Состав

действующее вещество: левофлоксацин;

1 мл капель глазных 5 мг левофлоксацина в виде левофлоксацина полугидрата;

вспомогательные вещества: бензалкония хлорид, натрия хлорид, кислота соляная концентрированная, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Капли глазные.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, 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 является L-изомер рацемической лекарственного вещества офлоксацина. Антибактериальное действие имеет преимущественно L-изомер офлоксацина.

Механизм действия

Левофлоксацин - антибактериальное средство из группы фторхинолонов, подавляет активность бактериальных топоизомеразам II типа - ДНК-гиразу и топоизомеразам 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 поринов внешней мембраны и системы оттока веществ могут иметь широкую специфичность к субстратам, могут быть направлены против нескольких классов противобактериальных средств и привести к возникновению множественной резистентности.

Предельные значения.

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

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

чувствительны ≤ 1 мг/л, резистентные> 2 мг/л;

Streptococcus pneumoniae: чувствительные ≤ 2 мг/л, резистентные> 2 мг/л;

Haemophilus influenzae, Moraxella catarrhalis: чувствительные ≤ 1 мг/л, резистентные> 1 мг/л.

Остальные патогенных микроорганизмов: чувствительные ≤ 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, которые 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 наблюдательный исследования (офтальмологическое исследование) 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.

Дети

Фармакодинамические свойства одинаковы у взрослых и детей в возрасте от 1 года.

Фармакокинетика

После применения левофлоксацин хорошо сохраняется в слезной пленке.

Средние концентрации левофлоксацина в слезной пленке, измеренные через 4 и 6 часов после местного применения, составляли 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 у 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 концентрации, о которых сообщалось после применения стандартных пероральных доз левофлоксацина.

Концентрации левофлоксацина в плазме крови, которые были достигнуты после применения препарата в пораженный глаз, неизвестны.

Показания

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

Противопоказания

Гиперчувствительность к активному веществу левофлоксацина, повышенная чувствительность к другим хинолонов 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, то взаимодействия, характерные 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

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

Как и в случае применения других противоинфекционных лекарственных средств, длительное применение может привести в результате к чрезмерному размножению нечувствительных микроорганизмов, в том числе грибов. При

ухудшении состояния пациента из-за инфекции или при отсутствии клинического улучшения в течение соответствующего периода времени следует прекратить применение препарата и начать альтернативное лечение.

По клиническим показаниям больного следует провести обследование с использованием увеличительных приборов, таких как, например, биомикроскопия с применением щелевой лампы, а 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 любое временное влияние на зрение, пациенту необходимо подождать, пока зрение прояснится, прежде чем 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 косвенное 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 не 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, значительно превышающих максимальную экспозицию у человека после офтальмологического применения.

Способ применения и дозы

По 1-2 капли в пораженный (-ные) глаз (глаза) каждые 2 часа до 8 раз в сутки, сразу после пробуждения в течение первых 2 дней, 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.

Для предотвращения загрязнения кончика пипетки и раствора, кончик пипетки не должен контактировать с веками и участками вокруг глаза.

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

Безопасность и эффективность лечения язвы роговицы и офтальмией новорожденных не установлены.

Поскольку данные по безопасности и эффективности отсутствуют, Офтаквикс не рекомендуют применять у пациентов в возрасте до 1 года.

Применение у пациентов пожилого возраста.

Нет необходимости корректировать дозу для пациентов пожилого возраста.

Способ применения.

Офтальмологическое применение.

Дети

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

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 в тюбике-капельнице 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 для взрослых и детей 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 (≥1/10000 до <1/1000): экстраокулярных глазные аллергические реакции, в том числе высыпания на коже.

Редкие (<1/10000): анафилаксия.

Со стороны нервной системы

Редкие (≥1/1000 до <1/100): головная боль.

Со стороны органов зрения

Часто (≥1/100 до <1/10): жжение в глазах, ослабление зрения и появление тяжей слизи.

Редкие (≥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, конъюнктивы инфекция, гиперемия конъюнктивы, конъюнктивальные фолликулы, сухость глаз и фотофобия.

Отложения на роговице при клинических исследований не наблюдалось.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Не частые (≥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 про 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 кортикостроиды, особенно у пациентов пожилого возраста, 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 про подозреваемые побочные реакции

Сообщение про подозреваемые побочные реакции после регистрации лекарственного препарата важно. Это позволяет постоянно контролировать соотношение польза/риск применения лекарственного средства. Врачей просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции.

Срок годности

3 года.

Открытый флакон следует использовать в течение 1 месяца.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл во флаконе с капельницей. По 1 флакону в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Сантен АО.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Ниитихаанкату, 20 33720 Тампере, Финляндия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.