Мероноксол



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 в/в введения от белого до белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 фл.
меропенема тригидрат	570 мг
соответствует меропенема	500 мг

Вспомогательные вещества: натрия карбонат 104 мг.

500 мг - флаконы бесцветного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик для парентерального применения из группы карабапенемов, оказывает бактерицидное действие (подавляет синтез клеточной стенки бактерий), легко проникает через клеточную стенку бактерий, устойчив к действию большинства бета-лактамаз. Практически не разрушается в почечных канальцах дегидропептидазой-1 (не образуются нефротоксические продукты распада), обладает высоким аффинитетом к белкам, связывающим пенициллин.

Бактерицидные и бактериостатические концентрации практически не различаются. Взаимодействует с рецепторами - специфическими пенициллинсвязьтающими белками на поверхности цитоплазматической мембраны, тормозит синтез пептидогликанового слоя клеточной стенки, подавляет транспептидазу, способствует высвобождению аутолитиче-ских ферментов клеточной стенки, что в итоге вызывает ее повреждение и гибель бактерий.

Спектр антибактериальной активности меропенема включает в себя большинство клинически значимых грамположительных и грамотрицательных аэробных и анаэробных штаммов бактерий:

Грамположительные аэробы:

Enterococcus faecalis (включая ванкомицин-устойчивые штаммы), Staphylococcus aureus (пенициллиназонепродуцирующие и пенициллиназопродуцирующие [метициллин-чувствительные]); Streptococcus agalactiae, Streptococcus pneumoniae (только пенициллин-чувствительные); Streptococcus pyogenes, Streptococcus spp. группы viridans.

Грамотрицательные аэробы:

Escherichia coli, Haemophilus influenzae (пенициллиназонепродуцирующие и пенициллиназопродуцирующие), Klebsiella pneumoniae, Neisseria meningitidis, Pseudomonas aeruginosa, Proteus mirabilis.

Анаэробные бактерии:

Bacteroides fragilis, Bacteroides thetaiotaomicron, Peptostreptococcus spp.

Меропенем эффективен in vitro в отношении нижеуказанных микроорганизмов, однако клинически его эффективность при заболеваниях, вызываемых этими возбудителями, не доказана:

Грамположительные аэробы:

Staphylococcus epidermidis (пенициллиназонепродуцирующие и пенициллиназопродуцирующие [метициллин-чувствительные]).

Грамотрицательные аэробы:

Acinetobacter spp., Aeromonas hydrophila, Campylobacter jejuni, Citrobacter diversus, Citrobacter freundii, Enterobacter cloacae, Haemophilus influenzae (ампициллин-устойчивые, пенициллиназонепродуцирующие штаммы), Hafnia alvei, Klebsiella oxytoca, Moraxella catarrhalis (пенициллиназонепродуцирующие и пенициллиназопродуцирующие), Morganella morganii, Pasteurclla multocida, Proteus vulgaris, Salmonella spp., Serratia marcescens, Shigella spp., Yersinia enterocolitica.

Анаэробные бактерии:

Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides uniformis, Bacteroides ureolyticus, Bacteroides vulgatus, Clostridium difficile, Clostridium perfringens, Eubacterium lentum, Fusobacterium spp., Prevotella bivia, Prevotella intermedia, Prevotella melaninogenica, Porphyromonas asaccharolytica, Propionibacterium acnes.

Фармакокинетика

При внутривенном введении 250 мг в течение 30 мин C_{max} -11 мкг/мл, для дозы 500 мг - 23 мкг/мл, 1 г - 49 мкг/мл (абсолютной фармакокинетиче-ской пропорциональной зависимости от введенной дозы для C_{max} и AUC нет). При увеличении дозы с 0,25 до 2 г клиренс уменьшается с 287 до 205 мл/мин. При внутривенном болюсном введении в течение 5 мин 500 мг C_{max} - 52 мкг/мл, 1 г - 112 мкг/мл. Связь с белками плазмы - 2 %.

Хорошо проникает в большинство тканей и жидкостей организма, в т.ч. в спинномозговую жидкость больных бактериальным менингитом, достигая концентраций, превышающих требуемые для подавления большинства бактерий (бактерицидные концентрации создаются через 0,5-1,5 ч после начала инфузии). В незначительных количествах проникает в грудное молоко.

Подвергается незначительному метаболизму в печени с образованием единственного неактивного метаболита. $T_{1/2}$ - 1 ч, у детей до 2 лет - 1.5-2.3 ч. В диапазоне доз 10-40 мг/кг у взрослых и детей наблюдается линейная зависимость фарма-кокинетических параметров. Не кумулирует.

Выводится почками - 70% в неизмененном виде в течение 12 ч. Концентрация меропенема в моче, превышающая 10 мкг/мл, поддерживается в течение 5 ч после введения 500 мг. У больных с почечной недостаточностью клиренс коррелирует с клиренсом креатинина (КК). У пожилых пациентов снижение клиренса меропенема коррелирует со снижением КК, связанным с возрастом. $T_{1/2}$- 1,5ч. Выводится при гемодиализе.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к меропенему микроорганизмами:

— инфекции нижних дыхательных путей (в т.ч. пневмонии, включая госпитальные);

— внутрибрюшные инфекции (в т.ч. осложненный аппендицит, перитонит, пельвиоперитонит);

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

— инфекции кожи и мягких тканей (в т.ч. рожа, импетиго, вторично инфицированные дерматозы);

— инфекции органов малого таза (в т.ч. эндометрит);

— бактериальный менингит;

— эмпирическое лечение (в виде монотерапии или в комбинации с противовирусными или противогрибковыми ЛС) при подозрении на инфекцию у взрослых пациентов с фебрильными эпизодами с нейтропенией.

Относится к болезням:

- Дерматит
- Импетиго

- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Менингит
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Рожа
- Эндометрит

Противопоказания:

— детский возраст (до 3 мес);

— повышенная чувствительность к меропенему (в том числе и к другим бета-лактамным антибиотикам), компонентам препарата;

С осторожностью: беременность, период лактации.

Способ применения и дозы:

Внутривенно болюсно в течение не менее 5 минут, либо в виде внутривенной инфузии в течение 15-30 минут.

Дозы и продолжительность терапии должны устанавливаться в зависимости от типа и тяжести инфекции и состояния пациента. Рекомендуются следующие суточные дозы:

Взрослые и дети старше 12 лет и с массой тела более 50 кг:

500 мг внутривенно каждые 8 часов при *пневмонии, инфекциях мочеполового тракта, гинекологических инфекциях и воспалительных заболеваниях органов малого таза, инфекциях кожи и мягких тканей*.

1 г внутривенно каждые 8 часов при *госпитальной пневмонии, перитоните, подозрении на бактериальную инфекцию у больных с нейтропенией, а также септицемии*. При *менингите* рекомендуемая доза составляет 2 г каждые 8 часов.

При **хронической почечной недостаточности** дозу корректируют в зависимости от КК: при КК 26-50 мл/мин - по 0.5-1 г 2 раза в сутки, 10-25 мл/мин - по 250-500 мг 2 раза в сутки, менее 10 мл/мин - по 500 мг 1 раз в сутки.

Меропенем выводится при гемодиализе. Если требуется продолжительное лечение, рекомендуется, чтобы единица дозы (определяется в зависимости от типа и тяжести инфекции) вводилась по завершении процедуры гемодиализа, чтобы восстановить эффективную концентрацию в плазме.

Дети

Для детей в возрасте от 3 месяцев до 12 лет, или с массой тела менее 50 кг, рекомендуемая доза для внутривенного введения составляет 10-20 мг/кг каждые 8 часов в зависимости от типа и тяжести инфекции, чувствительности патогенного микроорганизма и состояния пациента.

При *менингите* рекомендуемая доза составляет 40 мг/кг каждые 8 часов.

Нет опыта применения препарата у детей с нарушением функции печени и почек.

Приготовление растворов

Для внутривенных болюсных инъекций препарат растворяют в стерильной воде для инъекций (10 мл на 500 мг меропенема). Это обеспечивает концентрацию раствора 50 мг/мл.

Для внутривенных инфузии препарат растворяют в стерильной воде для инъекций или в совместимой инфузионной жидкости (от 50 до 200 мл). Меропенем совместим со следующими инфузионными жидкостями:

- натрия хлорид 0.9% раствор;

- декстроза 5% или 10% раствор;

- 5% раствор декстрозы с 0.02% натрия гидрокарбонатом;

- 0.9% раствор натрия хлорида с 5% раствором декстрозы;

- 5% раствор декстрозы с 0.225 % раствором натрия хлорида;

- 5% раствор декстрозы с 0.15% раствором калия хлорида;

- 2.5% или 10% раствор маннитола.

Меропенем не допускается смешивать с растворами, содержащими другие препараты.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: боли в эпигастралыюй области, тошнота, рвота, диарея, запор, анорексия, желтуха, кандидоз слизистой оболочки полости рта, псевдо-мембранозный колит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: развитие или усугубление сердечной недостаточности, остановка сердца, тахи- или брадикардия, снижение или повышение артериального давления, обморочные состояния, инфаркт миокарда, тромбоэмболия ветвей легочной артерии.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, отеки, нарушение функции почек (гиперкреатининемия, повышение концентрации мочевины в плазме), гематурия.

Аллергические реакции: зуд кожи, кожная сыпь, крапивница, мультиформная экссудатив-ная эритема, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, парестезии, ажитация, нарушение сознания, эпилептиформные припадки, судороги.

Со стороны лабораторных показателей: тромбоцитоз, эозинофилия, тромбоцитопения, снижение гемоглобина, гематокрита, лейкопения, укорочение протромбинового и частичного тромбопластинового времени, лейкоцитоз, гипокалиемия; гипербилирубинемия, повышение активности аспартатаминотрансферазы, аланинаминотрансферазы, щелочной фосфатазы, лактатдегидрогеназы.

Местные реакции: воспаление, флебит, тромбофлебит, болезненность, отек в месте введения.

Прочие: положительная прямая или непрямая пробы Кумбса, анемия, гиперволемия, вагинальный кандидоз.

Передозировка:

Случайная передозировка возможна во время лечения, особенно у пациентов с нарушенной функцией почек.

Симптомы: усиление выраженности побочных эффектов.

Лечение: симптоматическая терапия. В норме происходит быстрая элиминация препарата почками. У пациентов с нарушением функции почек эффективен гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности и лактации необходимо оценить потенциальную пользу для матери и возможный риск применения меропенема для плода и младенца.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместим с 0.9% раствором натрия хлорида, 5% или 10% раствором декстрозы, с 0.02% раствором натрия гидрокарбоната, 5% раствором декстрозы с 0.225 % раствором натрия хлорида, 5% раствором декстрозы с 0.15% раствором калия хлорида, 2.5% раствором маннитола.

Проявляет антагонизм при взаимодействии с бета-лактамными антибиотиками. Снижает плазменную концентрацию вальпроевой кислоты, что может привести к снижению противосудорожного эффекта.

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение и увеличивают концентрацию меропенема в плазме.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты, имеющие в анамнезе гиперчувствителыюсть к карбапенемам, пенициллинам или другим бета-лактамным антибиотикам, могут проявлять гиперчувствительность к меропенему.

Применение меропенема при инфекциях, вызванных метициллинрезистентным стафилококком, не рекомендуется.

Лечение больных с заболеваниями печени должно проводиться под контролем активности «печеночных» трансаминаз и концентрации билирубина.

В процессе лечения возможно развитие устойчивости возбудителей, в связи с чем длительное лечение проводят под постоянным контролем распространения резистентных штаммов. У лиц с заболеваниями желудочно-кишечного тракта, особенно колитами, необходимо учитывать возможность развития псевдомембранозного колита (токсин, продуцируемый Clostridium difficile, является одной из основных причин колитов, связанных с антибиотиками), первым симптомом которого может служить развитие диареи на фоне лечения.

При ионотерапии установленной или подозреваемой инфекции нижних дыхательных путей тяжелого течения, вызываемой Pseudomonas aeruginosa, рекомендуется регулярное определение чувствительности возбудителя.

Опыт применения меропенема у детей с нейтропенией, с первичным или вторичным иммунодефицитом отсутствует.

При беременности и лактации необходимо оценить потенциальную пользу для матери и возможный риск применения меропенема для плода и младенца.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При хронической почечной недостаточности дозу корректируют в зависимости от КК

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3 месяцев.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 20°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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