

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Ципрофлоксацин-АКОС

Регистрационный номер: P N001587/02

Торговое название препарата: Ципрофлоксацин-АКОС

Международное непатентованное наименование: ципрофлоксацин

Лекарственная форма: капли глазные

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: ципрофлоксацина гидрохлорид (в пересчёте на ципрофлоксацин) -
3 мг;

вспомогательные вещества: бензалкония хлорид, динатрия эдетата дигидрат (соль динатриевая этилендиамин-N,N,N',N'-тетрауксусной кислоты 2-водная (трилон Б)), маннитол (маннит), натрия ацетата тригидрат (натрий уксуснокислый 3-водный), уксусная кислота ледяная, вода для инъекций – до 1 мл.

Описание: Прозрачный раствор слегка желтоватого или слегка желтовато-зеленоватого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство, фторхинолон.

Код АТХ: [S01AX13]

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Противомикробное средство широкого спектра действия из группы фторхинолонов (подгруппы монофторхинолонов) для местного применения в офтальмологии.

Подавляет бактериальную ДНК-гиразу (топоизомеразы II и IV, ответственные за процесс суперспирализации хромосомной ДНК вокруг ядерной РНК, что необходимо для считывания генетической информации), нарушает синтез ДНК, рост и деление бактерий; вызывает выраженные морфологические изменения (в т.ч. клеточной стенки и мембран) и быструю гибель бактериальной клетки.

Действует бактерицидно на грамотрицательные организмы в период покоя и деления (т.к. влияет не только на ДНК-гиразу, но и вызывает лизис клеточной стенки), на грамположительные микроорганизмы - только в период деления. Повышает проницаемость клеточной оболочки бактерий.

Низкая токсичность для клеток макроорганизма объясняется отсутствием в них ДНК-гиразы. На фоне приема ципрофлоксацина не происходит параллельной выработки устойчивости к другим антибиотикам, не принадлежащим к группе ингибиторов гиразы, что делает его

высокоэффективным по отношению к бактериям, которые устойчивы к аминогликозидам, пенициллинам, цефалоспорином, тетрациклинам и многим другим антибиотикам.

К ципрофлоксацину чувствительны:

грамотрицательные аэробные бактерии: энтеробактерии (*Escherichia coli*, *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Citrobacter* spp., *Klebsiella* spp., *Enterobacter* spp., *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Serratia marcescens*, *Hafnia alvei*, *Edwardsiella tarda*, *Providencia* spp., *Morganella morganii*, *Vibrio* spp., *Yersinia* spp.), др. грамотрицательные бактерии (*Haemophilus* spp., *Pseudomonas aeruginosa*, *Moraxella catarrhalis*, *Aeromonas* spp., *Pasteurella multocida*, *Plesiomonas shigelloides*, *Campylobacter jejuni*, *Neisseria* spp.), некоторые внутриклеточные возбудители - *Legionella pneumophila*, *Brucella* spp., *Chlamydia trachomatis*, *Listeria monocytogenes*, *Mycobacterium tuberculosis*, *Mycobacterium kansasii*, *Corynebacterium diphtheriae*;

грамположительные аэробные бактерии: *Staphylococcus* spp. (*Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus haemolyticus*, *Staphylococcus hominis*, *Staphylococcus saprophyticus*), *Streptococcus* spp. (*Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus agalactiae*).

Большинство стафилококков, устойчивых к метициллину, резистентны и к ципрофлоксацину.

Чувствительность *Streptococcus pneumoniae*, *Enterococcus faecalis*, *Mycobacterium avium* (расположенных внутриклеточно) - умеренная (для их подавления требуются высокие концентрации).

К препарату резистентны (устойчивы): *Bacteroides fragilis*, *Pseudomonas ceracia*, *Pseudomonas maltophilia*, *Ureaplasma urealyticum*, *Clostridium difficile*, *Nocardia asteroides*. Неэффективен в отношении *Treponema pallidum*.

Резистентность к ципрофлоксацину развивается крайне медленно, поскольку, с одной стороны, после действия ципрофлоксацина практически не остается персистирующих микроорганизмов, а с другой - у бактериальных клеток нет ферментов, инактивирующих его.

Препарат малотоксичен.

Фармакокинетика

При местном применении ципрофлоксацин хорошо проникает в ткани глаза. Проникает в роговицу и в переднюю камеру глаза, особенно при нарушении эпителиального покрова роговицы. При поражении роговицы концентрация ципрофлоксацина в ней эффективна против большинства возбудителей роговичных инфекций.

После однократной инстилляцией концентрация ципрофлоксацина во влаге передней камеры глаза достигается через 10 мин и составляет 100 мкг/мл. Максимальная концентрация *Cmax* во влаге передней камеры через 1 ч составляет 190 мкг/мл. Через 2 ч концентрация препарата

начинает снижаться, при этом его антибактериальное действие в тканях роговицы сохраняется до 6 ч, во влаге передней камеры - до 4 ч.

После инстилляций возможна системная абсорбция препарата. При местном применении глазных капель ципрофлоксацина 4 раза/сутки в оба глаза в течение 7 дней средняя концентрация ципрофлоксацина в плазме крови составляет менее 2-2,5 нг/мл, максимальная концентрация - менее 5 нг/мл.

При местном применении $T_{1/2}$ из плазмы составляет 4-5 ч. Препарат выводится почками в неизменном виде - до 50%, и в виде метаболитов - до 10%; через кишечник - около 15%. Некоторая часть препарата выделяется с грудным молоком.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания глаз, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

- острый и подострый конъюнктивит;
- блефарит, блефароконъюнктивит;
- кератит, кератоконъюнктивит;
- передний увеит;
- бактериальная язва роговицы;
- дакриоцистит;
- мейбомит (ячмень);
- трахома;
- инфекционные поражения глаз после травм или попадания инородных тел.

Профилактика и лечение инфекционных осложнений при травмах глаза и его придатков (в том числе после удаления инородного тела из роговицы, конъюнктивы, после воздействия химическими или физическими средствами) и при операциях на глазном яблоке (пред- и послеоперационная профилактика инфекций в офтальмохирургии).

Противопоказания

Гиперчувствительность к ципрофлоксацину или к другим препаратам группы фторхинолонов, детский возраст до 1 года, беременность, лактация (грудное вскармливание).

С осторожностью препарат назначают пациентам с атеросклерозом сосудов головного мозга, нарушением мозгового кровообращения, судорожным синдромом.

Способ применения и дозы

Местно, по 1-2 капли в конъюнктивальный мешок пораженного глаза. Частота инстилляций зависит от тяжести воспалительного процесса.

При легкой и умеренно тяжелой инфекции закапывают по 1-2 капли в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (или обоих глаз) каждые 4 ч, при тяжелой инфекции - по 2 капли каждый час. После улучшения состояния дозу и частоту инстилляций уменьшают.

При острых бактериальных конъюнктивитах, простых, чешуйчатых и язвенных блефаритах - 4-8 раз/сут в зависимости от тяжести воспалительного процесса, курс лечения - от 5 до 14 дней.

При кератитах - по 1 капле не менее 6 раз/сут. При наличии положительного эффекта продолжительность терапии зависит от тяжести поражения роговицы и обычно составляет 2-4 недели.

При поражении роговицы, вызванном *Pseudomonas aeruginosa*, - по 1 капле не менее 8-12 раз/сут. Продолжительность терапии зависит от течения заболевания и обычно составляет около 2-3 недель.

При передних увеитах препарат назначают по 1 капле 8-12 раз/сут. При острых дакриоциститах и каналикулитах - по 1 капле 6-12 раз/сут, при хронических - 4-8 раз/сут.

При бактериальной язве роговицы: в первые сутки - каждые 15 мин в течение 6 ч, затем по 1 капле каждые 30 мин в часы бодрствования; вторые сутки - по 1 капле каждый час в часы бодрствования; с 3 по 14 день - по 1 капле каждые 4 ч в часы бодрствования. Если после 14 дней терапии эпителизация не произошла, то лечение можно продолжить.

Для профилактики вторичной инфекции при травмах глаза и его придатков - по 1 капле 4-8 раз/сут в течение 1-2 недель. Для профилактики воспалительных заболеваний после хирургических вмешательств с перфорацией глазного яблока - по 1 капле 4-6 раз/сут в течение всего послеоперационного периода (обычно от 5 дней до 1 мес).

Побочное действие

Частота встречаемости нежелательных реакций классифицирована следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), с неизвестной частотой (частота встречаемости не может быть установлена на основании имеющихся сведений). В каждой из групп перечисление нежелательных реакций производится по мере уменьшения частоты их встречаемости.

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – реакции гиперчувствительности к действующему веществу и компонентам препарата.

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль; редко – головокружение.

Нарушения со стороны органа зрения: часто – преципитаты на роговице, дискомфорт в глазу, гиперемия конъюнктивы; нечасто – кератопатия, точечный кератит, инфильтраты роговицы, светобоязнь, снижение остроты зрения, отек век, затуманивание зрения, боль в глазу, сухость в глазу, отек конъюнктивы и век, зуд в глазу, слезотечение, выделения из глаз, образование корок на краях век, шелушение кожи век, гиперемия век; редко – токсические явления со стороны органа зрения, кератит, конъюнктивит, дефект эпителия роговицы, диплопия, снижение чувствительности роговицы, астиопия, ячмень.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: редко – боль в ухе.

Нарушения со стороны органов дыхания, органов грудной клетки и средостения: редко – повышенная секреция отделяемого слизистой оболочкой околоносовых пазух, ринит.

Нарушения со стороны органов пищеварительной системы: часто – дисгевзия; нечасто – тошнота; редко – боль в животе, диарея.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко – дерматит.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: с неизвестной частотой – нарушения со стороны связочного аппарата.

Отдельные группы нежелательных реакций.

Отмечены редкие случаи развития генерализованной сыпи, токсического эпидермолиза, эксфолиативного дерматита, синдрома Стивенса-Джонсона и крапивницы.

Серьезные анафилактические реакции, в редких случаях со смертельным исходом, в том числе после приема первой дозы, отмечались у пациентов, получавших фторхинолоны перорально. Некоторые из этих реакций сопровождались сердечно-сосудистым коллапсом, потерей сознания, отеком гортани и лица, чувством покалывания, диспноэ, зудом и крапивницей.

У пациентов, принимавших фторхинолоны перорально, отмечались разрывы сухожилий плечевого сустава, сухожилий суставов кистей рук, ахиллова сухожилия и других сухожилий, которые впоследствии требовали хирургического вмешательства или приводили к длительной нетрудоспособности. В ходе постмаркетингового наблюдения не отмечено влияния инстилляций ципрофлоксацина на состояние скелетно-мышечной системы и соединительной ткани.

В отдельных случаях при инстилляциях ципрофлоксацина отмечались затуманивание зрения, снижение остроты зрения и остаточное количество препарата на поверхности роговицы.

В ходе системного применения хинолонов отмечались реакции фототоксичности средней и тяжелой степени тяжести, однако для ципрофлоксацина такие реакции не характерны.

Передозировка

Данные по передозировке препарата отсутствуют.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Фармацевтическое взаимодействие: раствор ципрофлоксацина несовместим с растворами лекарственных средств, имеющих значения pH 3-4, которые физически или химически нестабильны.

При одновременном сочетании с другими антимикробными препаратами обычно наблюдается синергидное взаимодействие (бета-лактамы, антибиотики, аминогликозиды, клиндамицин, метронидазол).

Особые указания

Раствор в виде глазных капель не предназначен для внутриглазных инъекций!

Препарат нельзя вводить субконъюнктивально или прямо в переднюю камеру глаза!

При использовании других офтальмологических лекарственных средств интервал между их введением должен составлять не менее 5 минут.

При применении глазных капель цiproфлоксацина необходимо принимать во внимание возможность ринофарингеального пассажа, что может привести к увеличению частоты встречаемости и увеличению степени выраженности бактериальной резистентности. Серьёзные анафилактические реакции, в редких случаях со смертельным исходом, в том числе после приёма первой дозы, отмечались у пациентов, получавших системную терапию фторхинолонами. Некоторые из этих реакций сопровождались сердечно-сосудистым коллапсом, потерей сознания, отёком гортани и лица, чувством покалывания, диспноэ, зудом и крапивницей. Лишь у нескольких пациентов отмечались реакции гиперчувствительности в анамнезе.

Применение препарата следует немедленно прекратить при появлении кожной сыпи или любых других признаков аллергической реакции. В случае проявления реакции гиперчувствительности к цiproфлоксацину может потребоваться неотложная помощь, в том числе с применением искусственной вентиляции легких.

При длительной терапии антибактериальными препаратами возможен избыточный рост невосприимчивых микроорганизмов, в том числе грибковой флоры. В случае развития суперинфекции необходимо назначить дополнительную антибактериальную терапию. Имеются данные о случаях воспаления и разрывов сухожилий у пожилых пациентов при системном применении фторхинолонов совместно с глюкокортикостероидами, поэтому при первых признаках воспаления сухожилий прием препарата следует прекратить.

У пациентов с язвой роговицы было отмечено появление белого кристаллического преципитата, который представляет собой остатки препарата. Преципитат не препятствует дальнейшему применению цiproфлоксацина и не влияет на терапевтический эффект препарата. Появление преципитата отмечается в период от 24 часов до 7 дней после начала терапии, а его рассасывание может происходить как непосредственно после образования, так и в течение 13 дней после начала терапии.

Препарат содержит консервант бензалкония хлорид, который может абсорбироваться контактными линзами и вызывать изменение их цвета, а также раздражение глаза. Перед применением препарата контактные линзы следует снять и установить обратно не ранее, чем через 15 минут после применения препарата.

В период лечения препаратом ношение контактных линз не рекомендуется.

Флакон необходимо закрывать после каждого использования.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

После применения глазных капель возможно снижение четкости зрительного восприятия, поэтому сразу после закапывания не рекомендуется управлять автомобилем и заниматься видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Капли глазные 0,3 %.

По 5 мл во флаконы полимерные из полиэтилена низкого давления с насадкой-дозатором и крышкой завинчивающейся или во флаконы-капельницы полимерные из полиэтилена высокого давления и полиэтилена низкого давления (в пропорции 2:1) с пробкой-капельницей и крышкой навинчиваемой, или во флаконы полимерные из полиэтилена высокого давления и полиэтилена низкого давления (в пропорции 2:1) с пробкой-капельницей и крышкой навинчиваемой.

Каждый флакон с инструкцией по применению помещают в пачку из картона

Срок годности

2 года.

После вскрытия флакона использовать в течение 1 месяца.

Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Не замораживать.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии потребителей

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»), Россия.

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: 8-800-600-00-80

e-mail: contact@ksintez.ru

www.ksintez.ru