

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Офтакуикс 5 mg/ml очни капки
Oftaquix 5 mg/ml eye drops

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Един ml от очните капки, разтвор съдържа 5.12 mg Levofloxacin hemihydrate, еквивалент на Levofloxacin 5mg.
За помощни съставки, виж 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Разтвор за очни капки.
Бистър, светложълт до светло зеленикаво-жълт разтвор, практически без видими частици.

4. КЛИНИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

4.1 Терапевтични показания

Офтакуикс 5 mg/ml очни капки е предназначен за локално лечение на бактериални външни очни инфекции при пациенти на възраст ≥ 1 година, причинени от микроорганизми, чувствителни към левофлоксацин (виж също параграфи 4.4 и 5.1).

Трябва да се проучат официалните упътвания за за правилното използване на антибактериални агенти.

4.2 Приложение и дозировка

Приложение

При всички пациенти през първите два дни да се поставят по една до две капки в засегнатото око (очи) на всеки два часа, до 8 пъти дневно, когато са будни. След това, от 3-ия до 5-ия ден - по четири пъти дневно. Ако едновременно се използват други очни препарати за локално приложение, се изисква интервал от поне 15 минути между две накапвания.

За да се предотврати заразяването на гутатора и разтвора, върхът на гутатора не трябва да влиза в допир с клепачите или околните повърхности.

Въпреки че очните капки Офтакуикс 5 mg/ml, при проучване на тяхната безопасност, са прилагани за период до 15 дни, обичайният срок на лечение е 5 дни.

Продължителността на лечение зависи от тежестта на заболяването, от клиничния и бактериологичен ход на инфекцията.

Безопасността и ефикасността на препарата при лечение на язва на роговицата и офталмия на неонатум не са установени.

Прилагане при пациенти в напреднала възраст
Не се изисква корекция на дозата.

Начин на употреба

За очно приложение.



4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активната субстанция левофлоксацин, към други хинолони или към някои от помощните съставки, например бензалкониев хлорид.
(виж също параграф 6.1)

Офтакуикс 5 mg/ml очни капки не трябва да се предписват по време на бременност и кърмене.

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Офтакуикс 5 mg/ml очни капки не трябва да се инжектират субконюнктивално. Разтворът не бива да се въвежда директно в предната очна камера.

Системните флуорохинолони понякога предизвикват реакции на свръхчувствителност дори при еднократна доза. Ако се появи алергична реакция към левофлоксацин - спрете медикамента. Както и при други антибиотици, продължителната употреба може да доведе до свръхрастеж на нечувствителни организми, включително гъбички. Ако се получи влошаване на инфекцията, или ако не се забелязва клинично подобрение в разумни срокове на лечение, преустановете използването и назначете алтернативна терапия. Когато клиничната преценка налага това, пациентът трябва да се изследва с помощта на увеличение, като биомикроскоп, и където е уместно с флуоросцентно оцветяване.

Формулата на Офтакуикс 5 mg/ml очни капки съдържа бензалкониев хлорид като консервант и за това не трябва да се прилага при пациенти, които носят хидрофилни (меки) контактни лещи, тъй като консервантът може да се абсорбира от тях и да предизвика дразнене на окото.

По принцип, на пациентите трябва да се препоръча да не носят контактни лещи, когато имат признаци и симптоми на бактериален конюнктивит.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Специални проучвания за лекарствените взаимодействия на Офтакуикс™ 5 mg/ml очни капки не са провеждани. Тъй като максималните плазмени концентрации на левофлоксацина след очно приложение са минимум 1000 пъти по-ниски в сравнение с тези, установени след стандартното перорално приложение, малко вероятно е взаимодействието, споменати при системно приложение, да имат клинична изява, когато се използва Офтакуикс™ 5 mg/ml очни капки.

Ако едновременно се използват други очни препарати за локално приложение, се изисква интервал от поне 15 минути между две накапвания.

4.6 Бременност и кърмене

Назначаването на Офтакуикс 5 mg/ml очни капки по време на бременност и кърмене е противопоказано, тъй като е установено, в проучвания с животни, че гиразните инхибитори предизвикват растежни смущения в ставите, подложени на по-големи натоварвания. Досега плазмените концентрации на левофлоксацин, достигнати след приложение върху инфектирано око, не са установени.

4.7 Повлияване на възможностите за шофиране и работа с машини

Ако има преходно повлияване на зрението, пациентът трябва да бъде посъветван да изчака до избистряне на зрението преди да шофира или работи с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

При приблизително 10% от пациентите могат да се очакват странични реакции. Реакциите се преценяват обикновено като леки или умерени, преходни са и се ограничават най-вече в окото.

Тъй като препаратът съдържа бензалкониев хлорид, контактна екзема и/или дразнене могат да се дължат на активната съставка или на този консервант.

Най-чести странични реакции (1% до 10% от пациентите):

Парене в окото (1.6%), намалено зрение (1.2%) и мукозна секреция (1.2%).



Редки странични реакции (0.1% до 1% от пациентите):

Слепване на клепачите (0.9%), хемозис (0.7%), конюнктивална папиларна реакция (0.7%), оток на клепачите (0.5%), очен дискомфорт (0.5%), сърбеж в окото (0.5%), болка в окото (0.5%), инекция на конюнктивата (0.2%), фоликули на конюнктивата (0.2%), сухота в окото (0.2%), еритем на клепача (0.2%) и фотофобия (0.2%).

Други реакции, наблюдавани при клиничните проучвания, включват главоболие (0.9%) и ринит (0.5%). При клиничните проучвания не са наблюдавани преципитации по роговицата.

4.9 Предозиране

Общото количество левофлоксацин в един флакон с очни капки е много малко, за да предизвика токсични реакции при погрешно приемане през устата. Ако се сметне за необходимо, пациентът може да се наблюдава клинично и да се предприемат необходимите мерки. При локално свръхдозиране с Офтакуикс 5 mg/ml очни капки, очите могат да се изплакнат с чиста (чешмяна) вода на стайна температура.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Синтетичен антибактериален агент от флуороквинолонов клас. АТС код: S01AX19

Левофлоксацинът е L-изомер на гроздовата лекарствена субстанция офлоксацин. Антибактериалната активност на офлоксацина се определя основно от L-изомера.

Начин на действие

Като флуорохинолонов антибактериален агент, левофлоксацинът действа върху ДНК-ДНК-гиразния комплекс и топоизомераза IV.

Пределни нива

Предварително предлаганите пределни нива, разделящи чувствителни от умерено чувствителни микроорганизми и умерено чувствителни от резистентни микроорганизми са следните: Чувствителни $\leq 2\text{mg/l}$, резистентни $\geq 8\text{mg/l}$

Антибактериален спектър

Честотата на придобитата резистентност на определени видове може да варира в зависимост от географското местоположение и във времето, затова е желателно да има местна информация за резистентност, особено когато се лекуват тежки инфекции. Ето защо представената информация дава само приблизително напътствие за вероятностите микроорганизмите да са чувствителни към левофлоксацин или не. Тук са представени само онези бактериални видове, които обикновено причиняват външни очни инфекции като конюнктивити.

Чувствителни микроорганизми

Аероби, Грам-отрицателни:

Branhamella (Moraxella) catarrhalis

Haemophilus influenzae

Neisseria gonorrhoeae

Pseudomonas aeruginosa

Аероби, Грам-положителни:

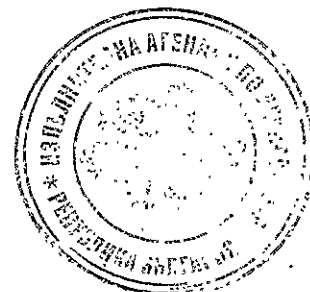
*Staphylococcus aureus**

Streptococcus pneumoniae

Streptococcus pyogenes

“Други”:

Chlamydia trachomatis



* Отнася се само за метицилин-чувствителните щамове на *Staphylococcus aureus*. Болшинството от метицилин-резистентните *Staphylococcus aureus* (MRSA) са флуорохинолон-резистентни.

Микроорганизмите са определени като левофлоксацин-чувствителни на базата на тяхната чувствителност *in-vitro* и на плазмените концентрации, достигнати след системна терапия. При локална терапия се достигат по-високи пикови концентрации от тези, открити в плазмата. Не е известно, обаче, след локално приложение на медикамента върху окото, дали и как кинетиката му може да промени антибактериалната активност на левофлоксацина.

Кръстосана резистентност

Кръстосана резистентност между флуорохинолони може да се появи, когато резистентността се дължи на мутации в бактериалните топоизомеразы. Единичните мутации могат и да не доведат до клинична резистентност, но множествените мутации обикновено водят до клинична резистентност към всички медикаменти от този клас. Резистентност по механизма на непроницаемост и/или изпомпване на медикамента може да има различен ефект върху чувствителността към флуорохинолони, която зависи от физикохимичните качества на различните медикаменти от този клас и от афинитета на транспортните системи към всеки от тях.

5.2. Фармакокинетични свойства

След поставяне в окото, левофлоксацина се запазва добре в слъзния филм.

В проучване върху здрави доброволци, средните концентрации на левофлоксацин в слъзния филм, измерени четири и шест часа след локално поставяне, са били съответно 17.0 и 6.6 $\mu\text{g/mL}$. Пет от шестима изследвани са имали концентрации от 2 $\mu\text{g/mL}$ или по-високи на четвъртия час след поставянето. Четири от шестима изследвани са задържали тази концентрация 6 часа след поставянето.

Концентрациите на левофлоксацин в плазмата на 15 здрави пълнолетни доброволци са измервани по различно време през 15 дневен курс на лечение с Офтакуикс 5 mg/ml очни капки, разтвор. Средната концентрация на левофлоксацин в плазмата 1 час след поставяне варира от 0.86 ng/mL на 1-ия ден до 2.05 ng/mL на 15-ия ден. Най-високата максимална концентрация на левофлоксацин от 2.25 ng/mL е измерена на 4-ия ден след 2 дни поставяне на всеки 2 часа при общо 8 дози на ден. Максималните концентрации на левофлоксацин са се увеличили от 0.94 ng/mL на 1-ия ден до 2.15 ng/mL на 15-ия ден, което е повече от 1000 пъти по-ниско от концентрациите, съобщени след стандартните приеми на левофлоксацин през устата.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните въздействия са наблюдавани само при експозиции значително по-високи от максималните експозиции след поставянето на Офтакуикс 5 mg/ml очни капки, което има малка значимост за клиничното използване.

Както и другите флуорохинолони, левофлоксацинът има влияние върху хрущяла (набъбване и кухини) у плъхове и кучета след високи перорални дози.

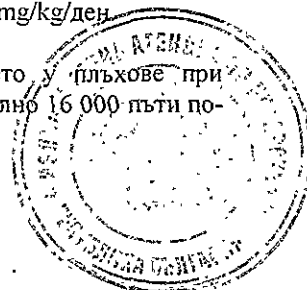
Катарактогенен потенциал не може да се изключи поради липсата на специфични проучвания.

Нарушения в зрението при животни не могат да се изключат със сигурност на базата на сегашните данни.

Репродуктивна токсичност:

Левофлоксацинът не е тератогенен у плъхове при високи перорални дози до 810 mg/kg/ден. Тъй като се знае, че левофлоксацина се абсорбира напълно, кинетиката му е линейна. Не е забелязана разлика във фармакокинетичните параметри при единична и множествена перорална доза. Системното експониране на плъхове на дози от 810 mg/kg/ден е приблизително 50 000 пъти по-голямо от това, което се постига при хора след дози от 2 капки Офтакуикс 5 mg/ml очни капки в двете очи. Не се наблюдава тератогенен ефект, когато зайци са получавали перорално до 50 mg/kg/ден или венозни дози до 25 mg/kg/ден.

Левофлоксацинът не предизвиква нарушения във фертилността и размножаването у плъхове при перорални дози до 360 mg/kg/ден, които водят до плазмени концентрации приблизително 16 000 пъти по-високи от достигнатите след 8 очни дози при хората.



Генна токсичност:

Левофлоксацинът не предизвиква генни мутации в клетките на бактерии и бозайници, но предизвиква хромозомни аберации *in vitro* в белодробни клетки на китайски хамстер при 100 µg/mL или повече, в отсъствието на метаболитно активиране. При опити *in vivo* не показва генотоксичен потенциал.

Фототоксичен потенциал:

Проучвания при мишки след перорално и венозно дозиране показват, че левофлоксацинът има фототоксична активност само при много високи дози. След поставяне на 3% очен разтвор левофлоксацин върху избърсната кожа на морски свинчета, не са наблюдавани нито кожен фотосенсибилизиращ потенциал, нито кожен фототоксичен потенциал. Левофлоксацинът не показва генотоксичен потенциал във фотомутагенни опити и намалява развитието на тумори във фотокарциногенни опити.

Карциногенен потенциал:

В дългосрочно карциногенно проучване при плъхове, левофлоксацинът не показва карциногенен или туморогенен потенциал след ежедневен перорален прием на дози до 100 mg/kg/ден за 2 години.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Ексципиенти

Benzalkonium chloride - разтвор

Sodium Chloride

Разреден разтвор на Sodium hydroxide или разреден Hydrochloric acid

Water for injections

6.2 Несъвместимост

При отсъствие на проучвания за съвместимост, този медикамент не трябва да се смесва с други медикаменти.

6.3 Срок на годност

3 години.

Срокът на годност на отворения флакон е 4 седмици.

6.4 Специални изисквания за съхранение

Няма специални изисквания за съхранение.

Съхранявайте флакона плътно затворен.

6.5 Лекарствена форма и опаковка

5 ml разтвор се доставя в 5 ml бял флакон от полиетилен ниска плътност (LDPE) с гутатор от LDPE и жълтокафява капачка на винт от полиетилен висока плътност (HDPE).

6.6 Инструкции за използване и употреба

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Santen Oy
Niittyhaankatu 20,
33720 Tampere
Finland

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР (A)

9. ДАТА НА РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА/ ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

04 ноември 1999

