

ЦЕФОТАКСИМ**Регистрационный номер:** P N002159/01.**Торговое название препарата:** ЦЕФОТАКСИМ.**Международное непатентованное название:** цефотаксим.**Лекарственная форма:** порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения.**Состав:****активное вещество:** цефотаксим натрия в пересчете на цефотаксим – 0,5 г и 1,0 г.**Описание:** порошок от белого до желтого цвета.**Фармакотерапевтическая группа:** антибиотик–цефалоспорин.**Код АТХ:** [J01DD01].**Фармакологическое действие****Фармакодинамика.** Цефалоспориновый антибиотик III поколения для парентерального введения. Действует бактерицидно, нарушая синтез клеточной стенки микроорганизмов. Обладает широким спектром действия.Активен в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, устойчивых к др. антибиотикам: *Staphylococcus* spp. (в т.ч. *Staphylococcus aureus* (включая штаммы, образующие пенициллиназу) и *Staphylococcus epidermidis* (за исключением *Staphylococcus epidermidis* и *Staphylococcus aureus*, устойчивых к метициллину)), *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus agalactiae*, *Enterococcus* spp., *Enterobacter* spp., *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae* (в т.ч. штаммы, образующие пенициллиназу), *Haemophilus parainfluenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Klebsiella* spp. (в т.ч. *Klebsiella pneumoniae*), *Morganella morganii*, *Neisseria gonorrhoeae* (в т.ч. штаммы, образующие пенициллиназу), *Acinetobacter* spp., *Corynebacterium diphtheriae*, *Erysipelothrix rhusiopathiae*, *Eubacter* spp., *Propionibacterium* spp., *Clostridium* spp. (в т.ч. *Clostridium perfringens*), *Citrobacter* spp., *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Providencia* spp. (в т.ч. *Providencia rettgeri*), *Serratia* spp., некоторых штаммов *Pseudomonas aeruginosa*, *Neisseria meningitidis*, *Bacteroides* spp. (в т.ч. некоторые штаммы *Bacteroides fragilis*), *Fusobacterium* spp. (в т.ч. *Fusobacterium nucleatum*), *Peptococcus* spp., *Peptostreptococcus* spp.Большинство штаммов *Clostridium difficile* – устойчивы.

Устойчив к большинству бета-лактамаз грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов.

Фармакокинетика. После однократного внутривенного введения в дозах 0,5 г, 1 г и 2 г максимальная концентрация в плазме крови (С_{max}) определяется через 5 мин и составляет 39 мкг/мл, 101,7 мкг/мл и 214 мкг/мл соответственно. После внутримышечного введения препарата в дозах 0,5 г и 1 г С_{max} определяется через 30 минут и составляет 11 мкг/мл и 21 мкг/мл соответственно. Связь с белками плазмы крови – 30–50%. Биодоступность – 90–95%.

Создает терапевтические концентрации в большинстве тканей (миокард, кости, желчный пузырь, кожа, мягкие ткани) и жидкостей (синовиальная, перикардальная, плевральная, спинномозговая жидкость, мокрота, желчь, моча) организма. Объем распределения – 0,25–0,39 л/кг.

Период полувыведения (T_{1/2}) – 1 час при в/в введении и 1–1,5 часа–при в/м введении. Выводится почками – 20–36% в неизменном виде, остальное количество – в виде метаболитов (15–25% – в виде фармакологически активного дезацетилцефотаксима и 20–25% – в виде 2 неактивных метаболитов – M2 и M3, лишенных antimicrobial действия).При хронической почечной недостаточности (ХПН) и у лиц пожилого возраста T_{1/2} увеличивается в 2 раза. T_{1/2} у новорожденных – 0,75–1,5 часа, у недоношенных новорожденных детей (масса тела менее 1500 г) возрастает до 4,6 часа; у детей с массой тела более 1500 г – 3,4 часа. При повторных в/в введениях в дозе 1 г каждые 6 часов в течение 14 суток кумуляции не наблюдается. Проникает в грудное молоко, проходит через плацентарный барьер.**Показания к применению.** Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными микроорганизмами: инфекции центральной нервной системы (менингит), дыхательных путей и ЛОР-органов, мочевыводящих путей, костей, суставов, кожи и мягких тканей, органов малого таза, гонорея, инфицированные раны и ожоги, перитонит, сепсис, абдоминальные инфекции, эндокардит, болезнь Лайма (боррелиоз), сальмонеллез, инфекции на фоне иммунодефицита, профилактика инфекций после хирургических операций (в т.ч. урологических, акушерско-гинекологических, на желудочно-кишечном тракте).**Противопоказания.** Повышенная чувствительность к цефотаксиму и другим цефалоспорином.

В случае растворения препарата в 1 % растворе лидокаина:

- повышенная чувствительность к лидокаину или другому местному анестетику амидного типа;
- внутрисердечная блокада без установленного водителя ритма;
- тяжелая сердечная недостаточность;
- внутривенное введение;
- дети в возрасте до 2,5 лет (внутримышечное введение).

С осторожностью. Период новорожденности; хроническая почечная недостаточность; язвенный колит (в т.ч. в анамнезе); у пациентов с повышенной чувствительностью к пенициллинам в анамнезе в связи с возможностью развития перекрестной аллергической реакции.**Применение при беременности и в период грудного вскармливания.** Применение препарата в период беременности возможно в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание на время применения препарата.**Способ применения и дозы**

Препарат вводят внутривенно (струйно или капельно) и внутримышечно.

Взрослым и детям старше 12 лет (с массой тела 50 кг и более):

- при неосложненных инфекциях, а также при инфекциях мочевыводящих путей – в/м или в/в, по 1 г каждые 8–12 ч;
- при неосложненной острой гонорее – в/м, 1 г однократно;
- при инфекциях средней тяжести – в/м или в/в, по 1–2 г каждые 12 ч;
- при тяжелом течении инфекций, например при менингите – в/в, по 2 г каждые 4–8 ч, максимальная суточная доза – 12 г.

Продолжительность лечения устанавливают индивидуально.

С целью профилактики развития инфекций перед хирургической операцией вводят

во время вводной общей анестезии однократно 1 г. При необходимости введение повторяют через 6–12 ч.

При кесаревом сечении – в момент наложения зажимов на пупочную вену – в/в, 1 г, затем через 6 и 12 ч после первой дозы – дополнительно по 1 г.

При клиренсе креатинина (КК) 20 мл/мин/1,73 кв.м и менее суточную дозу уменьшают в 2 раза.

Недоношенным и новорожденным в возрасте до 1 нед – в/в 50 мг/кг каждые 12 ч; в возрасте 1–4 нед – в/в 50 мг/кг каждые 8 ч;

детям с 1 мес (с массой тела до 50 кг) – в/в или в/м (в возрасте старше 2,5 лет) 50–180 мг/кг в 4–6 введений. При тяжелом течении инфекций, в т.ч. менингите, суточную дозу детям увеличивают до 100–200 мг/кг, в/м или в/в в 4–6 приемов, максимальная суточная доза – 12 г.

Правила приготовления инъекционных растворов: для в/в инъекции в качестве растворителя используют воду для инъекций (0,5–1 г разводят в 4 мл растворителя, 2 г – в 10 мл), препарат вводят медленно в течение 3–5 минут; для в/в инфузии в качестве растворителя используют 0,9% раствор натрия хлорида или 5% раствор декстрозы (1–2 г разводят в 50–100 мл растворителя); продолжительность инфузии – 50–60 мин; для в/м введения используют воду для инъекций или 1% раствор лидокаина (для дозы препарата 0,5 г – 2 мл, для дозы 1 г – 4 мл).

Побочное действие. *Аллергические реакции:* крапивница, озноб или лихорадка, сыпь, кожный зуд, редко – бронхоспазм, эозинофилия, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса–Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), ангионевротический отек, редко – анафилактический шок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: потенциально жизнеопасные аритмии после быстрого болюсного введения в центральную вену.

Со стороны центральной нервной системы: головная боль, головокружение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, диарея или запоры, метеоризм, боль в животе, дисбактериоз, нарушение функции печени, редко – стоматит, глоссит, псевдомембранозный энтероколит.

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек, олигурия, интерстициальный нефрит.

Со стороны органов кроветворения: гемолитическая анемия, лейкопения, нейтропения, гранулоцитопения, тромбоцитопения, гипокоагуляция.

Лабораторные показатели: азотемия, повышение концентрации мочевины в крови, повышение активности "печеночных" трансаминаз и щелочной фосфатазы, гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, положительная реакция Кумбса.

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

Прочие: суперинфекция (в частности, кандидозный вагинит).

Передозировка

Симптомы: судороги, энцефалопатия (в случае введения больших доз, особенно у больных с почечной недостаточностью), тремор, нервно-мышечная возбудимость.

Лечение: симптоматическое, специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами. Увеличивает риск кровотечений при сочетании с антиагрегантами, нестероидными противовоспалительными препаратами.

Вероятность поражения почек увеличивается при одновременном приеме с аминокликозидами, полимиксином В и "петлевыми" диуретиками.

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, увеличивают плазменные концентрации цефотаксима и замедляют его выведение.

Фармацевтически несовместим с растворами других антибиотиков в одном шприце или капельнице.

Особые указания. В первые недели лечения может возникнуть псевдомембранозный колит, проявляющийся тяжелой длительной диареей. При этом прекращают прием препарата и назначают адекватную терапию, включая ванкомицин или метронидазол.

Пациенты, имевшие в анамнезе аллергические реакции на пенициллины, могут иметь повышенную чувствительность к антибиотикам группы цефалоспоринов.

При лечении препаратом свыше 10 дней необходим контроль картины периферической крови.

Во время лечения цефотаксимом возможно получение ложноположительной пробы Кумбса и ложноположительной реакции мочи на глюкозу.

Во время лечения употреблять этанол нельзя из-за возможности возникновения дисульфирамоподобных реакций (гиперемия лица, спазм в животе и в области желудка, тошнота, рвота, головная боль, снижение артериального давления, тахикардия, одышка).

Форма выпуска. Порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения 0,5 г, 1,0 г.

0,5 г, 1,0 г активного вещества во флаконах стеклянных вместимостью 10 мл.

Растворитель – «Вода для инъекций» в ампулах стеклянных объемом 5 мл.

1 флакон с инструкцией по применению в пачке из картона.

1 флакон с препаратом и 1 ампула с растворителем в контурной ячейковой упаковке (КЯУ) из пленки поливинилхлоридной. Одна КЯУ с инструкцией по применению в пачке из картона.

5 флаконов с препаратом и 5 ампул с растворителем в отдельных КЯУ из пленки поливинилхлоридной. Одна КЯУ с флаконами и одна КЯУ с ампулами и инструкцией по применению в пачке из картона.

В пачку с КЯУ вкладывают нож для вскрытия ампул или скарификатор ампульный. При использовании ампул с насечками, кольцами или точками надлома нож для вскрытия ампул или скарификатор ампульный допускается не вкладывать.

10 флаконов с инструкцией по применению в коробке из картона.

Для стационаров:

– 50 флаконов с равным количеством инструкций по применению в коробке из картона;

– 1 флакон (от 1 до 50 флаконов с равным количеством инструкций по применению) в коробке из картона.

Условия хранения. В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

По истечении срока годности препарата неиспользованные флаконы осторожно вскрыть, содержащее растворить в большом количестве воды и слить в канализацию.

Срок годности. 2 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек. По рецепту.

Претензии от потребителей принимает предприятие-производитель:

ОАО "Красфарма", Россия, 660042, г. Красноярск, ул. 60 лет Октября, д. 2.

Тел./факс: (391) 261-25-90/261-17-44.