

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Моксифлоксацин-Оптик

Регистрационный номер: ЛП-004637

Торговое наименование: Моксифлоксацин-Оптик

Международное непатентованное наименование: моксифлоксацин

Лекарственная форма: капли глазные

Состав на 1 мл:

Действующее вещество:

| | |
|-------------------------------|-----------|
| Моксифлоксацина гидрохлорид | -5,45мг |
| в пересчете на моксифлоксацин | - 5,00 мг |

Вспомогательные вещества:

| | |
|----------------------------|-----------------|
| натрия хлорид | - 6,4 мг |
| кислота борная | - 3,0 мг |
| хлористоводородной кислоты | до pH 6,3 - 7,3 |
| раствор 1 М или натрия | |
| гидроксида раствор 1 М | |
| вода очищенная | до 1,0 мл |

Описание: прозрачный или слегка опалесцирующий раствор зеленовато-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство - фторхинолон.

Код АТХ: S01AE07.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Моксифлоксацин – фторхинолоновый антибактериальный препарат IV поколения, обладает бактерицидным действием. Проявляет активность в отношении широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, анаэробных, кислотоустойчивых и атипичных бактерий.

Механизм действия связан с ингибированием топоизомеразы II (ДНК-гиразы) и топоизомеразы IV. ДНК-гираза фермент, участвующий в репликации, транскрипции и репарации ДНК бактерий. Топоизомераза IV – фермент, участвующий в расщеплении хромосомальной ДНК во время деления бактериальной клетки.

Механизмы развития резистентности

Резистентность к антибиотикам фторхинолонового ряда, в том числе к моксифлоксацину, развивается путем хромосомных мутаций в генах, кодирующих ДНК-гиразу и топоизомеразу IV. У грамотрицательных бактерий резистентность к моксифлоксацину ассоциирована с мутациями в системе множественной резистентности к антибиотикам и системе резистентности к хинолонам. Развитие резистентности ассоциировано также с экспрессией эффлюксных белков и инактивирующих ферментов. Перекрестная резистентность с макролидами, аминогликозидами и тетрациклинами не ожидается в связи с различиями в механизме действия. Развитие резистентности может иметь значительные географические различия, а также значительно различаться в различные периоды времени, в связи с чем перед началом терапии необходимо получить сведения о резистентности микроорганизмов в конкретной местности, что имеет особое значение в лечении тяжелых инфекций.

Моксифлоксацин активен в отношении большинства штаммов микроорганизмов (как *in vitro*, так и *in vivo*):

Грамположительные бактерии:

Corynebacterium spp., включая *Corynebacterium diphtheriae*;

Micrococcus luteus (включая штаммы, нечувствительные к эритромицину, гентамицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus aureus (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus epidermidis (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus haemolyticus (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus hominis (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму);

Staphylococcus warneri (включая штаммы, нечувствительные к эритромицину);

Streptococcus mitis (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Streptococcus pneumoniae (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, гентамицину, тетрациклину и/или триметоприму);

Streptococcus группы viridans (включая штаммы, нечувствительные к пенициллину, эритромицину, тетрациклину и /или триметоприму).

Грамотрицательные бактерии:

Acinetobacter lwoffii; *Haemophilus influenzae* (включая штаммы, нечувствительные к ампицилину); *Haemophilus parainfluenzae*; *Klebsiella spp.*

Другие микроорганизмы:

Chlamydia trachomatis

Моксифлоксацин действует *in vitro* против большинства ниже перечисленных микроорганизмов, но клиническое значение этих данных неизвестно:

Грамположительные бактерии:

Listeria monocytogenes; *Staphylococcus saprophyticus*; *Streptococcus agalactiae*; *Streptococcus mitis*; *Streptococcus pyogenes*; *Streptococcus группы C, G, F*;

Грамотрицательные бактерии:

Acinetobacter baumannii; *Acinetobacter calcoaceticus*; *Citrobacter freundii*; *Citrobacter koseri*; *Enterobacter aerogenes*; *Enterobacter cloacae*; *Escherichia coli*; *Klebsiella oxytoca*; *Klebsiella pneumoniae*; *Moraxella catarrhalis*; *Morganella morganii*; *Neisseria gonorrhoeae*; *Proteus mirabilis*; *Proteus vulgaris*; *Pseudomonas stutzeri*;

Анаэробные микроорганизмы:

Clostridium perfringens; *Fusobacterium spp.*; *Prevotella spp.*; *Propionibacterium acnes*.

Другие микроорганизмы:

Chlamydia pneumoniae; *Legionella pneumophila*; *Mycobacterium avium*; *Mycobacterium marinum*; *Mycoplasma pneumoniae*.

Отсутствуют данные о взаимосвязи между клиническим и бактериологическим исходом инфекционных заболеваний органа зрения на фоне терапии моксифлоксацином. По эпидемиологическим данным Европейского комитета по определению чувствительности к противомикробным препаратам, пороговые значения ингибирующей концентрации моксифлоксацина для различных микроорганизмов следующие:

Corynebacterium – нет данных;

Staphylococcus aureus – 0,25 мг/л;

Staphylococcus, coag-neg. – 0,25 мг/л;

Streptococcus pneumoniae – 0,5 мг/л;

Streptococcus pyogenes – 0,5 мг/л;

Streptococcus viridans group – 0,5 мг/л;

Enterobacter spp. – 0,25 мг/л;

Haemophilus influenzae – 0,125 мг/л;

Klebsiella spp. – 0,25 мг/л;

Moraxella catarrhalis – 0,25 мг/л;

Morganella morganii – 0,25 мг/л;
Neisseria gonorrhoeae – 0,032 мг/л;
Pseudomonas aeruginosa – 4 мг/л
Serratia marcescens – 1 мг/л.

Фармакокинетика.

При местном применении происходит системное всасывание моксифлоксацина: максимальная концентрация моксифлоксацина в плазме (C_{max}) составляет 2,7 нг/мл, величина площади под кривой «концентрация-время» (AUC) – 45 нг*ч/мл. Данные значения примерно в 1600 раз и в 1000 раз меньше, чем C_{max} и AUC после применения терапевтической дозы моксифлоксацина 400 мг перорально. Период полувыведения ($T_{1/2}$) моксифлоксацина из плазмы составляет около 13 часов.

Показания к применению.

Бактериальный конъюнктивит, вызванный чувствительными к моксифлоксацину микроорганизмами.

Противопоказания.

Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата или к другим хинолонам, детский возраст до 1 года.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания.

Беременность и период грудного вскармливания

Достаточного опыта по применению препарата во время беременности и в период грудного вскармливания нет. Применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания возможно в случае, когда ожидаемый лечебный эффект превышает потенциальный риск для плода и ребенка. Исследования на животных показали, что после перорального приема моксифлоксацина с грудным молоком экскретируются незначительные количества вещества. Тем не менее, при соблюдении терапевтических доз препарата не ожидается развитие нежелательных реакций у грудных детей.

Тератогенность.

При доклинических исследованиях на животных моксифлоксацин не оказывал тератогенного действия в дозах 500 мг/кг/сутки (что примерно в 21700 раз выше рекомендуемой суточной дозы для человека). Однако отмечалось некоторое снижение

массы плода и задержка развития скелетно-мышечной системы. На фоне дозы 100 мг/кг/сутки отмечалось повышение частоты уменьшения роста новорожденных.

Фертильность

Исследований по влиянию моксифлоксацина на фертильность при применении в виде инстилляций не проводилось.

Способ применения и дозы.

Местно.

Применение у взрослых (в том числе у пожилых пациентов старше 65 лет)

По 1 капле 3 раза в день в пораженный глаз. Улучшение состояния наступает через 5 дней проводимой терапии, но лечение следует продолжать на протяжении еще 2-3 дней. При отсутствии терапевтического эффекта через 5 дней терапии рекомендуется пересмотреть диагноз и выбор лечебной тактики. Длительность курса терапии зависит от тяжести состояния пациента, клинических и бактериологических особенностей инфекционного процесса.

Применение в педиатрической популяции

Не требуется коррекция режима дозирования при применении у детей.

Печеночная и почечная недостаточность

Коррекция дозы не требуется.

Для предотвращения микробной контаминации кончика флакона-капельницы и препарата необходимо избегать их соприкосновения с веками, кожей окологлазничной области и другими поверхностями.

В целях предотвращения абсорбции препарата через слизистую оболочку носа необходимо пальцем пережать носослезный канал на 2-3 минуты после инстилляций.

При применении нескольких препаратов для местного применения в офтальмологии интервал между их применением должен составлять не менее 5 минут, глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Побочные действия.

Нижеследующие нежелательные реакции классифицированы в соответствии со следующей градацией частоты встречаемости:

очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто (от $\geq 1/1\ 000$ до $<1/100$), редко (от

$\geq 1/10\ 000$ до $<1/1\ 000$), очень редко ($<1/10\ 000$). В каждой группе по частоте развития нежелательные реакции представлены в порядке убывания их степени серьезности.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Редко: снижение уровня гемоглобина.

Нарушения со стороны нервной системы

Нечасто: головная боль.

Редко: парестезия.

Нарушения со стороны органа зрения

Часто: боль, раздражение в глазах.

Нечасто: точечный кератит, синдром сухого глаза, конъюнктивальное кровоизлияние, гиперемия глаза, зуд в глазах, отек век, ощущение дискомфорта в глазах.

Редко: дефекты эпителия роговицы, нарушения со стороны роговицы, конъюнктивит, блефарит, отек глаз, отек конъюнктивы, нечеткость зрения, снижение остроты зрения, астигматизм, эритема век.

Нарушение со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: ощущение дискомфорта в носу, фаринголарингеальная боль, ощущение инородного тела (в горле).

Нарушение со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто: дисгевзия.

Редко: рвота.

Нарушение со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко: повышение уровня аланинаминотрансферазы и гаммаглутамилтрансферазы.

Постмаркетинговый опыт (частота неизвестна):

Нарушения со стороны иммунной системы

Гиперчувствительность.

Нарушение со стороны нервной системы

Головокружение.

Нарушения со стороны органов зрения

Язвенный кератит, кератит, повышенное слезотечение, светобоязнь, выделения из глаз.

Нарушения со стороны сердца

Ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Диспноэ.

Нарушение со стороны желудочно-кишечного тракта

Тошнота.

Нарушение со стороны кожи и подкожных тканей

Эритема, зуд, сыпь, крапивница.

Передозировка.

В связи с малой вместимостью конъюнктивальной полости возможность развития местной передозировки при применении лекарственных препаратов в виде инстилляций практически отсутствует. Общее содержание моксифлоксацина в препарате слишком мало для развития нежелательных явлений при случайном проглатывании содержимого флакона.

При попадании в глаза избыточного количества препарата рекомендуется промыть глаза теплой водой.

Взаимодействия с другими лекарственными препаратами.

Взаимодействие местно назначаемого моксифлоксацина с другими лекарственными препаратами не изучалось. В связи с низкой системной концентрацией после местного применения в виде инстилляций взаимодействие с другими лекарственными средствами маловероятно.

Известны данные для пероральной лекарственной формы моксифлоксацина: не отмечено клинически значимых лекарственных взаимодействий (в отличие от других препаратов фторхинолонового ряда) с теофиллином, варфарином, дигоксином, пероральными контрацептивами, пробеницидом, ранитидином и глибенкламидом.

В исследованиях *in vitro* моксифлоксацин не ингибирует изоферменты CYP3A4, CYP2D6, CYP2C9 или CYP1A2, что может свидетельствовать о том, что моксифлоксацин не изменяет фармакокинетические свойства лекарственных препаратов, метаболизируемых изоферментами цитохрома P450.

Особые указания.

Только для офтальмологического применения. Не для инъекций. Не допускается введение препарата субконъюнктивально или непосредственно в переднюю камеру глаза.

Были получены сообщения о развитии серьезных и, в некоторых случаях, смертельных гиперчувствительных (анафилактических) реакций у пациентов, систематически принимавших хинолоны; у некоторых пациентов развитие реакции наблюдалось уже после введения первой дозы. Некоторые реакции сопровождались сердечно-сосудистой недостаточностью, потерей сознания, отеком Квинке (включая отек гортани, глотки или лица), обструкцией дыхательных путей, диспноэ, крапивницей и зудом.

При развитии аллергической реакции к препарату Моксифлоксацин-Оптик следует прекратить применение препарата. В случае серьезных острых реакций гиперчувствительности может потребоваться немедленное проведение реанимационных мероприятий: по показаниям может быть необходима кислородотерапия с контролем проходимости дыхательных путей

Длительное применение антибиотика может приводить к избыточному росту невосприимчивых микроорганизмов, в том числе грибов. В случае возникновения суперинфекции необходимо прекратить применение препарата и назначить адекватную терапию.

Системное применение фторхинолонов, включая моксифлоксацин, может привести к воспалению и разрыву сухожилий, особенно у пациентов пожилого возраста и лиц, одновременно принимающих кортикостероиды. Таким образом, при появлении первых симптомов воспаления сухожилий следует прекратить прием препарата.

Данные по эффективности и безопасности препарата Моксифлоксацин-Оптик для лечения конъюнктивитов у новорожденных ограничены. Поэтому не рекомендуется использование препарата для лечения конъюнктивитов у новорожденных.

Моксифлоксацин-Оптик не рекомендуется применять для профилактики или эмпирической терапии конъюнктивитов, в том числе гонококковой офтальмии новорожденных, из-за фторхинолоновой резистентности гонококков *Neisseria gonorrhoeae*. Пациенты с глазными инфекциями, вызванными гонококками *Neisseria gonorrhoeae* должны получать соответствующее системное лечение.

Моксифлоксацин-Оптик не рекомендуется применять для лечения глазных инфекций, вызванных *Chlamidia trachomatis*, у пациентов в возрасте младше 2 лет, так как соответствующие исследования не проводились.

Пациенты в возрасте старше 2 лет с глазными инфекциями, вызванными *Chlamidia trachomatis*, должны получать соответствующее системное лечение.

Новорожденные с офтальмией новорожденных должны получать соответствующее лечение исходя из их состояния, например, системное лечение в случаях, вызванных гонококками *Chlamidia trachomatis* или *Neisseria gonorrhoeae*.

Пациентам не рекомендуется носить контактные линзы, если у них есть признаки инфекционных заболеваний переднего отрезка глазного яблока.

Флакон необходимо закрывать после каждого использования.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами.

После применения препарата возможно снижение четкости зрительного восприятия, и до ее восстановления не рекомендуется управлять автомобилем и заниматься видами деятельности, требующими повышенного внимания и реакции.

Форма выпуска.

Капли глазные 0,5 %.

По 5 мл, 10 мл во флаконы-капельницы полимерные из полиэтилена высокого давления с винтовой горловиной, пробкой-капельницей из полиэтилена низкого давления и навинчиваемой крышкой с контрольным кольцом первого вскрытия из полиэтилена низкого давления.

По 5 мл, 10 мл во флаконы-капельницы полимерные из полиэтилена высокого давления с винтовой горловиной, насадкой-дозатором из полиэтилена высокого давления и навинчиваемой крышкой с контрольным кольцом первого вскрытия из полипропилена; или во флаконы-капельницы полимерные из полиэтилена высокого давления с винтовой горловиной, насадкой-дозатором из полиэтилена высокого давления и навинчиваемой крышкой с контрольным кольцом первого вскрытия из полиэтилена низкого давления.

1 флакон-капельницу полимерную вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в оригинальной упаковке.

Срок годности.

2 года.

Не использовать препарат по истечении срока годности.

Вскрытый флакон-капельницу хранить не более 30 суток.

Условия отпуска.

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ЗАО "ЛЕККО",

Россия, 601125, Владимирская обл., Петушинский район, пос. Вольгинский.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО "ЛЕККО",

Россия, 601125, Владимирская обл., Петушинский район, пос. Вольгинский,

тел./факс (49 243) 71 5 52.

Представитель

ЗАО "ЛЕККО"

С.В. Барькин