

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

OFLOXIN® 200

1. Търговско име на лекарствения продукт

OFLOXIN® 200

2. Количествен и качествен състав

Лекарствено вещество: Ofloxacin 200 mg във всяка филмирана таблетка

3. Лекарствена форма

Филмирани таблетки

Външен вид: бели до почти бели, кръгли, двойно-изпъкнали филмирани таблетки с делителна черта от едната страна и делителна черта и надпис „200” от другата.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Ofloxacin е показан при възрастни за лечение на умерени или тежки инфекции, предизвикани от чувствителни към него микроорганизми. Ofloxacin трябва да се прилага на базата на извършено микробиологично изследване и определяне на чувствителността на микроорганизмите.

Ofloxacin е показан при инфекции на долните дихателни пътища; инфекции на пикочната система; простатит; инфекции на костите, кожата и меките тъкани, включително начални инфекции; интраперитониални инфекции, включително холангит и инфекции на малкия таз, причинени от чувствителни микроорганизми, респираторни инфекции при муковисцидоза; инфекции, предавани по полов път, с изключение на сифилис; шигелоза, салмонелоза, диария при пътуване.

4.2. Дозировка и начин на приложение


Благодарение на високата бионаличност и добрите фармакокинетични параметри, пероралното приложение на ofloxacin е за предпочитане при всички болни, които могат да поглъщат лекарството.

Ofloxacin се прилага обикновено в продължение на 7 до 10 дни в зависимост от вида и тежестта на инфекцията.

Възрастни пациенти с нормална бъбречна функция

Единичната доза обикновено е 200 - 400 mg на всеки 12 часа

При лечение на *цистит* прилагането на ofloxacin в продължение на 3 дни може да е достатъчно.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 13041/18.05.06	
695/25.04.06	



Противоположно на това, лечението на *простатит* може да продължи до няколко седмици.

При лечение на *остра неусложнена гонорея* се предпочита единична доза от 400 mg.

Пациенти с увредена бъбречна функция

⇒ Креатининов клирънс над 50 ml/min - не е необходимо намаляване на дозата;

⇒ Креатининов клирънс от 20 до 50 ml/min – препоръчва се еднократна доза от 100 – 200 mg един път на 24 часа;

⇒ Креатининов клирънс под 20 ml/min - препоръчва се еднократна доза от 100 mg веднъж на 24 часа.

Пациенти с тежки чернодробни увреждания:

Дневната доза от 400 mg ofloxacin не трябва да се превишава.

Пациенти над 60 години:

При нормална бъбречна функция не е необходимо намаляване на дозировката.

Начин на употреба

Лекарственият продукт трябва да се приема 0.5 - 1 час преди хранене с малко количество течност. Антиацидните лекарствени продукти, както и такива, съдържащи магнезий, алуминий, желязо или цинк трябва да се приемат не по-малко от 2 часа преди или 2 часа след приема на ofloxacin.

4.3. Противопоказания

Ofloxacin не трябва да се прилага при:

- пациенти, свръхчувствителни към ofloxacin, други хинолони или към някое от помощните вещества;

- пациенти с епилепсия или намален церебрален праг на гърчове при нарушения в ЦНС, напр. след черепномозъчни травми, възпаления в областта на мозъка или гръбначния мозък или инсулт;

- деца и юноши до 18 години, тъй като въз основа на изследванията върху животни не може напълно да се изключи възможността за увреждане на хрущялната тъкан на растящия организъм;

- бременност;

- по време на кърмене;

- проява на тендинит.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

При пациенти с тежка нежелана лекарствена реакция към хинолони в анамнезата (напр. тендинит, тежка неврологична реакция) съществува повишен риск от подобна реакция към ofloxacin.

Прилагането на антибиотици, особено продължителната употреба, може да предизвика размножаване на резистентни микроорганизми. Поради това състоянието на пациента трябва да се контролира редовно. При поява на вторична инфекция трябва да се вземат необходимите мерки.



По време на лечението не се препоръчва употребата на алкохол.

Трябва да се избягва излагането на слънце или други източници на УВ лъчи по време на лечението с ofloxacin.

Лечението трябва да се прекъсне незабавно ако се появи тендинит.

Необходимо е внимание когато се прилага при пациенти с дефект в глюкозо-6-фосфатазата (поради риск от хемолиза) и миастения (флуорохинолоните могат да повлияят нервномускулната проводимост).

Влияние върху лабораторните тестове: По време на лечението с ofloxacin е възможно да се получат лъжливи положителни резултати за наличие на опиати или порфирины в урината. Възможно е също фалшиво да се позитивира тест за туберкулоза.

Пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Лапландска лактозна недостатъчност или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат този лекарствен продукт.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Антиациди, лекарствени продукти, съдържащи магнезий, алуминий, желязо или цинк, намаляват абсорбцията на ofloxacin. Други лекарствени продукти също могат да съдържат тези субстанции като буфери, напр. продуктите съдържащи диданозин.

Едновременното прилагане на ofloxacin и нестероидни антиревматични средства или други лекарствени продукти, понижаващи гърчовия праг (теофилин, трамадол, антидепресанти и други), може да увеличи риска от гърчове.

Едновременната употреба на ofloxacin и теофилин рядко може да доведе до понижаване на клирънса на теофилин, което като правило не е клинически значимо.

Ofloxacin усилва действието на кумариновите антикоагуланти. При едновременно прилагане с варфарин или негови производни трябва да се контролира протромбиновото време или да се провеждат други подходящи тестове.

Поради възможна хипер- или хипогликемия по време на лечение с ofloxacin, трябва последователно да се мониторират параметрите на тяхната компенсация при пациенти, третирани с антидиабетни лекарствени продукти.

При едновременно прилагане на високи дози хинолони и лекарствени продукти, които се излъчват чрез тубуларна секреция (напр. пробененид, циметидин, фуросемид или метотрексат), серумните нива могат да се повишат и елиминирането на хинолоните да се намали.

4.6. Бременност и кърмене

При експериментални животни са наблюдавани нарушения в развитието на хрущялната тъкан в потомството; този механизъм не е наблюдаван досега при човека.

Поради липса на опит, прилагането на ofloxacin при бременни и кърмачки е противопоказано.



4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

По време на лечението с ofloxacin реакциите се забавят и се повлиява вниманието при лица, извършващи дейности, които изискват повишено внимание, координация на движенията и бързо вземане на решение (напр. шофиране на моторни превозни средства, работа с машини, работа на високи места и др.).

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Въз основа на данните от клиничните изследвания нежелани лекарствени реакции могат да се очакват при около 7% от пациентите. Най-често те засягат стомашно-чревната система (около 5%) и нервната система (около 2%).

Следващата таблица представя нежеланите лекарствени реакции, докладвани във връзка с прилагането на лекарственото вещество ofloxacin, разделени съобразно честотата на тяхното появяване: много чести (>10%), чести (1-10%), нечести (0,1-1%), редки (0,01-0,1%), много редки (< 0,01%).

Стомашно-чревна система	<i>Чести:</i> повръщане, диария (може да е симптом на инфекциозен ентероколит*), гадене, абдоминална болка, стомашен дискомфорт; <i>Нечести:</i> констипация, загуба на апетит, вкусови нарушения; <i>Редки:</i> инфекциозен ентероколит, загуба на вкуса.
Черен дроб и жлъчни пътища	<i>Редки:</i> повишаване на стойностите на чернодробните ензими (AST, ALT, ALP), повишаване на билирубина; <i>Много редки:</i> холестатична жълтеница, хепатит.
Нервна система	<i>Чести:</i> главоболие, виене на свят, нарушения на съня, безпокойство; <i>Редки:</i> сънливост, тремор (причинен от нарушения в мускулната координация).
Психика	<i>Редки:</i> халюцинации, обърканост.
Слух	<i>Много редки:</i> слухови нарушения, загуба на слуха.
Зрение	<i>Редки:</i> зрителни нарушения (напр. двойно виждане, далтонизъм).
Сърдечно-съдова система	<i>Редки:</i> синкоп (дължащ се на понижаване на кръвното налягане), тахикардия.
Кръв и лимфатична система	<i>Редки:</i> лимфоцитоза, тромбоцитоза, удължаване на протромбиновото време; <i>Много редки:</i> анемия, левкопения (вкл. агранулоцитоза), тромбоцитопения, панцитопения.
Бъбреци и пикочни пътища	<i>Нечести:</i> задържане на урина; <i>Редки:</i> нарушения на бъбречните функции; <i>Много редки:</i> остър интерстициален нефрит, повишаване на серумния креатинин.
Кожа и подкожни тъкани	<i>Чести:</i> кожни обриви, пруритус; <i>Редки:</i> обриви, дължащи се на повишена чувствителност към светлина, erythema multiforme, синдром на Stevens-Johnson, синдром на Lyell, васкулит, други сериозни кожни реакции.



Имунна система	<i>Редки:</i> васкулит, реакции на свръхчувствителност (обикновено с кожни прояви), анафилаксия.
Дихателна система, гръден кош и медиастиnum	<i>Редки:</i> нарушения на обонянието; <i>Много редки:</i> пневмония, загуба на обонянието.
Метаболизъм и хранене	<i>Много редки:</i> понижаване/повишаване на кръвната захар, повишаване на серумния холестерол, повишаване на серумните триглицериди
Двигателна система и съединителна тъкан	<i>Много редки:</i> миалгия и артралгия, руптура на сухожилията, болки в сухожилията, тендинит.

* При лечение с антибиотик е възможно да се появи псевдомембранозен ентероколит (в повечето случаи причинен от *Clostridium difficile*). Дори и в случай на съмнение за наличие на *Clostridium difficile* прилагането на офлохасин трябва незабавно да се прекрати. В тези случаи трябва да се избягват лекарствени продукти, потискащи перисталтиката.

При повечето случаи реакцията отшумява след прекратяване на лечението.

4.9. Предозиране

Информацията относно предозирането е ограничена. В случай на предозиране се прилага стандартна процедура – необходимо е да се направи стомашна промивка и да се осигури съответната хидратация. Офлохасин само частично се елиминира от организма чрез хемодиализа или чрез перитонеална диализа.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група

Химиотерапевтик

АТС код: J01MA01

Механизъм на действие:

Офлохасин е синтетичен, флуориран хинолон с широк антибактериален спектър. Той проявява бактерицидно действие в концентрации, равни на минималната инхибираща концентрация (MIC) или малко по-високи (чрез инхибиране на ДНК-гиразата - ензим, необходим за дупликация и транскрипция на бактериалната ДНК).

Антимикробен спектър:

Грам-отрицателни и грам-положителни бактерии, чувствителни към офлохасин: *Enterobacteriaceae* (*Escherichia coli*, *Citrobacter*, *Enterobacter*, *Klebsiella*, *Proteus*, *Providencia*, *Salmonella*, *Serratia*, *Shigella*, *Yersinia* sp.), *Pseudomonas aeruginosa* и *Pseudomonas* species, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus* sp., *Branhamella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Acinetobacter* sp., *Stenotrophobacter*



sp., *Gardnerella vaginalis*, *Helicobacter pylori*, *Pasteurella multocida*, *Vibrio sp.*, *Brucella melitensis*; стафилококи, включително пеницилиназа продуциращи щамове и някои метицилин-резистентни щамове; *Corynebacterium sp.*, *Listeria monocytogenes*. Той също е активен спрямо *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Ureaplasma urealyticum* (в границата на MIC), *Mycobacterium tuberculosis*, *Mycobacterium leprae* и някои други микобактерии.

Той е неефективен по отношение на целия род стрептококи.

Повечето анаеробни микроорганизми, с изключение на *Clostridium perfringens*, са резистентни.

Ofloxacin не е ефективен срещу *Treponema pallidum*.

5.2. Фармакокинетични свойства

След перорално приложение ofloxacin бързо и лесно се абсорбира, като неговата бионаличност е 96-100%. След перорално приета доза от 400 mg, ofloxacin достига максимална плазмена концентрация от 3-4 µg/ml до 1-2 часа след приема. Той прониква добре в тъканите и се разпределя в телесните течности, включително в гръбначно-мозъчната течност; относително високи концентрации могат да бъдат открити в жлъчката. Обемът на разпределение варира между 1.5 - 2.5 l/kg и степента на свързване с плазмените протеини е 25%.

Ofloxacin се метаболизира ограничено до дезметил-офлоксацин и офлоксацин-N-оксид. Дезметил-офлоксацинът има умерена антимикробна активност.

Плазменият полуживот на ofloxacin е 5-8 часа. При случаи с бъбречна недостатъчност той може да се удължи, в зависимост от степента на бъбречната недостатъчност, до 15-60 часа. Ofloxacin се излъчва предимно чрез бъбреците посредством тубулна секреция и гломерулна филтрация; 75-80% от приложената доза се екскретира чрез урината в непроменен вид в продължение на 24-48 часа и по-малко от 5% се екскретира под формата на метаболити. 4-8% от приетата доза се екскретира чрез фекалиите. Елиминирането на ofloxacin може да се забави при болни с тежко чернодробно увреждане (напр. чернодробна цироза).

Бъбречният клирънс на ofloxacin е 173 ml/min, а общият клирънс е 214 ml/min, независимо от дозата. Само малка част може да бъде елиминирана чрез хемодиализа (15-25%), като биологичният полуживот по време на хемодиализа е около 8-12 часа. По време на перитонеална диализа биологичният полуживот е 22 часа.

Ofloxacin проявява постантибиотичен ефект.

Ofloxacin преминава през плацентата и се открива в кърмата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Канцерогенност: Не са провеждани продължителни проучвания с цел определяне канцерогенния потенциал на ofloxacin.

Мутагенност: Ofloxacin не е показал мутагенно действие при проведените тестове.

Тератогенност: След пероралното приложение на ofloxacin на мишки, плъхове и маймуни LD₅₀ съответно е 5,290 mg/kg; 3,590 mg/kg и 500 mg/kg.



Когато се прилага перорално в доза 810 mg/kg дневно на бременни плъхове и 160 mg/kg дневно на бременни зайци ofloxacin не проявява тератогенен ефект. При допълнителни проучвания, проведени върху женски плъхове, които са третирани с ofloxacin в дози до 360 mg/kg дневно, не са наблюдавани нежелани ефекти върху късното развитие на плода, процесите на раждане, кърмене, жизненост, растеж и развитие на младите животни. Дози, приложени на женски плъхове и зайци, съответно 50 и 10 пъти по-високи от максималната препоръчвана доза при хора, са фетотоксични (те водят до намаление на телесното тегло на плода и до повишена фетална смъртност). Малки отклонения в развитието на скелета са наблюдавани при плъхове, третирани с ofloxacin в доза 810 mg/kg дневно.

При прилагането на лекарствения продукт върху експериментални животни е наблюдавано нарушено развитие на хрущялната тъкан в потомството. Този механизъм досега не е потвърден при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Lactose monohydrate, maize starch, povidon, crospovidon, poloxamer, magnesium stearate, talc, hydroxypropylmethylcellulose, macrogol, titanium dioxide.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

3 години.

6.4. Специални условия на съхранение

Няма специални изисквания.

6.5. Данни за опаковката

Блистер от PVC/Al фолио и листовка за пациента в картонена кутия.

Съдържание на 1 опаковка:

10, 14 или 20 филмирани таблетки

6.6. Указания за употреба

Лекарственият продукт е предназначен за перорално приложение.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Zentiva a.s., Praha, Czech Republic



8. Регистрационен номер в регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ

9900390

**9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт
(подновяване на разрешението)**

16.12.1999 г.

Дата на последната редакция на текста

050711

