связи с возможным увеличением эффекта непрямых антикоагулянтов.

При совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами, производными нитроимидазола, метилксантинами повышается повышается риск развития нейротоксических эффектов, включая судороги.

- 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.
- 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".
- При одновременном применении офлоксацина с антигипертензивными средствами или лекарственными средствами для неингаляционной общей анестезии из группы барбитуратов возможно внезапное и значительное снижение артериального давления.
- При одновременном применении офлоксацина с бета-лактамными антибиотиками, аминогликозидами и метронидазолом отмечено аддитивное взаимодействие.
- При одновременном применении циклоспорина и офлоксацина отмечается повышение уровня концентрации циклоспорина в сыворотке.

Фармацевтическая совместимость

Раствор офлоксацина совместим со следующими инфузионными растворами: изотоническим раствором натрия хлорида, раствором Рингера, 5% раствором декстрозы (глюкозы), 5% раствором фруктозы.

Раствор гепарина нельзя смешивать с раствором офлоксацина (возможно образование преципитатов).

Особые указания

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

Офлоксацин не эффективен при лечении сифилиса.

Возможно возникновение ложноотрицательных результатов при бактериологической диагностике туберкулеза (к офлоксацину умеренно чувствительна Mycobacterium tuberculosis).

При определении в моче опиатов и порфиринов во время лечения офлоксацином возможен ложноположительный результат. Может возникнуть необходимость в подтверждении положительных результатов с помощью более специфических методов.

В период лечения пациентам следует воздерживаться от употребления алкоголя.

При быстром в/в введении возможно снижение АД.

Не рекомендуется применять более двух месяцев.

В связи с риском возникновения фотосенсибилизации, в период применения препарата нельзя подвергаться воздействию солнечных лучей, УФ-облучению (ртутно-кварцевые лампы, солярий).
Редко возникающий тендинит может привести к разрыву сухожилий (преимущественно ахиллово сухожилие), особенно у пожилых пациентов и у пациентов, одновременно принимающих глюкокортикостероиды. Этот нежелательный эффект может развиваться в течение 48 часов после начала лечения и быть билатеральным. В случае возникновения признаков тендинита, необходимо немедленно прекратить лечение, произвести иммобилизацию ахиллова сухожилия и проконсультироваться у ортопеда.
Во время применения препарата женщинам не рекомендуется употреблять влагалищные тампоны в связи с повышенным риском развития кандидоза (молочницы).
На фоне лечения возможно ухудшение течения миастении, учащение приступов порфирии у предрасположенных больных.
Как и другие хинолоны, офлоксацин следует с осторожностью применять у больных, предрасположенных к развитию судорог (больные с поражениями ЦНС в анамнезе, больные, принимающие фенбуфен или другие нестероидные противовоспалительные препараты, снижающие порог судорожной готовности головного мозга, а также другие препараты, снижающие порог судорожной готовности головного мозга, такие как теофиллин).
У пациентов, принимавших фторхинолоны, в очень редких случаях наблюдалось увеличение продолжительности интервала QT.
У перечисленных ниже групп пациентов с известными факторами риска увеличения продолжительности интервала QT, применение фторхинолонов, включая офлоксацин, должно проводиться с осторожностью (под контролем продолжительности интервала QT):
• пациенты пожилого возраста;
• пациенты с нескорректированными нарушениями электролитного состава крови, такими как гипокалиемия, гипомагниемия;
• синдром врожденного удлинения интервала QT;
• заболевания сердца (такие как сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, брадикардия);
• одновременный прием препаратов, способных удлинять интервал QT (антиаритмические препараты IA и III классов, трициклические антидепрессанты, макролиды, терфенадин).
Появление диареи, особенно в тяжелой форме, персистирующей и/или с примесью крови, во время или после лечения офлоксацином может быть проявлением псевдомембранозного колита. В этих случаях лечение офлоксацином должно быть прекращено, и незамедлительно должна быть назначена соответствующая специфическая антибактериальная терапия (ванкомицин , тейкопланин или метронидазол внутрь). В данной клинической ситуации противопоказаны препараты, подавляющие перистальтику кишечника.
У пациентов, получавших фторхинолоны, включая офлоксацин, сообщалось о развитии сенсорной и сенсорно-моторной нейропатии с быстрым началом. При возникновении симптомов нейропатии, лечение офлоксацином должно быть прекращено.
Применение при беременности и лактации
Флоксурол противопоказан к применению при беременности и в период лактации (нельзя полностью исключить риск поражения хрящевых точек роста костей у плода/ребенка).
Влияние на способность управлять автомобилем и сложными механизмами
Следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

Передозировка
Симптомы: головокружение, спутанность сознания, заторможенность, дезориентация, сонливость, судороги, тошнота, рвота, эрозивные поражения слизистой оболочки ЖКТ.
Лечение: симптоматическая терапия.

Форма выпуска
Раствор для инфузий 0,2% во флаконы по 100 мл и 250 мл.

Условия хранения
Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С.
Не замораживать!
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
2 года.
Не применять в случае помутнения раствора или выпадения в осадок
Не следует применять после истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек
По рецепту

Производитель:
СП ООО "Jurabek Laboratories"

Наименование и адрес организации принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан:
СП ООО "Jurabek Laboratories"
Республика Узбекистан, 100003, г. Ташкент, ул. Алмазар 165,
тел/факс: (99878) 150-03-03
Web: www.jurabek.uz