Меропенем-ЛЕКСВМ



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Меропенем

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 введения	**1 фл.**
меропенем	1 г

флаконы (1) - пачки картонные.
флаконы (10) - коробки 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. В отличие от имипенема практически не разрушается в почечных канальцах дегидропептидазой-1 (не нуждается в сочетании с циластатином - специфическим ингибитором дегидропептидазы-1) и, соответственно, не образуются нефротоксические продукты распада, обладает высоким аффинитетом к белкам, связывающим пенициллин. Бактерицидные и бактериостатические концентрации практически не различаются. Взаимодействует с рецепторами - специфическими пенициллинсвязывающими белками на поверхности цитоплазматической мембраны, тормозит синтез пентидогликанового слоя клеточной стенки, подавляет транспептидазу, способствует высвобождению аутолитических 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 [метилллин-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 [метилллин-чувствительные]).

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

Анаэробные бактерии:

Bacteroides distasonis, Bacteroides ovatus, Bacteroides uniformis, Bacteroides ureolyticus, Bacteroides vulgatus, Clostridium difficile, Clostridium peifringens, Eubacterium lentum, Fusobacterium spp., Prevotella bivia, Prevotella intermedia, Prevotella melaninogenica, Porpliyroiiionas asaccharolylica, Propionibacterium acnes.

Фармакокинетика

При в/в введении 250 мг в течение 30 мин C_{max} действующего вещества в плазме крови достигает 11 мкг/мл, для дозы 500 мг - 23 мкг/мл, 1 г - 49 мкг/мл (абсолютной фармакокнметической пропорциональной зависимости от введенной дозы для C_{max} и AUC. При увеличении дозы с 0.25 до 2 г клиренс уменьшается с 287 до 205 мл/мин. При в/в 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 (СМЖ) 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 фармакокинетических 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. У пожилых пациентов снижение клиренса меропенема коррелирует со снижением клиренсом креатинина, связанным с возрастом. $T_{1/2}$ - 1.5 ч. Выводится при гемодиализе.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к меропенему микроорганизмами, в том числе при полимикробных инфекциях (в качестве монотерапии или комбинации с другими антибактериальными, противовирусными и противогрибковыми лекарственными средствами):

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

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

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

— интраабдоминальные инфекции (осложненный аппендицит, перитонит, пельвиоперитонит);

— септицемия;

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

— бактериальный менингит;

— подозрение на бактериальную инфекцию у взрослых с фебрильной нейтропенией (эмпирическое лечение в виде монотерапии или в комбинации с противовирусными или противогрибковыми средствами).

Относится к болезням:

- Дерматит
- Импетиго
- Инфекции
- Инфекции мочевыводящих путей
- Менингит

- Перитонит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Рожа
- Эндометрит

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата. Детский возраст до 3 месяцев (отсутствуют данные об эффективности и переносимости).

*С осторожностью. О*дновременное назначение с нефротоксичнымн препаратами; пациентам с колитами.

Способ применения и дозы:

В/в.

В/в болюсно: в разведении стерильной водой для инъекций 15 мл на 1000 мг в течение не менее 5 мин.

В/в инфузионно: в течение 15-30 мин, в разведении до 50-200 мл совместимой инфузионной жидкостью.

Меропенем совместим со следующими жидкостями:

— 0.9% раствор натрия хлорида; 5-10% раствор декстрозы (глюкозы);

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) с 0.02% раствором натрия гидрокарбоната;

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) с 0.225% раствором натрия хлорида;

— 5% раствор декстрозы (глюкозы) с 0.15% раствором калия хлорида;

— 2.5 и 10% раствор маннитола.

Меропенем не должен смешиваться или добавляться к другим лекарственным препаратам.

Доза и длительность терапии устанавливаются в зависимости от тяжести инфекции и состояния пациента. Рекомендуются следующие дозы:

Взрослые:

При пневмонии, инфекциях мочевыводящих путей, инфекциях органов малого таза, инфекциях кожи и мягких тканей – в/в, по 500 мг каждые 8 ч;

При госпитальной пневмонии, перитоните, септицемии, подозрении на бактериальную инфекцию у больных с нейтропенией - в/в, по 1000 мг 3 раза в сут;

При менингите - по 2000 мг каждые 8 ч.

При нарушении функции почек дозу корректируют в зависимости от клиренса креатинина:

Клиренс креатинина (мл/мин)	**Разовая доза: доля от рекомендованной разовой дозы, соответствующей патологии (500 мг, или 1000 мг, или 2000 мг)**	**Периодичность введения**
26-50	100%	Через 12 ч
10-25	50%	Через 12 ч
<10	50%	Через 24 ч

Меропенем выводится при гемодиализе. Для восстановления эффективной плазменной концентрации по завершении процедуры гемодиализа необходимо вводить рекомендованную для соответствующей патологии разовую дозу меропенема.

Дети:

— в возрасте от 3 мес до 12 лет (или с массой тела менее 50 кг) разовая доза для внутривенного введения -10-20

мг/кг 3 раза в сут;

— детям с массой тела более 50 кг применяют дозы для взрослых;

— при менингите 40 мг/кг каждые 8 ч.

Опыт применения у детей с нарушениями функции почек отсутствует.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: боли в эпигастральной области, тошнота, рвота, диарея, запор, анорексия, желтуха; кандидоз слизистой оболочки полости рта; псевдомембранозный колит.

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

Аллергические реакции: зуд кожи, кожная сыпь, крапивница, мультиформная экссудативная эритема; злокачественная экссудатнвная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), ангионевротический отек, анафилактический шок.

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

Со стороны лабораторных показателей: тромбоцитоз, эозинофилия, тромбоцитопения, снижение гемоглобина (НЬ), гематокрита, лейкопения, укорочение протромбинового и частичного тромбопластинового времени, лейкоцитоз, гипокалиемия; гтпербилрубинемия, повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ), аспартатаминотрансферазы (АСТ), щелочной фосфатазы (ЩФ), лактатдегидрогиназы (ЛДГ).

Местные реакции: воспаление, флебит, тромбофлебит, болезненность, отек в месте введения; повреждение тканей с сопутствующим подъемом креатинфосфокиназы (КФК) - при в/м введении.

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

Причинно-следственная связь с приемом меропенема не установлена: обморок, галлюцинации, депрессия, тревожность, повышенная возбудимость, бессонница, холестатический гепатит, сердечная недостаточность (СН), одышка, тахикардия, брадикардия, снижение или повышение артериального давления (АД); остановка сердца, инфаркт миокарда, тромбоэмболия легочной артерии (ТЭЛА).

Передозировка:

Случайная передозировка возможна во время лечения, особенно у больных с нарушением функции почек.

Лечение: симптоматическое. У больных с нарушением функции почек меропенем и его метаболиты выводятся при гемодиализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата во время беременности возможно только в тех случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместим с 0.9% раствором натрия хлорида, 5-10% раствором декстрозы, с 0.02% раствором натрия гндрокарбоната, 5% раствором декстрозы с 0.225% раствором натрия хлорида, 5% раствором декстрозы с 0.15% раствором калия хлорида, 2.5% и 10% раствором маннитола. Снижает плазменную концентрацию вальпроевой кислоты, что может привести к снижению противосудорожного эффекта. Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, замедляют выведение и повышают концентрацию в плазме.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты, имеющие в анамнезе гиперчувствительность к карбапенемам, пенициллинам или другим бета-лактамным

антибиотикам, могут проявлять гаперчувствительность к меропенему.

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 (ЖКТ), 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 монотерапии установленной или подозреваемой инфекции нижних дыхательных путей тяжелого течения, вызываемой Pseudomonas aeruginosa, рекомендуется регулярное определение чувствительности возбудителя. Опыта применения меропенема у детей с нейтропенией, с первичным или вторичным иммунодефицитом нет.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При нарушении функции почек дозу корректируют в зависимости от клиренса креатинина.

При нарушениях функции печени

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

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3 месяцев (отсутствуют данные об эффективности и переносимости). Опыт применения у детей с нарушениями функции почек отсутствует.

Условия хранения:

В защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в местах недоступных для детей.

Срок годности. 2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Meropenem-LEKSVM