Лоразидим



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Порошок для приготовления раствора для д/в/в и в/м введения кристаллический, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета.

	1 фл.
цефтазидим (в форме пентагидрата)	500 мг

Вспомогательные вещества: натрия карбонат.

Растворитель: вода д/и - 5 мл.

Флаконы объемом 20 мл (1) в комплекте с растворителем (амп. 1 шт.) или без него - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (12) - пачки картонные.

Порошок для приготовления раствора для д/в/в и в/м введения кристаллический, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета.

	1 фл.
цефтазидим (в форме пентагидрата)	1 г

Вспомогательные вещества: натрия карбонат.

Растворитель: вода д/и - 5 мл.

Флаконы объемом 20 мл (1) в комплекте с растворителем (амп. 1 шт.) или без него - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (12) - пачки картонные.

Порошок для приготовления раствора для д/в/в и в/м введения кристаллический, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета.

	1 фл.
цефтазидим (в форме пентагидрата)	2 г

Вспомогательные вещества: натрия карбонат.

Растворитель: вода д/и - 10 мл.

Флаконы объемом 20 мл (1) в комплекте с растворителем (амп. 1 шт.) или без него - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (12) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибактериальный препарат группы цефалоспоринов III поколения широкого спектра действия. Оказывает бактерицидное действие, нарушая синтез клеточной стенки микроорганизмов. Устойчив к действию большинства β-

лактамаз.

Препарат *активен в отношении грамотрицательных бактерий:* Haemophilus influenzae, Haemophilus parainfluenzae (включая штаммы, устойчивые к ампициллину), Neisseria spp. (в т.ч. Neisseria gonorrhoeae), Citrobacter spp., Enterobacter spp., Escherichia coli, Klebsiella spp. (в т.ч. Klebsiella pneumoniae), Morganella spp. (в т.ч. Morganella morganii), Proteus spp. (в т.ч. Proteus mirabilis /в т.ч. индол-положительный/, Proteus vulgaris), Providensia spp. (в т.ч. Providensia rettgeri), Serratia spp., Acinetobacter spp., Pasteurella multocida, Salmonella spp., Shigella spp., Yersinia enterocolitica; *грамположительных бактерий:* Micrococcus spp., Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus aureus, Streptococcus mitis, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes группы A, Streptococcus viridans, за исключением Streptococcus faecalis); штаммов, чувствительных к метициллину (Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis); *анаэробных бактерий:* Bacteroides spp. (большинство штаммов Bacterioides fragilis - резистентны), Clostridium perfmgens, Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp. и Propionobacterium spp.

Препарат *высокоактивен в отношении* Pseudomonas aeruginosa и возбудителей внутригоспитальных инфекций.

Препарат *не активен в отношении метициллин-резистентных штаммов* Campilobacter spp., Chlamydia spp., Clostridium difficile, Enterococcus spp., Listeria spp. (в т.ч. Listeria monocytogenes), Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis, Streptococcus faecalis.

Фармакокинетика

Всасывание

T_{max} при в/м введении достигается через 1 ч, при в/в введении - к концу инфузии. C_{max} при в/м введении препарата в дозе 500 мг или 1 г соответственно составляет 17 мкг/мл и 39 мкг/мл, при в/в введении - соответственно 42 мкг/мл и 69 мкг/мл. Концентрация препарата, равная 4 мкг/мл, сохраняется в течение 6-8 ч, терапевтическая концентрация в плазме крови сохраняется в течение 8-12 ч.

Распределение

После введения препарат быстро распределяется в организме человека и достигает терапевтических концентраций в большинстве тканей и жидкостей, включая синовиальную, перикардиальную и перитонеальную жидкость, а также в желчи, мокроте и моче. Распределение также происходит в костях, миокарде, желчном пузыре, коже и мягких тканях в концентрациях, достаточных для лечения инфекционных заболеваний, особенно при воспалительных процессах, усиливающих диффузию препарата. Плохо проникает через неповрежденный ГЭБ, но достигаемый препаратом в спинномозговой жидкости терапевтический уровень достаточен для лечения менингита.

Обратимо связывается с белками плазмы (менее 15%), причем бактерицидным действием обладает только в свободном виде. Степень связывания с белками не зависит от концентрации. V_d составляет 0.21–0.28 л/кг. Препарат накапливается в мягких тканях, почках, легких, костях, суставах, серозных полостях.

Метаболизм и выведение

Препарат не метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ при нормальной функции почек – 1.8 ч. Выводится в неизмененном виде почками до 80-90% (70% введенной дозы выводится в первые 4 ч) в течение суток путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции в равной степени.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ при нарушениях функции почек – 2.2 ч.

При нарушениях функции печени не отмечено изменений фармакокинетики препарата.

Показания к применению:

— менингит;

— сепсис (септицемия);

— тяжелые гнойно-септические состояния;

— инфекции костей и суставов (септический артрит, остеомиелит, бактериальный бурсит);

— инфекции дыхательных путей (острый и хронический бронхит, инфицированные бронхоэктазии, пневмонии, вызванная грамотрицательными бактериями, абсцесс легких, эмпиема плевры);

— инфекции мочевыводящих путей (острый и хронический пиелонефрит, пиелит, простатит, цистит, уретрит /только бактериальный/, абсцесс почки);

— инфекции кожи и мягких тканей (мастит, раневые инфекции, кожные язвы, флегмона, рожа);

— инфицированные ожоги;

— инфекции ЖКТ, брюшной полости и желчных путей (перитонит, энтероколит, забрюшинные абсцессы, дивертикулит, воспаления органов малого таза, холецистит, холангит, эмпиема желчного пузыря);

— инфекции женских половых органов;

— инфекции уха, горла, носа (средний отит, синусит, мастоидит);

— гонорея (особенно при повышенной чувствительности к антибактериальным препаратам из группы пенициллинов).

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Артрит
- Артроз
- Бронхит
- Бронхоэктазия
- Бурсит
- Воспаление
- Гонорея
- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Мастит
- Менингит
- Ожоги
- Остеомиелит
- Отит
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Плеврит
- Пневмония
- Простатит
- Рожа
- Сепсис
- Синусит
- Уретрит
- Флегмона
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Цистит
- Эмпиема
- Эмпиема желчного пузыря
- Эмпиема плевры
- Энтерит

Противопоказания:

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к цефалоспоринам и пенициллинам.

Способ применения и дозы:

Препарат применяют только парентерально. Доза препарата устанавливается индивидуально, с учетом тяжести течения заболевания, локализации инфекции и чувствительности возбудителя, возраста, массы тела, функции почек.

Взрослым и подросткам при *осложненных инфекциях мочевыводящих путей* препарат назначают в/м или в/в по 0.5-1 г каждые 8-12 ч.

При *неосложненной пневмонии и инфекциях кожи* в/м или в/в по 0.5-1 г каждые 8 ч.

При *муковисцидозе, инфекциях легких, вызванных Pseudomonas spp.,* - 100-150 мг/кг массы тела/сут, кратность введения - 3 раза/сут (применение дозы до 9 г/сут у таких пациентов не вызывало осложнений).

При *инфекциях костей и суставов* - в/в по 2 г каждые 12 ч.

При *крайне тяжелых или угрожающих жизни инфекциях* - в/в по 2 г каждые 8 ч.

После начальной нагрузочной дозы 1 г **пациентам с нарушением функции почек (включая пациентов, которым проводят диализ),** может потребоваться снижение дозы, как указано ниже.

Клиренс креатинина	Доза
>50 мл/мин (0.83 мл/сек)	обычная доза для взрослых и подростков
35-50 мл/мин (0.52-0.83 мл/сек)	по 1 г каждые 12 ч
16-30 мл/мин (0.27-0.50 мл/сек)	по 1 г каждые 24 ч
6-15 мл/мин (0.1-0.25 мл/сек)	по 500 мг каждые 24 ч
<5 мл/мин (0.08 мл/сек)	по 500 мг каждые 48 ч
Пациенты, которым проводят гемодиализ	по 1 г после каждого сеанса гемодиализа
Пациенты, которым проводят перитонеальный диализ	по 500 мг каждые 24 ч

Эти показатели ориентировочны. У таких пациентов рекомендуется контролировать уровень препарата в сыворотке, который не должен превышать 40 мг/л.

Период полувыведения препарата во время гемодиализа составляет 3-5 ч. Соответствующую дозу препарата следует повторять после каждого периода диализа.

При перитонеальном диализе препарат можно включать в диализную жидкость в дозе 125-250 мг на 2 л диализной жидкости.

Коррекции дозы **пациентам с нарушениями функции печени** не требуется.

Детям в возрасте до 1 мес назначают в виде в/в инфузии в дозе 30 мг/кг массы тела/сут (кратность введения – 2 раза); **детям от 2 мес до 12 лет** назначают в виде в/в инфузии в дозе 30-50 мг/кг/сут (кратность введения – 3 раза).

Детям со сниженным иммунитетом, муковисцидозом, менингитом препарат назначают в дозе до 150 мг/кг/сут каждые 12 ч.

Максимальная суточная доза для детей - 6 г.

Правила приготовления растворов

Первичное разведение

Количество препарата	В/м введение	В/в введение
500 мг	1.5 мл воды для инъекций	5 мл воды для инъекций
1 г или 2 г	3 мл воды для инъекций	10 мл воды для инъекций

Вторичное разведение

Для в/в капельного введения полученный вышеописанным способом раствор препарата дополнительно разводят в 50-100 мл одного из следующих растворителей, предназначенных для в/в введения (0.9% раствор натрия хлорида, раствор Рингера, 5% или 10% раствор декстрозы, 5% раствор декстрозы с 0.9% раствором натрия хлорида).

Для вторичного разведения следует использовать только свежеприготовленный раствор.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея или запор, метеоризм, боль в животе, дисбактериоз, нарушение функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз, ЩФ, гиперкреатининемия); редко – стоматит, глоссит, псевдомембранозный энтероколит.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, гранулоцитопения, тромбоцитопения, гемолитическая анемия, гипокоагуляция.

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек (азотемия, повышение содержания мочевины в

крови), олигурия, анурия.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение.

Местные реакции: при в/в введении - флебит, болезненность по ходу вены; при в/м введении - болезненность и инфильтрат.

Аллергические реакции: крапивница, озноб или лихорадка, сыпь, зуд; редко – бронхоспазм, эозинофилия, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), ангионевротический отек, анафилактический шок.

Прочие: носовые кровотечения, кандидоз, суперинфекция.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, парестезии, головная боль, судорожные припадки, отклонения в результатах лабораторных анализов.

Лечение: проводят симптоматическую и поддерживающую терапию. В случае тяжелой передозировки возможно применение гемодиализа. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности и в период лактации препарат применяют только в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

"Петлевые" диуретики, аминогликозиды, ванкомицин, клиндамицин снижают клиренс цефтазидима, в результате чего возрастает риск нефротоксического действия.

Фармацевтическое взаимодействие

Препарат фармацевтически несовместим с аминогликозидами, гепарином, ванкомицином.

Нельзя использовать раствор натрия бикарбоната в качестве растворителя.

При концентрации от 1 до 40 мг/мл цефтазидим фармацевтически совместим со следующими растворами: натрия хлорид 0.9%, натрия лактат, раствор Хартмана, декстроза 5%, натрия хлорид 0.225% и декстроза 5%, натрия хлорид 0.45% и декстроза 5%, натрия хлорид 0.9% и декстроза 5%, натрия хлорид 0.18% и декстроза 4%, декстроза 10%, декстран 40 (10%) в растворе натрия хлорида 0.9%, декстран 40 (10%) в растворе декстрозы 5%, декстран 70 (6%) в растворе натрия хлорида 0.9%, декстран 70 (6%) в растворе декстрозы 5%.

При концентрации от 0.05 до 0.25 мг/мл цефтазидим совместим с раствором для интраперитонеального диализа (лактат).

Для в/м введения цефтазидим может быть разведен раствором лидокаина гидрохлорида 0.5% или 1%. Оба компонента сохраняют активность, если цефтазидим добавляют к следующим растворам (концентрация цефтазидима 4 мг/мл): гидрокортизон (гидрокортизона натрия фосфат) 1 мг/мл в растворе натрия хлорида 0.9% или растворе декстрозы 5%, цефуроксим (цефуроксим натрия) 3 мг/мл в растворе натрия хлорида 0.9%; клоксациллин (клоксациллин натрия) 4 мг/мл в растворе натрия хлорида 0.9%; калия хлорид 10 мэкв/л или 40 мэкв/л в растворе натрия хлорида 0.9%.

При смешивании раствора цефтазидима (500 мг в 1.5 мл воды для инъекций) и метронидазола (500 мг/100 мл) оба компонента сохраняют свою активность.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует назначать препарат при кровотечениях в анамнезе, заболеваниях ЖКТ в анамнезе (особенно неспецифический язвенный колит).

У пациентов с зарегистрированной в анамнезе реакцией гиперчувствительности к пенициллинам отмечалась неполная перекрестная реакция гиперчувствительности к цефалоспоринам (3-7%). Хотя у многих пациентов с аллергией на пенициллин, проявляющейся в виде сыпи, цефалоспорины применяли без нежелательных последствий, рекомендуется соблюдать осторожность при назначении препарата Лоразидим данной категории пациентов.

Цефалоспорины могут препятствовать синтезу витамина К вследствие подавления кишечной флоры, что может вызвать снижение уровня зависимых от витамина К факторов свертывания крови и в редких случаях привести к гипопротромбинемии и кровотечению. Назначение витамина К устраняет гипопротромбинемию. У тяжелых, пожилых и ослабленных больных, у пациентов с нарушением функции печени и у лиц с неполноценным питанием риск развития кровотечений наиболее высок.

У некоторых пациентов во время или после применения цефалоспоринов может развиваться псевдомембранозный колит, вызываемый Clostridium difficile. В легких случаях достаточно отмены препарата, в более тяжелых случаях рекомендуется восстановление водно-солевого и белкового баланса, при необходимости следует назначать метронидазол, бацитрацин, ванкомицин внутрь.

Использование в педиатрии

С осторожностью следует назначать препарат **новорожденным в возрасте до 1 мес.**

При нарушениях функции почек

После начальной нагрузочной дозы 1 г **пациентам с нарушением функции почек (включая пациентов, которым проводят диализ),** может потребоваться снижение дозы, как указано ниже.

Клиренс креатинина	Доза
>50 мл/мин (0.83 мл/сек)	обычная доза для взрослых и подростков
35-50 мл/мин (0.52-0.83 мл/сек)	по 1 г каждые 12 ч
16-30 мл/мин (0.27-0.50 мл/сек)	по 1 г каждые 24 ч
6-15 мл/мин (0.1-0.25 мл/сек)	по 500 мг каждые 24 ч
<5 мл/мин (0.08 мл/сек)	по 500 мг каждые 48 ч
Пациенты, которым проводят гемодиализ	по 1 г после каждого сеанса гемодиализа
Пациенты, которым проводят перитонеальный диализ	по 500 мг каждые 24 ч

Эти показатели ориентировочны. У таких пациентов рекомендуется контролировать уровень препарата в сыворотке, который не должен превышать 40 мг/л.

Период полувыведения препарата во время гемодиализа составляет 3-5 ч. Соответствующую дозу препарата следует повторять после каждого периода диализа.

При перитонеальном диализе препарат можно включать в диализную жидкость в дозе 125-250 мг на 2 л диализной жидкости.

При нарушениях функции печени

Коррекции дозы **пациентам с нарушениями функции печени** не требуется.

Применение в детском возрасте

С осторожностью следует назначать препарат **новорожденным в возрасте до 1 мес.**

Детям в возрасте до 1 мес назначают в виде в/в инфузии в дозе 30 мг/кг массы тела/сут (кратность введения – 2 раза); **детям от 2 мес до 12 лет** назначают в виде в/в инфузии в дозе 30-50 мг/кг/сут (кратность введения – 3 раза).

Детям со сниженным иммунитетом, муковисцидозом, менингитом препарат назначают в дозе до 150 мг/кг/сут каждые 12 ч.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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