

**ЦЕФОТАКСИМ-БХФЗ
(CEFOTAXIME-BCPP)**

УТВЕРЖДЕНО

Приказ Министерства здравоохранения Украины

09.03.06 № 109

Регистрационное удостоверение

№ UA/4252/01/01 UA/4252/01/02

ИНСТРУКЦИЯ для медицинского применения препарата ЦЕФОТАКСИМ-БХФЗ

Общая характеристика:

международное и химическое названия: Cefotaxime;
натрий

Автор: Administrator

24.06.10 12:45 - Последнее обновление 24.06.10 14:20

(6К.7К)-3-[(ацетилокси)метил]-7-[[[(7)-2-(2-аминотиазол-4-ил)-2-(метоксиимино)ацетил]амино]-8-оксо-5-тиа-1-азабицикло [4.2.0.]окт-2-ен-2-карбоксилат;

основные физико-химические свойства:

порошок белого или слегка желтого цвета. Гигроскопичный;

состав:

1 флакон содержит цефотаксима натриевой соли стерильной в пересчете на цефотаксим 500 мг или 1000 мг.

Форма выпуска.

Порошок для приготовления раствора для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа.

Противомикробные средства для системного применения.

Прочие бета-лактамы антибиотики.

Цефалоспорины третьего поколения. Код АТС J01D D01.

Фармакологические свойства.

Фармако-динамика.

Цефотаксим-БХФЗ - полусинтетический антибиотик группы цефалоспоринов III поколения, широкого спектра действия, для парентерального введения.

Препарат эффективен в отношении многих грамположительных и проявляет высокую активность к грамотрицательным бактериям.

Действует бактерицидно на штаммы бактерий, стойких к пенициллину, аминогликозидам, сульфаниламидам.

Механизм антимикробного действия Цефотаксима-БХФЗ связан с угнетением активности фермента транспептидазы, блокадой пептидогликана, нарушением образования мукопептида клеточной стенки микроорганизмов.

Препарат стойкий по отношению к четырем из пяти бета-лактамаз грамотрицательных бактерий и пенициллиназы стафилококков.

Автор: Administrator

24.06.10 12:45 - Последнее обновление 24.06.10 14:20

Активен по отношению к *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, некоторым штаммам *Enterococcus* spp., *Streptococcus pneumoniae* (особенно *Diplococcus pneumoniae*), *Streptococcus pyogenes* (бета-гемолитические стрептококки группы А), *Streptococcus agalactiae* (стрептококки группы В), *Bacillus subtilis*, *Bacillus myroides*, *Corinebacterium diphtheriae*, *Erysipelothrix insidiosa*, *Eubacterium*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae*, в том числе ампициллинорезистентным штаммам, *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella oxytoca*, *Klebsiella pneumoniae*, *Morganella morganii*, *Neisseria meningitidis*, *Neisseria gonorrhoeae*, в том числе штаммам, вырабатывающим пенициллиназу, *Propionibacterium*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Proteus inconstans*, *Serratia* spp., *Veillonella*, *Yersinia*, *Bordetella pertussis*, *Moraxella*, *Aeromonas hydrophilia*, *Fusobacterium*, *Bacteroides* spp., *Clostridium* species, *Peptostreptococcus* species, *Peptococcus* spp. Влияет на некоторые штаммы *Pseudomonas aeruginosa*, *Acinetobacter*, *Helicobacter pylori*, *Bacteroides fragilis*, *Clostridium difficile*.

Может действовать на мультирезистентные штаммы, которые стойки к пенициллинам, цефалоспорином первых двух поколений, аминогликозидам. Препарат менее активен к грамположительным коккам, чем цефалоспорины I-II поколений. К действию препарата устойчивы стрептококки группы D, *Listeria* spp. и метициллинустойчивые стафилококки.

Фармакокинетика.

Максимальная концентрация в крови после внутримышечного введения препарата в дозах 500 мг и 1000 мг наблюдается через 30 минут после введения и составляет 11 мкг/мл и 21 мкг/мл соответственно. Через 5 минут после внутривенного введения 500 мг, 1000 мг или 2000 мг максимальная концентрация в крови составляет соответственно 39, 100, 214 мкг/мл. В крови препарат на 25-40 % связывается с белками.

Бактерицидная концентрация в крови сохраняется более 12 часов.

Препарат хорошо проникает в ткани (создает эффективную концентрацию в миокарде, костной ткани, желчном пузыре, коже, мягких тканях), жидкости организма

Автор: Administrator

24.06.10 12:45 - Последнее обновление 24.06.10 14:20

(определяется в эффективных концентрациях в спинномозговой, перикардальной, плевральной, перитонеальной, синовиальной жидкостях), проходит сквозь плаценту, проникает в грудное молоко.

Цефотаксим-БХФЗ выводится в значительном количестве с мочой (90%) (в неизменном виде около 60-70 % и в виде активных метаболитов около 20-30 %, из них 15-25 % является основным метаболитом - дезацетилцефотаксимом, имеющим противо-микробную активность). Период полувыведения при внутривенном введении - 1 час, при внутримышечном - 1-1,5 часа.

При повторных внутривенных введениях в дозе 1000 мг каждые 6 часов на протяжении 14 суток кумуляции не наблюдается.

У грудных детей период полувыведения составляет 0,75-1,5 часа, у недоношенных - от 1,4 до 6,4 часа, у пациентов старше 80 лет и при почечной недостаточности период полувыведения препарата увеличивается приблизительно в 2 раза.

Показания к применению.

Инфекции, вызванные чувствительными к действию препарата микроорганизмами: инфекции уха, носа, горла (ангины, отиты); инфекции дыхательных путей (бронхиты, пневмонии, плевриты, абсцессы); инфекции мочеполовой системы; септицемия, бактериемия; интраабдоминальные инфекции (включая перитонит); инфекции кожи и мягких тканей; инфекции костей и суставов; менингит (за исключением листериозного) и другие инфекции ЦНС; профилактика инфекций после хирургических операций на ЖКТ, урологических и акушерско-гинекологических операций.

Способ применения и дозы.

Цефотаксим-БХФЗ назначают внутримышечно и внутривенно, струйно и капельно. Для внутримышечного введения растворяют 500 мг Цефотаксима-БХФЗ в 2 мл, а 1000 мг - в 4 мл стерильной воды для инъекций или 1% раствора лидокаина и вводят глубоко в ягодичную мышцу. Для внутривенного введения растворяют 500-1000 мг Цефотаксима-БХФЗ в 4 мл, а 2000 мг - в 10 мл стерильной воды для инъекций и вводят медленно, на протяжении 3 - 5 минут.

Для внутривенной инфузии растворяют 1000-2000 мг препарата в 50-100 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы и вводят на протяжении 50-60 мин.

Разовая доза Цефотаксима-БХФЗ для взрослых - 1000 мг через каждые 12 часов, в тяжелых случаях дозу увеличивают до 2000 мг через каждые 12 часов или увеличивают количество введений до 3-4 раз в сутки, доводя общую суточную дозу до максимальной - 12 г.

При острой гонорее препарат вводят одноразово, внутримышечно, в дозе 500-1000 мг.

Для профилактики инфекционных осложнений перед или во время вводного наркоза вводят 500-1000 мг, при необходимости инъекцию повторяют через 6-12 часов.

При почечной недостаточности (при клиренсе креатинина 10 мл/мин и менее) дозу уменьшают в 2 раза.

У недоношенных и детей в возрасте до 1 недели суточная доза препарата составляет 50-100 мг/кг, разделяется на два введения в равных дозах в сутки, вводится внутривенно.

У детей в возрасте 1-4 недели суточная доза препарата составляет 75-150 мг/кг, разделяется на три равных дозы и вводится внутривенно.

У детей с массой тела до 50 кг суточная доза Цефотаксима-БХФЗ составляет 50-100 мг/кг и разделяется на 3-4 внутримышечных или внутривенных введения.

При тяжелых инфекциях, в том числе менингите, суточную дозу удваивают. Детям с массой тела 50 кг и более препарат назначают в дозах для взрослых.

Побочное действие.

Со стороны ЖКТ: тошнота, рвота, диарея, боль в животе, дисбиоз, редко - псевдомембранозный колит;

Аллергические реакции: сыпь, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, лихорадка, эозинофилия, анафилактические реакции, редко - анафилактический шок;

Со стороны биохимических показателей: увеличение печеночных трансаминаз, лактатдегидрогеназы, щелочной фосфатазы и билирубина, концентрации азота мочевины и креатинина;

Со стороны периферической крови: нейтропения, транзиторная лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, гипопротромбинемия;

Со стороны ЦНС: головная боль, обратимая энцефалопатия;

биологическим действием: возможно развитие суперинфекции;

Другие: кровотечения и кровоизлияния, аутоиммунная гемолитическая анемия, интерстициальный нефрит, острая печеночная недостаточность, аритмия (при быстром струйном введении).

Противопоказания.

Гиперчувствительность к антибиотикам цефалоспоринового ряда и другим бета-лактамам, гиперчувствительность к лидокаину (внутримышечное введение); кровотечение, энтероколит в анамнезе (особенно неспецифический язвенный колит); беременность, период кормления грудью. Внутримышечное введение противопоказано детям до 2,5 лет.

Передозировка.

Передозировка препарата может вызывать энцефалопатию. Лечение - симптоматическая терапия.

Особенности применения.

С осторожностью назначают Цефотаксим-БХФЗ больным с отягощенным аллергоанамнезом.

В случае применения препарата женщинами, кормящими грудью, кормление следует прекратить.

Одновременное применение Цефотаксима-БХФЗ с нефротоксичными препаратами требует контроля функции почек;

при применении препарата более 10 дней необходим контроль периферической крови.

Лицам пожилого возраста и ослабленным больным для профилактики гипокоагуляции следует назначать препараты витамина К.

При установлении симптома псевдомембранозного колита Цефотаксим-БХФЗ отменяют.

Цефотаксим-БХФЗ не влияет на способность работать с механизмами и управлять транспортными средствами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами.

Автор: Administrator

24.06.10 12:45 - Последнее обновление 24.06.10 14:20

При одновременном применении Цефотаксима-БХФЗ с аминогликозидами, "петлевыми" диуретиками наблюдается повышение нефротоксичности.

При одновременном введении с антиагрегантами, с нестероидными противовоспалительными средствами повышается риск кровотечения. Пробенецид замедляет экскрецию, повышает концентрацию в плазме и период полувыведения.

Цефотаксим-БХФЗ нельзя вводить в одном объеме с другими препаратами из-за возможного взаимодействия.

Условия и срок хранения.

Хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25 °С.

Срок годности - 2 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке!

Условия отпуска.

По рецепту.

Упаковка.

Флаконы по 500 мг или 1000 мг порошка для инъекций; по 5 флаконов в кассете и пенале.

Производитель.

ЗАО НПЦ «Борщаговский химико-фармацевтический завод».

Адрес.

Украина, 03134, г. Киев, ул. Мира, 17.

Заместитель директора Государственного фармакологического центра МЗ Украины В. Г. Лизогуб

ЗАТВЕРДЖЕНО

Наказ Міністерства охорони здоров'я України

09.03.06 № 109

Реєстраційне посвідчення

№ UA/4252/01/01 UA/4252/01/02

**ЦЕФОТАКСИМ-БХФЗ
(CEFOTAXIME-BCPP)**

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату Цефотаксим

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви:

Cefotaxime; натрій

(6R,7R)-3-[(ацетилокси)метил]-7-[[[(г)-2-(2-амінотіазол-4-іл)-2-(метоксііміно)ацетил]аміно]-8-оксо-5-тіа-1-азабіцикло[4.2.0.]окт-2-ен-2-карбоксилат;

основні фізико-хімічні властивості:

порошок білого або злегка жовтого кольору. Гігроскопічний;

склад: 1 флакон містить цефотаксиму натрієвої солі стерильної у перерахуванні на цефотаксим 500 мгабо 1000 мг.

Форма випуску.

Порошок для приготування розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Протимікробні засоби для системного застосування.

Інші бета-лактамі антибіотики.

Цефалоспорини третього покоління.

Код АТС J01D D01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Цефотаксим-БХФЗ - напівсинтетичний антибіотик групи цефалоспоринів III покоління, широкого спектра дії, для парентерального введення.

Препарат ефективний відносно багатьох грампозитивних і має високу активність до грамнегативних бактерій.

Впливає бактерицидно на штами бактерій, які стійкі до пеніциліну, аміноглікозидів, сульфаніламідів.

Механізм антимікробної дії Цефотаксиму-БХФЗ пов'язаний з пригніченням активності ферменту транспептидази, блокадою пептидоглікану, порушенням утворення мукопептиду клітинної стінки мікроорганізмів.

Препарат стійкий відносно чотирьох з п'яти бета-лактамаз грамнегативних бактерій та пеніцилінази стафілококів.

Активний відносно *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, деяких штамів *Enterococcus spp.*, *Streptococcus pneumoniae* (особливо *Diplococcus pneumoniae*), *Streptococcus pyogenes* (бета-гемолітичні стрептококи групи А), *Streptococcus agalactiae* (стрептококи групи В), *Bacillus subtilis*, *Bacillus myroides*, *Corinebacterium diphtheriae*, *Erysipelothrix insidiosa*, *Eubacterium*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae*, у тому числі ампіцилінорезистентних штамів, *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella oxytoca*, *Klebsiella pneumoniae*, *Morganella morganii*, *Neisseria meningitidis*, *Neisseria gonorrhoeae*, у тому числі штамів, які виробляють пеніциліназу, *Propionibacterium*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Proteus inconstans*, *Serratia spp.*, *Veillonella*, *Yersinia*, *Bordetella pertussis*, *Moraxella*, *Aeromonas hydrophilia*, *Fusobacterium*, *Bacteroides spp.*, *Clostridium species*, *Peptostreptococcus species*, *Peptococcus spp.*

Впливає на деякі штами *Pseudomonas aeruginosa*, *Acinetobacter*, *Helicobacter pylori*, *Bacteroides fragilis*, *Clostridium difficile*.

Може діяти на мультирезистентні штами, що стійкі до пеніцилінів, цефалоспоринів перших двох поколінь, аміноглікозидів.

Препарат менш активний до грампозитивних коків, ніж цефалоспорини I-II поколінь.

До дії препарату стійкі стрептококи групи D, *Listeria spp.* та метицилінстійкі стафілококи.

Фармакокінетика.

Максимальна концентрація у крові після внутрішньом'язового введення препарату у дозах 500 мг і 1000 мг спостерігається через 30 хвилин після введення і становить 11 мкг/мл і 21 мкг/мл відповідно.

Через 5 хвилин після внутрішньовенного введення 500 мг, 1000 мг або 2000 мг максимальна концентрація в крові становить відповідно 39, 100, 214 мкг/мл.

У крові препарат на 25-40 % зв'язується з білками.

Бактерицидна концентрація у крові зберігається більше 12 годин.

Препарат добре проникає у тканини (створює ефективну концентрацію у міокарді, кістковій тканині, жовчному міхурі, шкірі, м'яких тканинах), рідини організму (виявляється в ефективних концентраціях в спинномозковій, перикардіальній, плевральній, перитоніальній, синовіальній рідинах), проходить крізь плаценту, проникає у грудне молоко.

Цефотаксим-БХФЗ виводиться у значній кількості із сечею (90%) (в незміненому вигляді близько 60-70 % та у вигляді активних метаболітів близько 20-30 %, із них 15-25 % є основним метаболітом - дезацетил-цефотаксимом, що має протимікробну активність).

Період напіввиведення при внутрішньовенному введенні - 1 година, при внутрішньом'язовому - 1-1,5 години.

При повторних внутрішньовенних введеннях у дозі 1000 мг кожні 6 годин протягом 14 діб кумуляції не спостерігається.

У немовлят період напіввиведення становить 0,75-1,5 години, у недоношених - від 1,4 до 6,4 години, у пацієнтів старше 80 років та при нирковій недостатності період напіввиведення препарату збільшується приблизно у 2 рази.

Показання для застосування.

Інфекції, спричинені чутливими до дії препарату мікроорганізмами: інфекції вуха, носа, горла (ангіни, отити);

інфекції дихальних шляхів (бронхіти, пневмонії, плеврити, абсцеси);

інфекції сечостатевої системи; септицемія, бактеріємія;

інтраабдомінальні інфекції (включаючи перитоніт);

інфекції шкіри та м'яких тканин;

інфекції кісток та суглобів;

менінгіт (за винятком лістеріозного) та інші інфекції ЦНС;

профілактика інфекцій після хірургічних операцій на ШКТ, урологічних та

акушерсько-гінекологічних операцій.

Спосіб застосування та дози.

Цефотаксим-БХФЗ призначають внутрішньом'язово та внутрішньовенно, струминно і краплинно.

Для внутрішньом'язового введення розчиняють 500 мг Цефотаксиму-БХФЗ у 2 мл, а 1000 мг - у 4 мл стерильної води для ін'єкцій або 1% розчину лідокаїну та вводять глибоко у сідничний м'яз.

Для внутрішньовенного введення розчиняють 500-1000 мг Цефотаксиму-БХФЗ у 4 мл, а 2000 мг - у 10 мл стерильної води для ін'єкції та вводять повільно, протягом 3-5 хвилин.

Для внутрішньовенної інфузії розчиняють 1000-2000 мг препарату у 50-100 мл ізотонічного розчину натрію хлориду або 5% розчину глюкози та вводять протягом 50-60 хв.

Разова доза Цефотаксиму-БХФЗ для дорослих - 1000 мг через кожні 12 годин, у тяжких випадках дозу збільшують до 2000 мг через кожні 12 годин або збільшують кількість введенень до 3-4 раз на добу, доводячи загальну добову дозу до максимальної -12 г.

При гострій гонорейі препарат вводять одноразово, внутрішньом'язово, у дозі 500-1000 мг.

Для профілактики інфекційних ускладнень перед або під час вступного наркозу вводять 500-1000 мг, за необхідності ін'єкцію повторюють через 6-12 годин.

При нирковій недостатності (при кліренсі креатинину 10 мл/хв та менше) дозу зменшують у 2 рази.

У недоношених та дітей віком до 1 тижня добова доза препарату становить 50-100 мг/кг, розділяється на два введення в рівних дозах за добу, вводиться внутрішньовенно.

У дітей віком 1-4 тижні добова доза препарату становить 75-150 мг/кг, розділяється на три рівних дози та вводиться внутрішньовенно.

У дітей з масою тіла до 50 кг добова доза Цефотаксиму-БХФЗ становить 50-100 мг/кг і розділяється на 3-4 внутрішньом'язових або внутрішньовенних введення.

При важких інфекціях, в тому числі менінгіті, добову дозу подвоюють.

Дітям з масою тіла 50 кг і більше препарат призначають в дозах для дорослих.

Побічна дія.

З боку ШКТ: нудота, блювання, діарея, біль у животі, дисбіоз, рідко - псевдомембранозний коліт;

Алергічні реакції: висипання, мультиформна ексудативна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, пропасниця, еозинофілія, анафілактичні реакції, рідко - анафілактичний шок;

З боку біохімічних показників: збільшення печінкових трансаміназ, лактатдегідрогенази, лужної фосфатази та білірубіну, концентрації азоту сечовини та креатиніну;

З боку периферичної крові: нейтропенія, транзиторна лейкопенія, тромбоцитопенія, агранулоцитоз, гіпопротромбінемія:

З боку ЦНС: головний біль, оборотна енцефалопатія;

Місцеві реакції: біль, запалення тканин, флебіт;

Ефекти, зумовлені біологічною дією: можливий розвиток суперінфекції;

Інші: кровотечі та крововиливи, аутоімунна гемолітична анемія, інтерстиціальний нефрит, гостра печінкова недостатність, аритмія (при швидкому струминному введенні).

Протипоказання.

Гіперчутливість до антибіотиків цефалоспоринового ряду та інших бета-лактамічних антибіотиків, гіперчутливість до лідокаїну (внутрішньом'язове введення); кровотеча, ентероколіт в анамнезі (особливо неспецифічний виразковий коліт); вагітність, період годування груддю.

Внутрішньом'язове введення протипоказане дітям до 2,5 років.

Передозування.

Передозування препарату може спричинювати енцефалопатію. Лікування - симптоматична терапія.

Особливості застосування.

З обережністю призначають Цефотаксим-БХФЗ хворим з обтяженим алергоанамнезом.

У разі застосування препарату жінками, які годують груддю, годування слід припинити.

Одночасне застосування Цефотаксиму-БХФЗ з нефротоксичними препаратами потребує контролю функції нирок; при застосуванні препарату більше 10 днів необхідний контроль периферичної крові.

Особам літнього віку та послабленим хворим для профілактики гіпокоагуляції слід призначати препарати вітаміну К.

При встановленні симптому псевдомембранозного коліту Цефотаксим-БХФЗ відмінюють.

Цефотаксим-БХФЗ не впливає на здатність працювати з механізмами та керувати транспортними засобами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

При одночасному застосуванні Цефотаксиму-БХФЗ з аміноглікозидами, "петльовими" діуретиками спостерігається підвищення нефротоксичності.

При одночасному введенні з антиагрегантами, з нестероїдними протизапальними засобами підвищується ризик кровотечі.

Пробенецид уповільнює екскрецію, підвищує концентрацію у плазмі і період напіввиведення.

Цефотаксим-БХФЗ не можна вводити в одному об'ємі з іншими препаратами через можливу взаємодію.

Умови та термін зберігання.

Зберігати в сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Термін придатності - 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці!

Умови відпуску.

За рецептом.

Упаковка.

Флакони по 500 мг або 1000 мг порошку для ін'єкцій; по 5 флаконів у касеті та пеналі.

Виробник.

ЗАТ НВЦ «Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод».

Адреса.

Україна, 03134, м. Київ, вул. Миру, 17.

Заступник директора Державного фармакологічного центру МОЗ України В. Г. Лизогуб