

## **Состав**

*діюча речовина:* левофлоксацин;

1 мл крапель очних містить левофлоксацину напівгідрат 5,12 мг еквівалентно 5 мг левофлоксацину;

1 тубик-крапельниця (0,3 мл) містить 1,5 мг левофлоксацину;

*допоміжні речовини:* натрію хлорид, кислота хлористоводнева, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

## **Лекарственная форма**

Капли глазные.

*Основные физико-химические свойства:* прозорний, от светло-желтого до зеленовато-желтого цвета раствор, практически свободный от видимых механических включений.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Средства, применяемые в офтальмологии. Противомикробные средства. Фторхинолоны. Левофлоксацин. Код АТХ S01A E05.

## **Фармакодинамика**

Левофлоксацин - L-изомер рацемического лекарственного вещества офлоксацина. Антибактериальное действие имеет преимущественно L-изомер офлоксацина.

### Механизм действия

Левофлоксацин - антибактериальное средство из группы фторхинолонов, подавляет активность бактериальных топоизомераз II типа- ДНК-гиразу и топоизомераз IV. Действие левофлоксацина у грамотрицательных бактерий направлена преимущественно на ДНК-гиразу, а у грамположительных бактерий - на топоизомеразу IV.

### Механизм возникновения резистентности

Существуют два основных механизма возникновения резистентности бактерий к левофлоксацину: снижение концентрации препарата внутри бактериальной клетки или изменения в наборе ферментов, против которых направлено действие

препарата. Такие изменения возникают вследствие мутаций в хромосомальных генах, кодирующих ДНК-гиразу (*gyrA* and *gyrB*) и топоизомеразу IV (*parC* и *parE*; *grlA* и *grlB* в *Staphylococcus aureus*). Причинами возникновения резистентности из-за снижения концентрации препарата внутри бактериальной клетки являются изменения Окунитесь внешней мембраны (*OmpF*), что уменьшает возможность проникновения фторхинолонов внутрь грам- бактерий, или насосы, способствуют оттоку веществ. Резистентность из-за оттока веществ описана в пневмококков (*PmrA*), стафилококков (*NorA*), анаэробных и грамотрицательных бактерий. Сообщается о резистентности к хинолонов через плазму крови (что определяется геном *qnr*) в *Klebsiella pneumoniae* и *E. coli*.

### Перекрестная резистентность

Возможно возникновение перекрестной резистентности между фторхинолонами. Единичная мутация не вызывает клинической резистентности, но множественные мутации обычно вызывают клиническую резистентность ко всем средствам класса фторхинолонов. Изменения Окунитесь внешней мембраны и системы оттока веществ могут иметь широкую специфичность к субстратов, могут быть направлены против нескольких классов противобактериальных средств и привести к возникновению множественной резистентности.

### Предельные значения

Контрольные точки минимальной подавляющей концентрации, отделяющие чувствительные организмы, и организмы с промежуточной чувствительностью от резистентных имеют следующие значения:

*Pseudomonas* spp., *Staphylococcus* spp., *Streptococcus* A, B, C, G:

чувствительны  $\leq 1$  мг / л, резистентные  $> 2$  мг / л;

*Streptococcus pneumoniae*: чувствительные  $\leq 2$  мг / л, резистентные  $> 2$  мг / л;

*Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*: чувствительные  $\leq 1$  мг / л, резистентные  $> 1$  мг / л.

Остальные патогенных микроорганизмов: чувствительные  $\leq 1$  мг / л, резистентные  $> 2$  мг / л.

### Спектром антибактериального действия

Распространенность приобретенной резистентности в отдельных микроорганизмах может варьировать в разных географических точках и во времени, поэтому желательно иметь местную информацию о резистентности, особенно при лечении тяжелых инфекций.

Таким образом, представленная информация предоставляет только приблизительные руководящие указания и рекомендации по возможной чувствительности или отсутствующей чувствительности микроорганизмов к левофлоксацину. Если распространенность резистентности на месте такова, что польза от применения лекарственного препарата против крайней мере некоторых видов инфекций является сомнительной, в случае необходимости следует обратиться за консультацией к специалисту.

В приведенной ниже таблице представлены только те виды бактерий, обычно вызывают внешние инфекционные заболевания глаз, такие как конъюнктивит.

Спектром антибактериального действия - категории чувствительности и характеристики резистентности согласно требованиям EUCAST.

Категория I: часто чувствительны виды	
Аэробные грамположительные микроорганизмы	
Staphylococcus aureus (MSSA)*	
Streptococcus pneumoniae	
Streptococcus pyogenes	
Viridans group streptococci	
Аэробные грамотрицательные микроорганизмы	
Escherichia coli	
Haemophilus influenzae	
Moraxella catarrhalis	
Pseudomonas aeruginosa	(Изоляты из общественных мест)

Другие микроорганизмы	
Chlamydia trachomatis	(При лечении пациентов с хламидийными конъюнктивитом следует одновременно проводить системное антимикробное лечение)
Категория II: виды, для которых приобретенная резистентность может создавать проблему	
Аэробные грамположительные микроорганизмы	
Staphylococcus aureus (MRSA)**	
Staphylococcus epidermidis	
Аэробные грамотрицательные микроорганизмы	
Pseudomonas aeruginosa	(Изоляты из больниц)

\* MSSA = штаммы Staphylococcus aureus (золотистый стафилококк), чувствительные к метициллину

\*\* MRSA = штаммы Staphylococcus aureus (золотистый стафилококк), резистентные к метициллину

Данные по резистентности, указанные в таблице, основаны на результатах многоцентрового наблюдательного исследования (офтальмологическое исследование) с распространенности резистентности среди изолятов бактерий, полученных от пациентов с глазными инфекциями в Германии, июнь - ноябрь 2004 года.

Микроорганизмы классифицировали как чувствительные к левофлоксацину на основании чувствительности, определенной *in vitro* и концентрации в плазме крови после системной терапии. При местном применении были достигнуты более высокие максимальные концентрации, чем в плазме крови. Однако неизвестно, может ли кинетика препарата после местного закапывания в глаза

изменить антибактериальное действие левофлоксацина, и каким образом.

## **Фармакокинетика**

*После применения левофлоксацин хорошо сохраняется в слезной пленке.*

Средние концентрации левофлоксацина в слезной пленке, измеренные через 4 и 6 часов после местного дозирования, составили 17 и 6,6 мкг / мл соответственно. Через 4 часа после введения дозы в пяти из шести исследуемых добровольцев концентрации составили 2 мкг / мл и выше в четырех из шести исследуемых добровольцев эта концентрация наблюдалась и через 6 часов после введения дозы.

Концентрацию левофлоксацина в плазме крови измеряли в 15 здоровых добровольцев в различные моменты времени в течение 15-дневного курса применения препарата. Средняя концентрация левофлоксацина в плазме крови через 1 час после применения дозы варьировалась от 0,86 нг / мл в 1-й день до 2,05 нг / мл на 15-й день. Самую высокую максимальную концентрацию левофлоксацина - 2,25 нг / мл - было зафиксировано на 4-й день после 2 дней приема каждые 2 часа (всего 8 доз в сутки).

Максимальные концентрации левофлоксацина росли от 0,94 нг / мл в 1-й день до 2,15 нг / мл на 15-й день, что в 1000 раз меньше, чем в известность концентрации после стандартных доз при приеме левофлоксацина внутрь.

Концентрация левофлоксацина в плазме крови после применения в пораженный глаз пока неизвестна.

## **Показания**

Местное лечение бактериальных наружных глазных инфекций у пациентов от 1 года, вызванных микроорганизмами, чувствительными к левофлоксацину.

## **Противопоказания**

Гиперчувствительность к активному веществу левофлоксацина, на другие хинолины или к любому другому компоненту препарата.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Не проводили специальных исследований по взаимодействию этого препарата с другими лекарствами.

Поскольку максимальные концентрации левофлоксацина в плазме крови после закапывания в глаза минимум в 1000 раз меньше тех, что наблюдались после стандартных пероральных доз, их взаимодействию, указанные для системного применения, вряд ли будут клинически значимыми при применении капель глазных Офтаквикс®.

*Пациенты детского возраста.*

Никаких исследований по взаимодействию лекарственных препаратов не проводили.

### **Особенности применения**

*репарат нельзя вводить под конъюнктиву. Раствор следует вводить непосредственно в переднюю камеру глаза.*

Как и в случае с другими противомикробными лекарственными средствами, длительное применение может привести в результате к чрезмерному размножению нечувствительных микроорганизмов, в том числе грибов. При ухудшении состояния пациента из-за инфекции или отсутствии клинического улучшения в течение соответствующего периода времени, следует прекратить применение препарата и начать альтернативный метод лечения.

По клиническим показаниям больного следует провести обследование с использованием увеличительных приборов, таких как, например, биомикроскопия с применением щелевой лампы и, в случае необходимости, покраска флуоресцеином.

*Контактные линзы.*

Пациентам с бактериальной внешней очной инфекцией не следует носить контактные линзы.

Применение системных фторхинолонов связывают с возникновением реакций гиперчувствительности, даже после применения однократной дозы. При появлении аллергической реакции на левофлоксацин применение препарата следует прекратить.

При системной терапии фторхинолонами, включая левофлоксацин, могут возникать воспаление и разрыв сухожилия, особенно у пациентов пожилого возраста, одновременно принимающих кортикостероиды. Поэтому необходимо проявлять осторожность и при первых признаках воспаления сухожилий следует прекратить применение препарата Офтаквикс®.

## **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Офтаквикс® оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортным средством и использовать различные механизмы. Если наблюдается любой временный влияние на зрение, пациенту необходимо подождать, пока зрение прояснится перед тем, как управлять автомобилем или использовать механизмы.

## **Применение в период беременности или кормления грудью**

### *Беременность.*

Нет достаточных данных о применении левофлоксацина беременным женщинам. Исследования на животных не свидетельствуют о прямой или косвенный вредное воздействие на репродуктивную функцию. Потенциальный риск для человека неизвестен. Капли глазные Офтаквикс®, 5 мг / мл, следует назначать в период беременности, только если ожидаемая польза для беременной превышает потенциальный риск для плода.

### *Кормление грудью*

Левофлоксацин проникает в грудное молоко. Однако предполагается никакого влияния на ребенка, находящегося на грудном вскармливании, при применении терапевтических доз препарата Офтаквикс®. Капли глазные Офтаквикс® следует применять в период кормления грудью, только если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для младенца.

### *Фертильность.*

Левофлоксацин не вызывал снижение фертильности у крыс при экспозициях, что значительно превышает максимальную экспозицию у человека после офтальмологического применения.

## **Способ применения и дозы**

### Дозировка

По 1-2 капли в пораженный глаз (глаза) каждые 2 часа до 8 раз в сутки в течение первых двух дней после пробуждения, а затем 4 раза в сутки с 3-го по 5-й день.

При одновременном применении различных местных глазных лекарственных средств интервал между закапываниями должен составлять не менее 15 минут.

Продолжительность лечения зависит от тяжести остроты расстройства и от клинического и бактериологического течения болезни. Обычно курс лечения составляет 5 дней.

*Применение у пациентов пожилого возраста.*

Нет необходимости корректировать дозу для пациентов пожилого возраста.

Содержимое тубика-капельницы достаточно для закапывания обоих глаз.

Капли глазные следует использовать сразу же после открытия тубик-капельницы.

Использованную тубик-капельницу и остатки медицинского препарата следует утилизировать согласно местным требованиям.

## **Дети**

Безопасность и эффективность лечения язвы роговицы и офтальмией новорожденных не установлены. Препарат не рекомендуется назначать детям в возрасте до 1 года.

Дозы препарата, применяемые взрослым и детям старше 1 года, подобные.

Особые предостережения и меры предосторожности при использовании одинаковые для взрослых и детей от 1 года.

Безопасность и эффективность применения препарата Офтаквикс® детям в возрасте от 1 года установлены.

Безопасность и эффективность применения препарата Офтаквикс® детям в возрасте до 1 года на сегодня не установлены. Нет соответствующих данных.

## **Передозировка**

Количество левофлоксацина во флаконе капель глазных для однократного применения слишком мала, чтобы вызвать токсические эффекты после случайного приема внутрь. Если необходимо, пациента следует клинически обследовать и принять поддерживающих мероприятий.

После местного передозировки глаза необходимо промыть чистой водой комнатной температуры.

*Пациенты детского возраста.*



Принятие мер в случае передозировки подобное у взрослых и детей в возрасте от 1 года.

## **Побочные реакции**

Примерно у 10% пациентов можно ожидать побочные реакции. Эти реакции обычно легкие или умеренные, являются временными и в основном ограничиваются участком глаза.

Ниже приведены побочные реакции, определенные как точно, вероятно или возможно связанные с лечением, о которых сообщалось в ходе клинических исследований и послерегистрационного применения глазных капель, содержащих левофлоксацин:

### *Со стороны иммунной системы*

Одиночные ( $\geq 1 / 10000$  до  $< 1/1000$ ): экстраокулярных глазные аллергические реакции, в том числе высыпания на коже.

Редкие ( $< 1/10000$ ): анафилаксия.

### *Со стороны нервной системы*

Редкие ( $\geq 1 / 1000$  до  $< 1/100$ ): головная боль.

### *Со стороны органа зрения*

Часто ( $\geq 1 / 100$  до  $< 1/10$ ): жжение в глазах, ослабление зрения и появление тяжелой слизи.

Редкие ( $\geq 1 / 1000$  до  $< 1/100$ ): матирование век, хемоз, папиллярная реакция конъюнктивы, блефарит с симптомами отека и эритемы век, дискомфорт в глазах, зуд в глазах, боль в глазах, конъюнктивит, инфекция конъюнктивы, гиперемия конъюнктивы, конъюнктивальные фолликулы, сухость глаз и фотофобия.

Отложения на роговице при клинических исследованиях не наблюдались.

### *Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения*

Редкие ( $\geq 1 / 1000$  до  $< 1/100$ ): ринит.

Редкие ( $< 1/10000$ ): отек гортани.

*Дополнительные побочные реакции, которые наблюдаются при системном применении действующего вещества (левофлоксацин) и могут потенциально возникающих при применении препарата Офтаквикс®.*

У пациентов, получавших системные фторхинолоны, сообщалось о разрывы сухожилий плеча, кисти руки, ахиллова и других сухожилий, которые требовали хирургического вмешательства или приводили к длительной потере трудоспособности. Постмаркетинговые исследования и опыт применения системных хинолонов показывали, что возможно увеличение риска разрывов у пациентов, получавших кортикостероиды, особенно у пациентов пожилого возраста и сухожилий под большой нагрузкой, включая ахиллово сухожилие.

*Пациенты детского возраста.*

Частоту, тип и тяжесть побочных реакций у детей можно ожидать подобными тем, которые возникают у взрослых.

### Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного препарата важно. Это позволяет постоянно контролировать соотношение польза / риск применения лекарственного средства. Врачей просят сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях.

### **Срок годности**

2 года.

После открытия пакета с тьюбик-капельницами:

- капли глазные следует использовать в течение 3 месяцев после вскрытия пакета;
- хранить тьюбик-капельницы в пакете для защиты от света;
- после однократного использования тьюбик-капельницу следует утилизировать вместе с остатком.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 ° в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 10 тьюбиков-капельниц в пакете из фольги в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Сантен АО, Финляндия / Santen Oy, Finland.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Келлопортинкату 1, Тампере, 33100, Финляндия / Kelloportinkatu 1, Tampere, 33100, Finland.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).