Медаксон



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 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, Klebssiella spp. (в т.ч. Klebssiella 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-лактамазу (для определения чувствительности микроорганизмов необходимо применять диски, содержащие цефтриаксон, т.к. показано, что in vitro к классическим цефалоспоринам 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 неизмененном виде с мочой, а 40-50% - также в неизмененном 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 цефалоспоринам 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
Neisseria meningitidis	4 дня
Haemophilus influenzae	6 дней
Streptococcus pneumoniae	7 дней
Чувствительные Enterobacteriacease	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 ягодицу. 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 раздельно.

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°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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