УТВЕРДЖЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
23.05.06 № 309
Регистрационное удостоверение
№ UA/4554/01/01

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
БИГАФЛОН
(BIGAFLON)

Общая характеристика:
международное и химическое названия: gatifloxacin; (±)-1-циклопропил-6-фтор-1,4-дигидро-8-метокси-7-(3-метил-1-пиперазинил)-4-оксо-3-хинолкарбоновой кислоты 1,5 гидрохлорид;
основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка желтовато-зеленоватого цвета, чуть опалесцирующая жидкость без запаха, соленоватая на вкус.
состав: 100 мл раствора содержат 0,4 г гатифлоксацина;
вспомогательные вещества: натрия хлорид, гидроксид натрия или кислота хлористоводородная, вода для инъекций.

Форма випуска. Раствор для инфузий.

Фармакотерапевтическая группа. Антибактериальное средство для системного применения, производное фторхинолона. Код АТС J01M A16.

Фармакологические свойства.
Фармакодинамика. Бигафлон как противомикробное средство группы фторхинолонов обладает широким спектром антибактериального действия. Высокоактивен в отношении грамотрицательных и грамположительных бактерий, а также внутриклеточных микроорганизмов E. Coli, Salmonella spp., Shigella spp., Klebsiella spp., Proteus spp., Pseudomonas spp., Enterobacter spp., Serratia spp., Citrobacter spp., Hafnia spp., Yersenia spp., Staphilococcus spp., Streptococcos spp., Neisseria spp., Haemophilus influenzae, Brucella spp., Vibrio spp., Providencia spp., Chlamydia spp., Campylobacter spp., Aeromonas spp., Plesiomonas spp. Гатифлоксацин также эффективен по отношению к бактериям, продуцирующим бета-лактамазы, в том числе неферментирующим бактериям - возбудителям нозокомиальной инфекции, а также атипичным микроорганизмам, таким как Chlamydia Pneumoniae, Chlamydia. Trahomatis, M. Pneumoniae, L. Pneumophila, Ureaplasma. Кроме того, к Гатифлоксацину чувствительны такие возбудители, как микобактерии, H. Pylori, анаэробы.
Treponema palladium не чувствительна к Бигафлону.
Механизм бактерицидного действия Бигафлона связан з ингибицией бактериального фермента ДНК-гиразы и топоизомеразы IV типа, которая блокирует деление клеток и приводит бактерии к гибели.
Фармакокинетика. Бигафлон хорошо проникает в органы и ткани, образовывая высокие концентрации в слюне, мокроте, бронхиальной жидкости, легких, желчи, желчном пузыре простате, моче, коже, костях. Фармакокинетика Гатифлоксацина является линейной в диапазоне доз от 200 до 800 мг, которые ввдятся в течение 14 дней. Равновесное состояние достигается на третий день приема препарата. Средняя максимальная и минимальная концентрация в плазме крови в равновесном состоянии при введении 400 мг 1 раз в сутки составляет, соответственно, 4,6 г/мл и 0,4 г/мл.

Около 20% препарата связывается с белками плазмы крови. Пик концентрации Бигафлона в плазме крови (после внутривенного введения 200 мг препарата в течение 30 минут) наступает сразу. Период полувыведения препарата составляет 7-14 ч и не зависит от дозы. Свыше 70% препарата выводится с мочой в течение 48 ч. Менее 1% выводится с мочой в виде этилендиаминового и метилендиаминового метаболита, 5% выводится с калом. Почечный клиренс независимо от дозы составляет 124-161 мл/мин.

Показания к применению. Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами: инфекции уха, горла, дыхательных путей, кожи и мягких тканей, органов брюшной полости, почек, мочевыводящих путей; при гинекологических инфекциях, остеомиелите, а также при септицемии, гонорее, туберкулезе, дизентерии, сальмонеллезе. Предоперационная профилактика и послеоперационное лечение хирургических инфекций у больных со сниженным иммунитетом.

Способ применения и дозы. Бигафлон вводят в дозе 400 мг 1 раз в сутки при клиренсе креатинина ≥ 40 мл/мин. При хронических бронхитах в фазе обострения вводят 400 мг (100 мл) препарата 1 раз в сутки в течение 7 - 10 дней. При острых синуситах – 400 мг (100 мл) препарату 1 раз в сутки в течение 10 дней. При негоспитальной пневмонии – 400 мг (100 мл) препарату 1 - 2 раза в сутки в течение 7 - 14 дней. При неосложненных инфекциях мочевых путей - 400 мг препарата однократно или по 200 мг в течение 3 дней, а при осложненных – 400 мг 1 раз в сутки в течение 7 - 10 дней. Для лечения инфекций кожи и мягких тканей рекомендованная доза - 200 мг в течение 5 - 7 дней. Для лечения туберкулеза, в зависимости от формы и тяжести течения заболевания, назначают по 800 мг препарата один раз в сутки. Поскольку Гатифлоксацин виделяется преимущественно почками, пациентам с клиренсом креатинина < 40 мл/мин, включительно с пациентами, находящимися на длительном перитонеальном амбулаторном гемодиализе, необходима коррекция дозы в следующем рекомендованном режиме:

Клиренс креатинина	**Начальная доза в мг/сут**	**Последующая доза в мг/сут**
≥ 40 мл/мин.	400 мг	200 мг ежедневно
< 40 мл/ мин	400 мг	200 мг ежедневно
< 10 мл/ мин (включая гемодиализ)	400 мг	200 мг ежедневно
Длительный амбулаторный перитонеальный диализ	400 мг	200 мг ежедневно

Побочное действие. *Со стороны желудочно-кишечного тракта:* иногда возникают тошнота, рвота, диарея, как проявление псевдомембранозного колита, гипербилирубинемия.
Со стороны центральной нервной системы: головная боль, утомляемость, чувство тревоги, общее угнетение, нарушение сна, головокружение, двигательное возбуждение, психозы.
Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, фотосенсибилизация, отек лица, голосовых связок.
Со стороны кроветворной системы: лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, эозинофилия, повышение активности АлАТ и АсАТ.
Со стороны мочевыделительной системы: нефротический синдром, иногда, острая почечная недостаточность.