

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ
ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Цефосин®

Регистрационный номер Р N002102/02

Торговое название препарата: Цефосин®

Международное непатентованное название: цефотаксим

Химическое название: [6R - [бальфа, 7бета(Z)]] - 3 - [(ацетилокси) метил] - 7 - [[(2 - амино - 4 - тиазолил) (метокси - имино) ацетил] амино] - 8 - оксо - 5 - тиа - 1 - азабицикло[4.2.0] окт - 2 - ен - 2 - карбоновая кислота (в виде натриевой соли)

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения.

Состав. Активное вещество: Цефотаксим натрия (в пересчете на цефотаксим) - 0,5 г, 1 г, 2 г

Описание. Белый или белый с желтоватым оттенком порошок.

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 другим антибиотикам: *Staphylococcus* spp. (в т.ч. *Staphylococcus aureus*, включая штаммы, образующие пенициллиназу), *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, 1 и 2 г время достижения максимальной концентрации - 5 мин, максимальная концентрация составляет 39, 101.7 и 214 мкг/мл соответственно. После внутримышечного введения в дозах 0.5 и 1 г время достижения максимальной концентрации – 0.5 ч и составляет 11 и 21 мкг/мл соответственно.

Связь с белками плазмы - 30-50 %. Биодоступность - 90-95 %.

Создает терапевтические концентрации в большинстве тканей (миокард, кости, желчный пузырь, кожа, мягкие ткани) и жидкостей (синовиальная, перикардальная, плевральная, мокрота, желчь, моча, спинномозговая жидкость) организма. Объем распределения – 0.25-0.39 л/кг.

Период полувыведения - 1 ч при внутривенном введении и 1-1.5 ч - при внутримышечном 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 - М2 и М3).

При хронической почечной недостаточности и у лиц пожилого возраста период полувыведения увеличивается в 2 раза. Период полувыведения у новорожденных – 0.75-1.5 ч, у недоношенных новорожденных детей (масса тела менее 1500 г) возрастает до 4.6 ч; у детей с массой тела более 1500 г – 3.4 ч. При повторных внутривенных введениях в дозе 1 г каждые 6 ч в течение 14 сут кумуляции не наблюдается. Цефотаксим проходит через плаценту и проникает в грудное молоко.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными микроорганизмами:

- инфекции центральной нервной системы (менингит),
- инфекции дыхательных путей и ЛОР-органов,
- инфекции мочевыводящих путей,
- инфекции костей и суставов,
- инфекции кожи и мягких тканей,
- инфекции органов малого таза,
- гонорея,
- инфицированные раны и ожоги,
- перитонит,
- сепсис,
- абдоминальные инфекции,
- эндокардит,
- болезнь Лайма,

- сальмонеллезы,
- инфекции на фоне иммунодефицита.

Профилактика инфекций после хирургических операций (в т.ч. урологических, акушерско-гинекологических, на желудочно-кишечном тракте).

Противопоказания

Гиперчувствительность (в т.ч. к пенициллинам, другим цефалоспорином, карбапенемам), беременность, детский возраст - до 2,5 лет (внутримышечное введение).

С осторожностью

Период новорожденности; хроническая почечная недостаточность, неспецифический язвенный колит (в т.ч. в анамнезе).

Применение при беременности и в период лактации

Применение препарата при беременности противопоказано.

При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Препарат вводят внутривенно (струйно или капельно), внутримышечно.

Взрослым и детям с массой тела 50 кг и более: при неосложненных инфекциях, а также при инфекциях мочевыводящих путей - внутримышечно или внутривенно, по 1 г каждые 8-12 ч; при неосложненной острой гонорее - внутримышечно, 1 г однократно; при инфекциях средней тяжести - внутримышечно или внутривенно, по 1-2 г каждые 12 ч; при тяжелом течении инфекций, например при менингите - внутривенно, 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 - внутривенно, 1 г, затем через 6 и 12 ч после первой дозы - дополнительно по 1 г.

При клиренсе креатинина 20 мл/мин/1.73 м² и менее суточную дозу уменьшают в 2 раза.

Недоношенным и новорожденным до 1 нед - внутривенно, 50 мг/кг каждые 12 ч; в возрасте 1 - 4 нед - внутривенно, 50 мг/кг каждые 8 ч; детям, массой тела до 50 кг - внутривенно или внутримышечно (детям 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, внутримышечно или внутривенно, в 4-6 приемов, максимальная суточная доза - 12 г.

Приготовление инъекционных растворов: для внутривенной инъекции в качестве растворителя используют воду для инъекций (0.5-1 г разводят в 4 мл растворителя, 2 г - в 10 мл); для внутривенной 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 внутримышечного 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 нервной системы: головная боль, головокружение.

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

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

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

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

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

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

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 аминогликозидами, полимиксином В и «петлевыми» диуретиками.

Лекарственные средства, 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 цефалоспориновым антибиотикам.

При лечении препаратом свыше 10 дней необходим контроль числа форменных элементов крови.

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

При одновременном применении цефотаксима и этанола возможно развитие 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 по 0,5 г, 1 г, 2 г активного вещества во флаконах бесцветного или темного стекла вместимостью 10 мл или 20 мл.

1, 5 или 10 флаконов с инструкцией по применению в пачке из картона.

50 флаконов с равным количеством инструкций по применению в коробке из картона (для стационаров)

Растворитель “Вода для инъекций” в стеклянных ампулах по 5 мл.

1 флакон с препаратом по 0,5 г, 1 г, 1 ампула с растворителем в контурной ячейковой упаковке из плёнки поливинилхлоридной. 1 контурная ячейковая упаковка с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке из картона.

1 флакон с препаратом по 2 г, 2 ампулы с растворителем в контурной ячейковой упаковке из плёнки поливинилхлоридной. 1 контурная ячейковая упаковка с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке из картона.

1 флакон с препаратом по 0,5 г, 1 г, 1 ампула с растворителем с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке или коробке из картона.

1 флакон с препаратом по 2 г, 2 ампулы с растворителем с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке или коробке из картона.

5 флаконов с препаратом в контурной ячейковой упаковке.

1 контурная ячейковая упаковка с препаратом по 0,5 г, 1 г, 1 контурная ячейковая упаковка с 5 ампулами растворителя с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке из картона.

1 контурная ячейковая упаковка с препаратом по 2 г, 2 контурные ячейковые упаковки с 5 ампулами растворителя с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачке из картона.

При использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой скарификатор ампульный не вкладывают.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Претензии от покупателей принимает предприятие-производитель:

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»).

640008, Россия, г. Курган, пр. Конституции, 7.

Тел/факс: (3522) 48-16-89.

Интернет-сайт: [http:// www.kurgansintez.ru](http://www.kurgansintez.ru)