

Медаксон



Код АТХ:

- [J01DD04](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Цефтриаксон](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС](#) [VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Порошок для приготовления раствора для в/в и в/м введения от белого до белого с желтоватым оттенком цвета, слегка гигроскопичен.

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

Флаконы (1) - коробки картонные.

Флаконы (100) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Цефалоспориновый антибиотик III поколения для парентерального применения. Обладает бактерицидным действием, угнетает синтез клеточной мембраны, *in vitro* подавляет рост большинства грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов. Цефтриаксон устойчив к действию β -лактамаз (как пенициллиназы, так и цефалоспориназы, продуцируемых большинством грамположительных и грамотрицательных бактерий).

Препарат активен в отношении грамположительных микроорганизмов: *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus A* (*Streptococcus pyogenes*), *Streptococcus V* (*Streptococcus agalactiae*), *Streptococcus viridans*, *Streptococcus bovis*.

Препарат активен в отношении грамотрицательных микроорганизмов: *Aeromonas* spp., *Alcaligenes* spp., *Branhamella catarrhalis*, *Citrobacter* spp., *Enterobacter* spp. (некоторые штаммы устойчивы), *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella* spp. (в т.ч. *Klebsiella pneumoniae*), *Moraxella* spp., *Morganella morganii*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Plesiomonas shigelloides*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Providencia* spp.,

Pseudomonas aeruginosa (некоторые штаммы устойчивы), *Salmonella* spp., *Vibrio* spp., (в т.ч. *Vibrio cholerae*), *Yersinia* spp., (в т.ч. *Yersinia Enterocolitica*). Многие штаммы перечисленных грамотрицательных микроорганизмов, которые в присутствии других антибиотиков, например, пенициллинов, цефалоспоринов первых поколений и аминогликозидов, устойчиво размножаются, чувствительны к цефтриаксону. *Treponema pallidum* чувствительна к цефтриаксону как *in vitro*, так и в опытах на животных. По клиническим данным при первичном и вторичном сифилисе отмечают хорошую эффективность цефтриаксона.

Препарат *активен в отношении анаэробных микроорганизмов*: *Bacteroides* spp. (в т.ч. некоторых штаммов *Bacteroides fragilis*), *Clostridium* spp. (в т.ч. *Clostridium difficile*), *Fusobacterium* spp. (кроме *Fusobacterium mostiferum*, *Fusobacterium varium*), *Peptococcus* spp., *Peptostreptococcus* spp.

К препарату *устойчивы*: штаммы *Staphylococcus*, устойчивые к метициллину; большинство штаммов энтерококков (например, *Streptococcus faecalis*); некоторые штаммы многих *Bacteroides* (например, *Bacteroides fragilis*), вырабатывающие β-лактаму (для определения чувствительности микроорганизмов необходимо применять диски, содержащие цефтриаксон, т.к. показано, что *in vitro* к классическим цефалоспорином определенные штаммы патогенов могут быть устойчивы).

Фармакокинетика

Всасывание

Значения AUC при в/в и в/м введении совпадают. Это означает, что биодоступность цефтриаксона при в/м введении составляет 100%.

Распределение

При парентеральном введении цефтриаксон хорошо проникает в ткани и жидкости организма.

При в/в введении цефтриаксон быстро диффундирует в интерстициальную жидкость, где бактерицидное действие сохраняется в течение 24 ч.

Цефтриаксон обратимо связывается с альбумином и это связывание обратно пропорционально концентрации: например, при концентрации препарата в сыворотке крови менее 100 мг/л связывание цефтриаксона с белками составляет 95%, а при концентрации 300 мг/л - только 85%. Благодаря более низкому содержанию альбуминов в интерстициальной жидкости концентрация цефтриаксона в ней выше, чем в сыворотке крови.

Выведение

У здоровых взрослых испытуемых $T_{1/2}$ составляет около 8 ч.

У взрослых 50-60% цефтриаксона выводится в неизменном виде с мочой, а 40-50% - также в неизменном виде с желчью. Под влиянием кишечной флоры цефтриаксон превращается в неактивный метаболит.

У новорожденных $T_{1/2}$ составляет до 8 дней, у пожилых людей старше 75 лет средний $T_{1/2}$ примерно в 2 раза больше.

У новорожденных примерно 70% введенной дозы выделяется почками.

При почечной недостаточности или при патологии печени у взрослых фармакокинетика цефтриаксона почти не изменяется, $T_{1/2}$ удлиняется незначительно. Если функция почек нарушена, увеличивается выделение с желчью, а если имеет место патология печени, то усиливается выведение цефтриаксона почками.

У новорожденных и у детей при воспалении мозговой оболочки цефтриаксон проникает в ликвор, при этом в случае бактериального менингита в среднем 17% от концентрации препарата в сыворотке крови диффундирует в спинномозговую жидкость, что примерно в 4 раза больше, чем при асептическом менингите. Через 24 ч после в/в введения цефтриаксона в дозе 50-100 мг/кг массы тела концентрация в спинномозговой жидкости превышает 1.4 мг/л. У взрослых больных менингитом через 2-25 ч после введения цефтриаксона в дозе 50 мг/кг концентрация цефтриаксона многократно превышала минимальную дозу, необходимую для подавления возбудителей менингита.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

- сепсис;
- менингит;
- инфекции брюшной полости (перитонит, воспалительные заболевания желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей);
- инфекции костей и суставов;

- инфекции кожи и мягких тканей;
- инфекции почек и мочевыводящих путей;
- инфекции дыхательных путей (в т.ч. пневмония);
- инфекции ЛОР-органов;
- инфекции половых органов (в т.ч. гонорея);
- инфекции у больных с пониженным иммунитетом.

Профилактика инфекций в послеоперационном периоде.

Относится к болезням:

- [Гонорея](#)
- [Инфекции](#)
- [Инфекции половых органов](#)
- [Менингит](#)
- [Перитонит](#)
- [Пневмония](#)
- [Сепсис](#)

Противопоказания:

- I триместр беременности;
- повышенная чувствительность к цефалоспорином и к пенициллинам.

С осторожностью назначать препарат при гипербилирубинемии у новорожденных, недоношенным детям, при почечной недостаточности, при печеночной недостаточности, НЯК, энтерите или колите, связанными с применением антибактериальных препаратов, во II и III триместрах беременности, в период лактации.

Способ применения и дозы:

Препарат применяют в/м и в/в.

Для **взрослых и для детей старше 12 лет** средняя суточная доза составляет 1-2 г 1 раз/сут (через 24 ч). В тяжелых случаях или при инфекциях, вызываемых умеренно чувствительными патогенами, разовая суточная доза может быть увеличена до 4 г.

Новорожденным при введении препарата 1 раз/сут рекомендуются следующие дозы: **в возрасте до 2 недель** - 20-50 мг/кг/сут (дозу 50 мг/кг массы тела превышать не рекомендуется в связи с незрелой ферментной системой новорожденных).

Для **грудных детей и детей в возрасте до 12 лет** суточная доза составляет 20-75 мг/кг; **детям с массой тела 50 кг и более** препарат назначают в дозах, предназначенных для взрослых. Препарат в дозе более 50 мг/кг массы тела следует назначать в виде в/в инфузии, по крайней мере, в течение 30 мин.

Продолжительность терапии зависит от течения заболевания.

При **бактериальном менингите у детей (включая новорожденных)** начальная доза составляет 100 мг/кг массы тела 1 раз/сут, максимальная доза - 4 г/сут. Как только удалось выделить патогенный микроорганизм и определить его чувствительность дозу необходимо соответственно уменьшить. Наилучшие результаты были достигнуты при следующих сроках терапии:

Возбудитель	Длительность терапии
<i>Neisseria meningitidis</i>	4 дня
<i>Haemophilus influenzae</i>	6 дней
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	7 дней
Чувствительные Enterobacteriaceae	10-14 дней

Для лечения гонореи, вызываемой как образующими, так и необразующими пенициллиназу штаммами,

рекомендуемая доза составляет 250 мг однократно в/м.

С целью профилактики в пред- и послеоперационном периоде перед инфицированными или предположительно инфицированными хирургическими вмешательствами, в зависимости от опасности инфекции, за 30-90 мин до операции рекомендуется однократное введение цефтриаксона в дозе 1-2 г.

У пациентов с нарушениями функции почек при КК более 10 мл/мин при условии нормальной функции печени нет необходимости уменьшать дозу цефтриаксона. При выраженной почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин) необходимо, чтобы суточная доза цефтриаксона не превышала 2 г.

У больных с нарушенной функцией печени при условии сохранения функции почек, дозу цефтриаксона уменьшать также нет необходимости. В случаях одновременного наличия тяжелой патологии печени и почек концентрацию цефтриаксона в сыворотке крови необходимо регулярно контролировать. У больных, находящихся на гемодиализе, дозу препарата после проведения этой процедуры изменять нет необходимости.

Правила приготовления растворов и введения препарата

Для в/м введения 1 г препарата необходимо развести в 3.5 мл 1% раствора лидокаина и ввести глубоко в ягодичную мышцу, рекомендуется вводить не более 1 г препарата в одну ягодичу. Раствор лидокаина никогда нельзя вводить в/в!

Для в/в инъекции 1 г препарата необходимо развести в 10 мл стерильной дистиллированной воды и вводить в/в медленно в течение 2-4 мин.

Для в/в инфузии 2 г порошка необходимо развести примерно в 40 мл раствора свободного от кальция, например: в 0.9% растворе натрия хлорида, в 5% растворе декстрозы, в 10% растворе декстрозы, 5% растворе фруктозы.

Продолжительность в/в инфузии, по крайней мере, 30 мин.

Побочное действие:

Аллергические реакции: крапивница, озноб или лихорадка, сыпь, зуд, редко - бронхоспазм, эозинофилия, полиморфная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), сывороточная болезнь, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея или запор, метеоризм, абдоминальные боли, нарушение вкуса, стоматит, глоссит, псевдомембранозный энтероколит, нарушение функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз; редко - ЩФ или билирубина, холестатическая желтуха), дисбактериоз.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, гранулоцитопения, лимфопения, тромбоцитоз, тромбоцитопения, гемолитическая анемия, гипокоагуляция, снижение концентрации плазменных факторов свертывания (II, VII, IX, X), удлинение протромбинового времени.

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек (азотемия, повышение содержания мочевины в крови, гиперкреатининемия, глюкозурия, цилиндрурия, гематурия), олигурия, анурия.

Местные реакции: флебит, болезненность по ходу вены, болезненность и инфильтрат в месте в/м введения.

Прочие: головная боль, головокружение, носовые кровотечения, кандидоз, суперинфекция.

Передозировка:

Симптомы: возможно усиление побочных эффектов.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Избыточно высокие концентрации цефтриаксона в плазме не могут быть понижены с помощью гемодиализа или перитонеального диализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

С осторожностью следует применять препарат во II и III триместрах беременности.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Между цефтриаксоном и аминогликозидами имеет место синергизм в отношении влияния на многие грамотрицательные бактерии. Хотя заранее предсказать усиление эффекта подобных комбинаций нельзя, в случаях тяжелых и угрожающих жизни инфекций (например, вызываемых *Pseudomonas aeruginosa*) обосновано их совместное назначение.

Цефтриаксон несовместим с этанолом.

НПВС и другие ингибиторы агрегации тромбоцитов повышают вероятность кровотечения.

При одновременном применении с "петлевыми" диуретиками и другими нефротоксичными препаратами возрастает риск развития нефротоксичности.

Фармацевтическое взаимодействие

В связи с фармацевтической несовместимостью цефтриаксона и аминогликозидов необходимо назначать их в рекомендуемых дозах отдельно.

Фармацевтически несовместим с растворами, содержащими другие антибиотики.

Нельзя смешивать в одном инфузионном флаконе или в одном шприце с другим антибиотиком (химическая несовместимость).

Особые указания и меры предосторожности:

При одновременной тяжелой почечной и печеночной недостаточности следует регулярно контролировать концентрацию препарата в плазме крови.

У больных, находящихся на гемодиализе, необходимо контролировать концентрацию цефтриаксона в плазме, т.к. в таких случаях возможно снижение скорости его выведения.

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 отмены препарата (даже если это явление сопровождается болями в правом подреберье, рекомендуют продолжение назначения антибиотика и проведение симптоматического лечения).

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

Несмотря на подробный сбор анамнеза, что является правилом и для других цефалоспориновых антибиотиков, нельзя исключить возможность развития анафилактического шока, который требует немедленной терапии - сначала в/в вводят эпинефрин, затем глюкокортикоиды.

Пожилым и ослабленным больным в период лечения может потребоваться назначение витамина К.

Использование в педиатрии

Исследования in vitro показали, что подобно другим цефалоспориновым антибиотикам цефтриаксон 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 нарушениях функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек при КК более 10 мл/мин при условии нормальной функции печени нет необходимости уменьшать дозу цефтриаксона. При **выраженной почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин)** необходимо, чтобы суточная доза цефтриаксона не превышала 2 г. У **больных, находящихся на гемодиализе**, дозу препарата после проведения этой процедуры изменять нет необходимости.

При нарушениях функции печени

У **больных с нарушенной функцией печени при условии сохранения функции почек** дозу цефтриаксона уменьшать также нет необходимости. В случаях **одновременного наличия тяжелой патологии печени и почек** концентрацию цефтриаксона в сыворотке крови необходимо регулярно контролировать.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым больным в период лечения может потребоваться назначение витамина К.

Применение в детском возрасте

Для **взрослых и для детей старше 12 лет** средняя суточная доза составляет 1-2 г 1 раз/сут (через 24 ч). В тяжелых случаях или при инфекциях, вызываемых умеренно чувствительными патогенами, разовая суточная доза может быть увеличена до 4 г.

Новорожденным при введении препарата 1 раз/сут рекомендуются следующие дозы: **в возрасте до 2 недель** - 20-50 мг/кг/сут (дозу 50 мг/кг массы тела превышать не рекомендуется в связи с незрелой ферментной системой новорожденных).

Для **грудных детей и детей в возрасте до 12 лет** суточная доза составляет 20-75 мг/кг; **детям с массой тела 50 кг и более** препарат назначают в дозах, предназначенных для взрослых. Препарат в дозе более 50 мг/кг массы тела следует назначать в виде в/в инфузии, по крайней мере, в течение 30 мин.

Исследования in vitro показали, что подобно другим цефалоспориновым антибиотикам цефтриаксон способен вытеснять билирубин, связанный с альбумином сыворотки крови. Поэтому у новорожденных с гипербилирубинемией и особенно у недоношенных новорожденных, применение цефтриаксона требует еще большей осторожности.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Medakson>