

БЕЛМОКСИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Белмокси.

Международное непатентованное название: моксифлоксацин гидрохлорид.

Лекарственная форма: глазные капли.

Состав:

Моксифлоксацин гидрохлорид USP эквивалентно моксифлоксацину 0,25 мг/л;

Стерильная водная основа q.s.

Фармакотерапевтическая группа: Препараты для лечения заболеваний глаз. Противомикробное средство – фторхинолон.

Код АТХ: S01AE07

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Моксифлоксацин – фторхиноловый антибактериальный препарат IV поколения, ингибирует ДНК-гиразу и топоизомеразу IV, которые в бактериальной клетке осуществляют репликацию, рекомбинацию и репарацию ДНК.

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 определена в связи с различиями в механизме действия. 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, *Moraxella catarrhalis* 0,25 мг/л, *Morganellamorganii* 0,25 мг/л, *Neisseria gonorrhoeae* 0,032 мг/л, *Pseudomonas aeruginosa* 4 мг/л, *Serratiamarcescens* 1 мг/л. 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, таких как: часто восприимчивые виды, аэробные грамположительные микроорганизмы: *Corynebacterium* включая *Corynebacterium diphtheriae*, *Staphylococcus aureus* (включая штаммы, нечувствительные к метициллину, эритромицину, гентамицину, офлоксацину, тетрациклину и/или триметоприму), *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus viridans*. Аэробные грамотрицательные микроорганизмы: *Enterobacter cloacae*, *Haemophilus influenzae*, *Klebsiella oxytoca*, *Moraxella catarrhalis*, *Serratia marcescens*. Анаэробные микроорганизмы: *Propionibacterium acnes*. Другие микроорганизмы: *Chlamydia trachomatis*.

Моксифлоксацин действует *in vitro* против большинства ниже перечисленных микроорганизмов, но клиническое значение этих данных неизвестно: Грамположительные бактерии: *Listeriamonocytogenes*, *Staphylococcus saprophyticus*, *Streptococcusagalactiae*, *Streptococcusmitis*, *Streptococcuspyogenes*, *Streptococcuspylumi* C, G, F; Грамотрицательные бактерии *Acinetobacterbaumannii*, *Acinetobactercalcoaceticus*, *Citrobacterfreundii*, *Citrobacterkoseri*, *Enterobacteraerogenes*, *Enterobactercloacae*, *Escherichiacoli*, *Klebsiellaoxytoca*, *Klebsiellapneumoniae*, *Moraxellacatarrhalis*, *Morganellamorganii*, *Neisseriagonorrhoeae*, *Proteusmirabilis*, *Proteusvulgaris*, *Pseudomonasstutzeri*; Анаэробные микроорганизмы *Clostridium perfringens*, *Fusobacterium* spp., *Prevotella* spp., *Propionibacterium acnes*. Другие микроорганизмы *Chlamydia pneumoniae*, *Legionella pneumophila*, *Mycobacterium avium*, *Mycobacterium marinum*, *Mycoplasma pneumoniae*.

Фармакокинетика

При местном применении происходит системное всасывание моксифлоксацина. Концентрация моксифлоксацина в плазме была определена у 21 пациента мужского и женского пола, получавших моксифлоксацин в лекарственной форме капли глазные в оба глаза по 1 капле 3 раза в день в течение 4 дней. Средняя максимальная концентрация (С_{max}) моксифлоксацина в плазме крови в равновесном состоянии составила 2,7 нг/мл, величина площади под кривой «концентрация-время» (AUC) –41,9нг ч/мл. Указанные значения примерно в 1600 и в 1200 раз меньше, чем среднее С_{max} и AUC после приема внутрь терапевтической дозы моксифлоксацина 400 мг. Период полувыведения (T_{1/2}) моксифлоксацина составляет около 13 ч.

Показания к применению:

Бактериальный конъюнктивит, вызванный чувствительными к моксифлоксацину микроорганизмами.

Противопоказания:

- индивидуальная повышенная чувствительность к компонентам препарата; повышенная чувствительность к препаратам хинолонового ряда;
- детский возраст до 1 года.

Беременность и период лактации:

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 развития нежелательных реакций у грудных детей.

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен только для местного применения в офтальмологической практике. Не предназначен для применения в виде субконъюнктивальных инъекций или для введения в переднюю камеру глаза.

Взрослым (в т.ч. пациентам пожилого возраста старше 65 лет) назначают по 1 капле 3 раза в сутки 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.

Детям коррекция дозы не требуется.

У пациентов с печеночной и почечной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

Для предотвращения микробной контаминации кончика флакона и препарата необходимо избегать их соприкосновения с веками, кожей окологлазной области и другими поверхностями. В целях предотвращения абсорбции препарата через слизистую оболочку носа необходимо пальцем пережать носослезный канал на 2-3 мин после инстилляций. При применении нескольких препаратов для местного применения в офтальмологии интервал между их применением должен составлять не менее 5 мин, глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Побочные действия:

В ходе клинических исследований моксифлоксацина в лекарственной форме для применения в офтальмологии 2252 пациента получили исследуемый препарат по 1 капле вплоть до 8 раз/сут, 1900 из которых получали моксифлоксацин в режиме по 1 капле 3 раза в сутки. Популяция для оценки безопасности включала 1389 пациентов в США и Канаде, 586 пациентов в Японии и 277 пациентов в Индии. По данным клинических исследований не получено сведений о серьезных нежелательных явлениях как со стороны органа зрения, так и организма в целом. Наиболее часто встречающимися нежелательными реакциями, связанными с лечением, были раздражение глаз и зрение в глазах, суммарная частота встречаемости этих явлений варьировала от 1% до 2%. У 96% пациентов степень тяжести этих реакций была легкой, в то время как у одного из пациентов, принимавших участие в исследовании, выраженность нежелательного явления привела к завершению участия в исследовании.

Нижеследующие нежелательные реакции классифицированы в соответствии со следующей оценкой градации частоты встречаемости: очень часто (>1/10); часто (>1/100, <1/10); нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000) и очень редко (менее 1/10 000).

Со стороны системы кровообращения: редко - снижение гемоглобина.

Со стороны иммунной системы: частота неизвестна - гиперчувствительность.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль; редко - парестезии; частота неизвестна - головокружение.

Со стороны органа зрения: часто - боль в глазах, раздражение глаз; нечасто - точечный кератит, синдром сухого глаза, субконъюнктивальное кровоизлияние, зуд глаз, конъюнктивальная инъекция, отек век, дискомфорт в глазах; редко - дефект эпителия роговицы, нарушения со стороны роговицы, конъюнктивит, блефарит, отек конъюнктивы, затуманивание зрения, снижение остроты зрения, астенония, эритема век; частота неизвестна - эндофтальмит, язвенный кератит, эрозия роговицы, повышение внутриглазного давления, помутнение роговицы, отек роговицы, инфильтрат роговицы, отложения на роговице, аллергические явления со стороны глаз, кератит, отек роговицы, светобоязнь, слезотечение, отделяемое из глаз, ощущение инородного тела в глазах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: частота неизвестна - ощущение сердцебиения.

Со стороны дыхательной системы: редко - дискомфорт в носу, боль в гортани и глотке, чувство инородного тела в горле; частота неизвестна - одышка.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - дисгевзия; редко - рвота, повышение активности аминотрансфераз и ГГТ; частота неизвестна - тошнота.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: частота неизвестна - эритема, сыпь, крапивница, зуд.

Описание отдельных нежелательных реакций

Имеются сообщения о разрывах сухожилий плечевого сустава, суставов рук, ахиллова сухожилия, а также других сухожилий, которые привели к длительному периоду нетрудоспособности или потребовали хирургического вмешательства. Эти явления были отмечены у пациентов, получавших системную терапию фторхинолонами. По данным клинических исследований и пострегистрационного применения риск разрывов сухожилий при системной терапии фторхинолонами может возрастать при включении в схему терапии кортикостероидов, в группе особого риска находятся пожилые пациенты. Чаще всего повреждения затрагивают сухожилия опорных суставов, в т.ч. ахилловы сухожилия.

Применение у детей

В ходе клинических исследований с участием детей, в т.ч. новорожденных, продемонстрирован сходный со взрослой популяцией профиль безопасности моксифлоксацина в виде инстилляций. У пациентов в возрасте до 18 лет наиболее часто отмечались боль в глазах и раздражение глаз, частота встречаемости составляла порядка 0,9%. По результатам клинических исследований в педиатрической популяции не отмечено отличий от взрослой популяции в профиле нежелательных явлений и их тяжести.

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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Специальных исследований взаимодействия моксифлоксацина с другими лекарственными средствами не проводилось. В связи с низкой системной концентрацией после местного применения в виде инстилляций взаимодействие с другими лекарственными средствами маловероятно.

Особые указания:

У пациентов, получавших препараты хинолонового ряда для системного применения, могут наблюдаться тяжелые, в отдельных случаях смертельные реакции повышенной чувствительности (анафилаксия), в ряде случаев после приема первой дозы. Некоторые реакции сопровождались коллапсом, потерей сознания, отеком Квинке (включая отек гортани, глотки или лица), обструкцией дыхательных путей, одышкой, крапивницей и кожным зудом.

В случае развития аллергической реакции применение препарата необходимо прекратить. Тяжелые острые реакции гиперчувствительности на моксифлоксацин и другие компоненты препарата могут потребовать немедленного проведения реанимационных мероприятий: по показаниям могут быть проведены кислородотерапия с контролем проходности дыхательных путей.

При длительном применении препарата возможен избыточный рост восприимчивых микроорганизмов, в т.ч. грибов. В случае возникновения суперинфекции необходимо отменить препарат и назначить соответствующую терапию. Воспаление и разрыв сухожилий отмечались при системном применении фторхинолонов, преимущественно у пожилых пациентов, а также у пациентов, получавших кортикостероиды наряду с фторхинолонами. Несмотря на то, что системные концентрации моксифлоксацина после местного применения в офтальмологии значительно ниже таковых при пероральном применении, следует прекратить прием препарата при появлении первых признаков воспаления сухожилий.

Отсутствует достаточный объем данных для вынесения заключения об эффективности и безопасности применения препарата Белмокси в лечении бактериального конъюнктивита у новорожденных, в связи с чем применение у пациентов этой возрастной категории не рекомендуется.

Белмокси не рекомендуется для профилактического применения или эмпирического лечения гонококкового конъюнктивита, в т.ч. в терапии гонококковой офтальмии новорожденных, в связи с наличием большого количества резистентных к моксифлоксацину штаммов *Neisseria gonorrhoeae*. Пациенты с инфекционными заболеваниями глаза, вызванными *Neisseria gonorrhoeae*, должны получать соответствующую системную терапию.

Не рекомендуется применение препарата Белмокси в лечении инфекционных заболеваний органа зрения, вызванных *Chlamydia trachomatis* у пациентов в возрасте до 2 лет, поскольку отсутствуют сведения об изучении препарата у данной категории пациентов. Применение препарата Белмокси у пациентов старше 2 лет с глазными заболеваниями, вызванными *Chlamydia trachomatis*, должно сочетаться с системной терапией. При офтальмии новорожденных пациенты должны получать соответствующее их состоянию лечение; так, при развитии конъюнктивитов хламидийной и гонорейной этиологии таким видом лечения будет системная терапия. При наличии инфекционных заболеваний переднего отрезка глазного яблока не рекомендуется ношение контактных линз.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами:

Как и в случае инстилляций других лекарственных средств, возможно временное затуманивание зрения после применения препарата. До восстановления четкости зрительного восприятия не рекомендуется управлять автомобилем и другими механизмами.

Форма выпуска:

Глазные капли 5 мл во флаконе. Один флакон вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С и в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.