Меропенабол



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 белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 фл.
меропенем (в форме тригидрата)	500 мг
"-	1 г

Вспомогательные вещества: натрия карбонат.

Флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы карбапенемов для парентерального применения. Взаимодействует с рецепторами - специфическими пенициллинсвязывающими белками на поверхности цитоплазматической мембраны, подавляет транспептидазу, тормозит синтез пептидогликанов клеточной стенки (вследствие структурного сходства), что в итоге вызывает ее повреждение и гибель бактерий. Устойчив к почечной дегидропептидазе-1, действует бактерицидно, легко проникает через клеточную стенку бактерий, устойчив к действию большинства β-лактамаз, обладает высоким аффинитетом к пенициллинсвязывающим белкам.

Среди известных бета-лактамных антибиотиков обладает наиболее высокой активностью в отношении большинства аэробных и анаэробных грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов.

Активен в отношении грамположительных аэробов: Bacillus spp., Corynebacterium diphtheriae, Enterococcus liquifaciens, Enterococcus avium, Enterococcus faecalis, Listeria monocytogenes, Lactobacillus spp., Nocardia asteroides, Staphylococcus aureus (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Staphylococcus spp. (коагулаза-негативные штаммы), в т.ч. Staphylococcus saprophyticus, Staphylococcus capitis, Streptococcus pneumoniae (в т.ч. пенициллин-устойчивые штаммы), Streptococcus agalactiae, Streptococcus pyogenes, Streptococcus equi, Streptococcus bovis, Streptococcus mitis, Streptococcus viridans, Streptococcus salivarius, Streptococcus morbillorum, Streptococcus spp. (группы G и F), Rhodococcus equi; *грамотрицательных аэробов:* Achromobacter xylosoxidans, Acinetobacter anitratus, Acinetobacter lwoffii, Acinetobacter baumannii, Aeromonas hydrophila, Aeromonas sorbria, Aeromonas caviae, Alcaligenes faecalis, Bordetella bronchiseptica, Brucella melitensis, Campylobacter coli, Campylobacter jejuni, Citrobacter freundii, Citrobacter diversus, Citrobacter amalonaticus, Enterobacter aerogenes, Enterobacter agglomerans, Enterobacter cloacae, Escherichia coli, Gardnerella vaginalis, Haemophilus influenzae(включая штаммы, продуцирующие β-лактамазы, и ампициллин-устойчивые штаммы), Haemophilus parainfluenzae, Haemophilus ducreyi, Helicobacter pylori, Neisseria meningitidis, Neisseria gonorrhoeae (включая штаммы, продуцирующие β-лактамазы, устойчивые к пенициллинам и спектиномицину), Hafnia alvei, Klebsiella pneumoniae, Klebsiella aerogenes, Klebsiella ozaenae, Klebsiella oxytoca, Moraxella catarrhalis, Morganella morganii, Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Providencia rettgeri, Providencia stuartii, Providencia alcalifaciens, Pasteurella multocida, Pseudomonas shigelloides, Pseudomonas aeruginosa, Pseudomonas putida, Pseudomonas alcaligenes, Burkholderia cepacia, Pseudomonas fluorescens, Pseudomonas stutzeri, Stenotrophomonas spp.,

Salmonella spp. (в т.ч. Salmonella typhi), Serratia spp. (в т.ч. Serratia marcescens, Serratia liquifaciens), Shigella sonnei, Shigella flexneri, Shigella dysenteriae, Vibrio cholerae, Vibrio parahaemolyticus, Vibrio vulnificus, Yersinia enterocolitica; *анаэробных бактерий:* Actinomyces israelii, Bacteroides spp. (в т.ч. Bacteroides fragilis, Bacteroides vulgatus, Bacteroides variabilis, Bacteroides pneumosintes, Bacteroides coagulans, Bacteroides uniformis, Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides thetaiotaomicron), Prevotella spp. (в т.ч. Prevotella melaninogenica, Prevotella buccae, Prevotella denticola, Prevotella levii), Porphyromonas spp. (в т.ч. Porphyromonas asaccharolyticus), Bifidobacterium spp., Clostridium perfringens, Clostridium difficile, Clostridium sporogenes, Clostridium cadaveris, Clostridium sordellii, Clostridium butyricum, Clostridium clostridiiformis, Clostridium tetani, Eubacter lentum, Eubacter aerofaciens, Fusobacterium mortiferum, Fusobacterium necrophorum, Mobiluncus curtisii, Mobiluncus mulieris, Peptostreptococcus anaerobius, Peptostreptococcus micros, Peptostreptococcus saccharolyticus, Peptococcus magnus, Peptococcus prevotii, Propionibacterium acne, Propionibacterium avidium, Propionibacterium granulosum.

Фармакокинетика

Распределение

При в/в введении препарата в дозе 250 мг C_{max} достигается в течение 30 мин и составляет 11 мкг/мл, в дозе 500 мг C_{max} составляет 23 мкг/мл, в дозе 1 г - 49 мкг/мл (абсолютной фармакокинетической пропорциональной зависимости от введенной дозы для C_{max} и AUC нет). При увеличении дозы с 250 мг до 2 г клиренс уменьшается с 287 до 205 мл/мин.

При в/в болюсном введении препарата в дозе 500 мг C_{max} достигается в течение 5 мин и составлет 52 мкг/мл, в дозе 1 г - 112 мкг/мл.

Связывание 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. Не кумулирует.

Метаболизм

Подвергается незначительному метаболизму в печени с образованием единственного неактивного метаболита.

Выведение

$T_{1/2}$ - 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 фармакокинетических параметров. 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 препарата в дозе 500 мг. Выводится при гемодиализе.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У больных с почечной недостаточностью клиренс меропенема коррелирует с клиренсом креатинина.

У пожилых пациентов снижение клиренса меропенема коррелирует с возрастным снижением клиренса креатинина. $T_{1/2}$ - 1.5 ч.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными возбудителями:

— бактериальный менингит;

— инфекции нижних отделов дыхательных путей (в т.ч. пневмония, включая госпитальную), инфекции, вызванные синегнойной палочкой (особенно у больных с муковисцидозом);

— абдоминальные инфекции (перитониты, пельвиоперитонит, осложненный аппендицит);

— пиелонефрит, пиелит;

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

— дизентерия;

— сепсис;

— бактериальный эндокардит;

— инфекционно-воспалительные заболевания органов малого таза (включая эндометрит);

— подозрение на бактериальную инфекцию у взрослых с фебрильными эпизодами на фоне нейтропении

(эмпирическое лечение).

Относится к болезням:

- Дерматит
- Дизентерия
- Импетиго
- Инфекции
- Менингит
- Муковисцидоз
- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Рожа
- Сепсис
- Эндокардит
- Эндометрит

Противопоказания:

— детский возраст до 3 мес;

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам с аллергическими реакциями на пенициллины и цефалоспорины в анамнезе; при указаниях в анамнезе на заболевания толстой кишки, в т.ч. НЯК; пациентам с почечной и печеночной недостаточностью.

Способ применения и дозы:

Меропенабол вводят в виде в/в болюсной инъекции в течение не менее 5 мин, либо в виде в/в инфузии в течение 15-30 мин.

Дозировка и продолжительность терапии должны устанавливаться в зависимости от типа, тяжести инфекции и состояния пациента.

Рекомендуются следующие суточные дозы.

Взрослые

При *лечении пневмоний, инфекций мочевыводящих путей, гинекологических инфекций (эндометрит и воспалительные заболевания органов малого таза), инфекций кожи и мягких тканей* в/в назначают по 500 мг каждые 8 ч.

При *лечении госпитальных пневмоний, перитонита, бактериальной инфекции у больных с нейтропенией (фебрильной нейтропении), а также сепсиса* - в/в по 1 г каждые 8 ч.

При *лечении менингита* рекомендуемая доза составляет 2 г каждые 8 ч.

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

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, для восстановления эффективной концентрации антибиотика в плазме.

Дети

Для **детей в возрасте от 3 мес до 12 лет** рекомендуемая доза для в/в введения составляет 10-20 мг/кг каждые 8 ч в зависимости от типа и тяжести инфекции, чувствительности патогенного микроорганизма и состояния пациента. У **детей с массой тела более 50 кг** следует использовать дозировки для взрослых.

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

Максимальная доза не должна превышать 2 г каждые 8 ч.

Меропенабол не рекомендуется для применения у **детей младше 3 мес**.

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

Правила приготовления растворов

Для в/в болюсных инъекций Меропенабол следует разводить стерильной водой для инъекций (10 мл на 500 мг меропенема). Это обеспечивает концентрацию раствора 50 мг/мл.

Для в/в инфузий Меропенабол следует разводить стерильной водой для инъекций или совместимой жидкостью для инфузии и затем разбавлять также совместимой жидкостью для инфузий (50-200 мл).

Меропенаболсовместим со следующими инфузионными жидкостями:

— 0.9% раствор натрия хлорида для в/в инфузий;

— 5% или 10% раствор декстрозы (глюкозы) для в/в инфузий;

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) для в/в инфузий с 0.02% раствором натрия бикарбоната;

— 0.9% раствор натрия хлорид и 5% раствор декстрозы (глюкозы) для в/в инфузий;

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) с 0.225% раствором натрия хлорида для в/в инфузий;

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) с 0.15% раствором калия хлорида для в/в инфузий;

— 2.5% и 10% раствор маннитола для в/в инфузий.

Меропенабол не должен смешиваться с растворами, содержащими другие препараты.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: боли в эпигастральной области, тошнота, рвота, диарея, холестатический гепатит, гипербилирубинемия, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, ЛДГ; редко – кандидоз полости рта, псевдомембранозный энтероколит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахи- или брадикардия, снижение или повышение АД, обморочные состояния.

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

Со стороны нервной системы: головная боль, парестезии, бессонница, повышенная возбудимость, тревожность, депрессия, нарушение сознания, галлюцинации, эпилептиформные припадки, судороги.

Со стороны лабораторных показателей: эозинофилия, нейтропения, лейкопения, анемия; редко - агранулоцитоз, обратимая тромбоцитопения, снижение частичного тромбопластинового времени.

Аллергические реакции: зуд кожи, кожная сыпь, крапивница, многоформная экссудативная эритема, ангионевротический отек, анафилактический шок.

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

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

Передозировка:

Случайная передозировка возможна во время лечения, особенно у пациентов с нарушенной функцией почек. Лечение в случае передозировки должно быть симптоматическим. Быстрое выведение препарата достигается при гемодиализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения препарата при беременности не определена.

На время лечения грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ганцикловир повышает риск развития генерализованных судорог.

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

Не совместим с гепарином.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты, имеющие в анамнезе указания на повышенную чувствительность к карбапенемам, пенициллинам или другим бета-лактамным антибиотикам, могут проявлять гиперчувствительность к меропенему.

Лечение больных с заболеваниями печени должно проводиться под тщательным 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 ЖКТ, особенно с колитами, необходимо учитывать возможность развития антибиотик-ассоциированной диареи и псевдомембранозного колита (токсин, продуцируемый Clostridium difficile, является одной из основных причин колитов, связанных с антибиотиками), первым симптомом которого может является развитие диареи на фоне лечения.

При монотерапии известной или подозреваемой инфекции нижних отделов дыхательных путей тяжелого течения, вызванной Pseudomonas aeruginosa, рекомендуется регулярное определение чувствительности возбудителя.

При нарушениях функции почек

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

Применение в детском возрасте

Противопоказан пациентам в возрасте до 3 мес.

Для **детей в возрасте от 3 мес до 12 лет** рекомендуемая доза для в/в введения составляет 10-20 мг/кг каждые 8 ч в зависимости от типа и тяжести инфекции, чувствительности патогенного микроорганизма и состояния пациента. У **детей с массой тела более 50 кг** следует использовать дозировки для взрослых.

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

Максимальная доза не должна превышать 2 г каждые 8 ч.

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

Условия хранения:

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

Для в/в инъекций и в/в инфузий рекомендуется применять свежеприготовленный раствор Меропенабола, однако разведенный меропенем может сохранить свою активность в течение 6 ч при хранении раствора при температуре не выше 25°С и 36 ч при хранении раствора при температуре не выше 5°С. Раствор не замораживать!

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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