Цефтриаксон



Код АТХ:

- J01DD04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Цефтриаксон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Порошок для приготовления раствора для в/в и в/м введения белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 фл.
цефтриаксон (в форме натриевой соли)	500 мг
-"-	1 г
-"-	2 г

Флаконы объемом 10 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (5) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (10) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (50) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Цефалоспориновый антибиотик III поколения широкого спектра действия. Действует бактерицидно, угнетая синтез клеточной стенки микроорганизмов. Устойчив в отношении β-лактамаз большинства грамположительных и грамотрицательных бактерий.

Активен в отношении грамположительных аэробных бактерий: Staphylococcus aureus (включая штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Staphylococcus epidermidis, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes, Streptococcus viridans; *грамотрицательных аэробных бактерий:* Acinetobacter calcoaceticus, Enterobacter aerogenes, Enterobacter cloacae, Escherichia coli, Haemophilus influenzae (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Haemophilus parainfluenzae, Klebsiella spp. (в т.ч. Klebsiella pneumoniae), Moraxella catarrhalis (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Morganella morganii, Neisseria gonorrhoeae (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Neisseria meningitidis, Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Serratia spp. (в т.ч. Serratia marcescens),

Pseudomonas aeruginosa (отдельные штаммы); *анаэробных бактерий:* Bacteroides fragilis, Clostridium spp. (кроме Clostridium difficile), Peptostreptococcus spp.

Обладает активностью in vitro в отношении большинства штаммов следующих микроорганизмов, хотя клиническое значение этого неизвестно: Citrobacter diversus, Citrobacter freundii, Providencia spp. (в т.ч. Providencia rettgeri), Salmonella spp. (в т.ч. Salmonella typhi), Shigella spp., Streptococcus agalactiae, Bacteroides bivius, Bacteroides melaninogenicus.

Метициллин-устойчивые стафилококки устойчивы и к цефалоспоринам, в т.ч. к цефтриаксону. Многие штаммы стрептококков группы D и энтерококков (в т.ч. Enterococcus faecalis) также устойчивы к цефтриаксону.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После в/м введения цефтриаксон быстро и полностью всасывается в системный кровоток. Хорошо проникает в ткани и жидкие среды организма: дыхательные пути, кости, суставы, мочевыводящий тракт, кожу, подкожную клетчатку и органы брюшной полости. При воспалении менингеальных оболочек хорошо проникает в спинномозговую жидкость. Биодоступность цефтриаксона при в/м введении составляет 100%. После в/м введения C_{max} достигается через 2-3 ч, при в/в введении - в конце инфузии.

При в/м введении цефтриаксона в дозе 500 мг и 1 г C_{max} в плазме крови составляет 38 мкг/мл и 76 мкг/мл соответственно, при в/в введении в дозе 500 мг, 1 г и 2 г - 82 мкг/мл, 151 мкг/мл и 257 мкг/мл соответственно. У взрослых через 2-24 ч после введения препарата в дозе 50 мг/кг концентрация в спинномозговой жидкости во много раз превосходит МПК для наиболее распространенных возбудителей менингита.

Равновесное состояние устанавливается в течение 4 суток введения препарата.

Обратимое связывание с белками плазмы (альбуминами) составляет 83–95%.

V_d составляет 5.78-13.5 л (0.12-0.14 л/кг), у детей - 0.3 л/кг.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 6-9 ч. Плазменный клиренс – 0.58-1.45 л/ч, почечный клиренс – 0.32-0.73 л/ч.

У взрослых пациентов течение 48 ч 50-60% препарата выводится почками в неизмененном виде, 40-50% экскретируется с желчью в кишечник, где биотрансформируется в неактивный метаболит.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У новорожденных детей почками выводится около 70% препарата.

У новорожденных и у лиц пожилого возраста (в возрасте старше 75 лет), а также у пациентов с нарушениями функции почек и печени $T_{1/2}$ значительно увеличивается.

У пациентов, находящихся на гемодиализе при КК 0-5 мл/мин, $T_{1/2}$ составляет 14.7 ч; при КК 5-15 мл/мин - 15.7 ч; при КК 16-30 мл/мин - 11.4 ч; при КК 31-60 мл/мин - 12.4 ч.

У детей с менингитом $T_{1/2}$ после в/в введения в дозе 50-75 мг/кг составляет 4.3-4.6 ч.

Показания к применению:

Бактериальные инфекции, вызванные чувствительными микроорганизмами:

— инфекции органов брюшной полости (перитонит, воспалительные заболевания ЖКТ, желчевыводящих путей, в т.ч. холангит, эмпиема желчного пузыря);

— заболевания верхних и нижних отделов дыхательных путей (в т.ч. пневмония, абсцесс легких, эмпиема плевры);

— инфекции костей и суставов;

— инфекции кожи и мягких тканей;

— инфекции мочевыводящих путей (в т.ч. пиелонефрит);

— бактериальный менингит;

— эндокардит;

— сепсис;

— гонорея;

— сифилис;

— мягкий шанкр;

— болезнь Лайма (боррелиоз);

— брюшной тиф;

— сальмонеллез и сальмонеллоносительство;

— инфицированные раны и ожоги.

Профилактика послеоперационной инфекции.

Инфекционные заболевания у лиц с ослабленным иммунитетом.

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Брюшной тиф
- Гонорея
- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Менингит
- Ожоги
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Плеврит
- Пневмония
- Раны
- Сальмонеллез
- Сепсис
- Сифилис
- Холангит
- Эмпиема
- Эмпиема желчного пузыря
- Эмпиема плевры
- Эндокардит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим цефалоспоринам, пенициллинам, карбапенемам.

С *осторожностью* назначают препарат новорожденным детям с гипербилирубинемией, недоношенным детям, при почечной и/или печеночной недостаточности, НЯК, энтерите или колите, связанном с применением антибактериальных препаратов, при беременности, в период лактации.

Способ применения и дозы:

Препарат вводят в/м и в/в (струйно или капельно).

Для **взрослых и детей старше 12 лет** доза составляет 1-2 г 1 раз/сут или по 0.5-1 г каждые 12 ч. Максимальная суточная доза - 4 г.

Для **новорожденных (до возраста 2 недели)** доза составляет 20-50 мг/кг/сут.

Для **грудных детей и детей до 12 лет** суточная доза составляет 20-80 мг/кг. У **детей с массой тела 50 кг и более** применяют дозы для взрослых.

Дозу более 50 мг/кг массы тела необходимо назначать в виде в/в инфузии в течение 30 мин. Длительность курса лечения зависит от характера и тяжести заболевания.

При *бактериальном менингите* у **грудных детей и детей младшего возраста** доза составляет 100 мг/кг 1 раз/сут.

Максимальная суточная доза – 4 г. Продолжительность терапии зависит от вида возбудителя и может составлять от 4 дней при менингите, вызванном Neisseria meningitidis, до 10-14 дней при менингите, вызванном чувствительными штаммами Enterobacteriaceae.

Для *лечения гонореи* доза составляет 250 мг в/м, однократно.

Для *профилактики послеоперационных инфекционных осложнений* вводят однократно в дозе 1-2 г (в зависимости от степени опасности инфицирования) за 30-90 мин до начала операции. При операциях на толстой и прямой кишке рекомендуется дополнительное введение препарата из группы 5-нитроимидазолов.

Детям при *инфекции кожи и мягких тканей* препарат назначают в суточной дозе 50-75 мг/кг массы тела 1 раз/сут или 25-37.5 мг/кг каждые 12 ч, но не более 2 г/сут. При *тяжелых инфекциях другой локализации* - в дозе 25-37.5 мг/кг каждые 12 ч, но не более 2 г/сут.

При *среднем отите* препарат вводят в/м в дозе 50 мг/кг массы тела, но не более 1 г.

У **пациентов с нарушениями функции почек** коррекция дозы требуется только при **почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 10 мл/мин)**, в этом случае суточная доза цефтриаксона не должна превышать 2 г.

Правила приготовления и введения инъекционных растворов

Инъекционные растворы следует готовить непосредственно перед применением.

Для приготовления раствора **для в/м инъекций** 500 мг препарата растворяют в 2 мл, а 1 г препарата - в 3.5 мл 1% раствора лидокаина. Рекомендуется вводить не более 1 г в одну ягодичную мышцу.

Для приготовления раствора **для в/в инъекций** 500 мг препарата растворяют в 5 мл, а 1 г препарата - в 10 мл стерильной воды для инъекций. Инъекционный раствор вводят в/в медленно в течение 2-4 мин.

Для приготовления раствора **для в/в инфузий** 2 г препарата растворяют в 40 мл одного из следующих растворов, не содержащих кальций: 0.9% раствора натрия хлорида, 5-10% раствор декстрозы (глюкозы), 5% раствор левулозы. Препарат в дозе 50 мг/кг и более следует вводить в/в капельно, в течение 30 мин.

Свежеприготовленные растворы цефтриаксона физически и химически стабильны в течение 6 ч при комнатной температуре.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение.

Со стороны мочевыделительной системы: олигурия, нарушение функции почек, глюкозурия, гематурия, гиперкреатининемия, повышение содержания мочевины.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, нарушение вкуса, метеоризм, стоматит, глоссит, диарея, псевдомембранозный энтероколит, псевдохолелитиаз (сладж-синдром), дисбактериоз, боль в животе, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, гипербилирубинемия.

Со стороны системы кроветворения: анемия, лейкопения, лейкоцитоз, лимфопения, нейтропения, гранулоцитопения, тромбоцитопения, тромбоцитоз, базофилия, гемолитическая анемия.

Со стороны свертывающей системы крови: носовые кровотечения, увеличение (уменьшение) протромбинового времени.

Аллергические реакции: крапивница, сыпь, зуд, экссудативная многоформная эритема, лихорадка, озноб, отеки, эозинофилия, анафилактический шок, сывороточная болезнь, бронхоспазм.

Прочие: суперинфекция (в т.ч. кандидоз).

Местные реакции: при в/в введении - флебиты, болезненность по ходу вены; при в/м введении - болезненность в месте введения.

Передозировка:

Для выведения препарата из организма гемодиализ неэффективен. При наличии клинических проявлений передозировки рекомендуется проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Цефтриаксон и аминогликозиды обладают синергизмом в отношении многих грамотрицательных бактерий.

При совместном применении с НПВС и другими антиагрегантами повышается вероятность возникновения кровотечений.

При одновременном применении с "петлевыми" диуретиками и другими нефротоксичными препаратами возрастает риск нефротоксического действия.

Препарат несовместим с этанолом.

Фармацевтическое взаимодействие

Фармацевтически несовместим с растворами, содержащими другие антибиотики.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении препарата следует учитывать риск развития анафилактического шока и необходимость проведения соответствующей неотложной терапии.

В исследованиях in vitro показано, что цефтриаксон (подобно другим цефалоспоринам) способен вытеснять билирубин, связанный с альбумином сыворотки крови. Поэтому у новорожденных с гипербилирубинемией и, особенно, у недоношенных новорожденных, применение цефтриаксона требует еще большей осторожности.

При сочетании почечной недостаточности тяжелой степени и тяжелой печеночной недостаточности у пациентов, находящихся на гемодиализе, следует регулярно определять концентрацию препарата в плазме.

При длительном лечении необходимо регулярно контролировать картину периферической крови, показатели функционального состояния печени и почек.

В редких случаях при УЗИ желчного пузыря отмечаются затемнения, которые исчезают после прекращения лечения. Даже если это явление сопровождается болями в правом подреберье, рекомендуется продолжение терапии Цефтриаксоном и проведение симптоматического лечения.

Пожилым и ослабленным пациентам может потребоваться назначение витамина К.

Во время лечения противопоказано употребление алкоголя, т.к. возможны дисульфирамоподобные эффекты (гиперемия лица, спазм в животе и в области желудка, тошнота, рвота, головная боль, снижение АД, тахикардия, одышка).

При нарушениях функции почек

При **тяжелой степени почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин)** суточная доза цефтриаксона не должна превышать 2 г.

При **выраженных нарушениях функции почек** , а также у **больных, находящихся на гемодиализе,** необходимо следить за концентрацией цефтриаксона в плазме крови, т.к. у них может снижаться скорость его выделения.

При нарушениях функции печени

При **выраженных нарушениях функции печени** необходимо следить за концентрацией цефтриаксона в плазме крови, т.к. у них может снижаться скорость его выделения.

Применение в пожилом возрасте

Возможно применение по показаниям. Следует оценить функцию почек.

Применение в детском возрасте

С *осторожностью* назначают препарат новорожденным детям с гипербилирубинемией, недоношенным детям. Препарат применяют у детей более старшего возраста по показаниям и в рекомендуемых дозах.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ceftriakson