

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ЦЕФОТАКСИМ-ДАРНИЦЯ
(CEFOTAXIME-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: cefotaxime;

1 флакон містить цефотаксиму натрієвої солі у перерахуванні на цефотаксим 0,5 г або 1 г.

Лікарська форма. Порошок для розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Антибактеріальні засоби для системного застосування. Цефалоспорини. Код АТС J01D D01.

Клінічні характеристики.

Показання.

Інфекції, спричинені чутливими до дії препарату мікроорганізмами:

- інфекції ЛОР-органів (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 центральної нервової системи.

Профілактика інфекцій після хірургічних операцій на травному тракті, урологічних та акушерсько-гінекологічних операцій.

Протипоказання.

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

АВ-блокади без встановленого водія серцевого ритму, тяжка серцева недостатність.

Спосіб застосування та дози.

Препарат застосовують для внутрішньовенного струминного та краплинного та внутрішньом'язового введення.

Перед застосуванням препарату необхідно провести шкірні проби на чутливість до антибіотика та до лідокаїну.

Для внутрішньовенного струминного введення 1 г порошку розчинити у 8 мл стерильної води для ін'єкцій. Вводити повільно протягом 3-5 хвилин.

Для внутрішньовенної інфузії 1 г порошку розчинити у 50 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або 5 % розчині глюкози. Тривалість інфузії становить 50-60 хвилин.

Для внутрішньом'язового введення 1 г порошку розчинити у 4 мл стерильної води для ін'єкцій або 1 % розчині лідокаїну та вводити глибоко у сідничний м'яз.

Тривалість курсу лікування встановлюють індивідуально.

Дорослим і дітям з масою тіла 50 кг і більше призначають Цефотаксим-Дарниця у дозі 1 г кожні 12 годин. У тяжких випадках призначають препарат у дозі 1 г 3-4 рази на добу. Максимальна добова доза становить 12 г.

При неускладнених інфекціях, а також при інфекціях сечовивідних шляхів призначають внутрішньом'язово або внутрішньовенно у дозі 1 г кожні 12 годин;

при неускладненій гострій гонорейі призначають у дозі 1 г внутрішньом'язово 1 раз на добу або внутрішньовенно;

при інфекціях середньої тяжкості призначають препарат у дозі 1-2 г кожні 12 годин;

при тяжких інфекціях (менінгіт) призначають у дозі 2 г препарату внутрішньовенно кожні 6-8 годин. Дітям з масою тіла до 50 кг препарат призначають у дозі 50-100 мг/кг маси тіла на добу, розподілений на 3-4 внутрішньом'язові або внутрішньовенні введення. При тяжких інфекціях (у т.ч. менінгіт) добову дозу збільшують до 100-200 мг/кг маси тіла і вводять 4-6 разів внутрішньовенно або внутрішньом'язово. Для недоношених дітей та дітей віком до 1-го тижня життя добова доза препарату становить 50 мг/кг маси тіла, розділений на дві рівні дози, і вводиться внутрішньовенно. Для дітей 1-4-го тижня життя добова доза препарату становить 50-100 мг/кг маси тіла, розподілений на три рівні дози, і вводиться внутрішньовенно. При профілактиці розвитку інфекцій перед хірургічним втручанням під час введення наркозу одноразово вводять 1 г Цефотаксиму-Дарниця. У разі необхідності дозу повторюють через 6-12 годин. При порушеннях функції нирок дозу препарату потрібно зменшити. При кліренсі креатиніну 10 мл/хв і менше добову дозу препарату зменшують удвічі.

Побічні реакції.

З боку травного тракту: нудота, блювання, діарея, метеоризм, біль у животі, дисбіоз, рідко – стоматит, глосит, псевдомембранозний коліт.

Алергічні реакції: гіперемія, висипання, свербіж шкіри, кропив'янка, бронхоспазм, мультиформна ексудативна еритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз (Лайєлла), пропасниця, анафілактичні реакції, ангіоневротичний набряк, рідко – анафілактичний шок.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит, гостра печінкова недостатність, порушення функції печінки, жовтяниця, холестаза.

З боку біохімічних показників: збільшення рівня печінкових трансаміназ, лактатдегідрогенази, лужної фосфатази та білірубину, концентрації азоту сечовини та креатиніну, позитивна реакція Кумбса.

З боку периферичної крові: гранулоцитопенія, нейтропенія, транзиторна лейкопенія, тромбоцитопенія, агранулоцитоз, анізоцитоз, еозинофілія, гіпопротромбінемія, гемолітична анемія, гіпокоагуляція.

З боку центральної нервової системи: головний біль, запаморочення, судоми, оборотна енцефалопатія, втомлюваність, слабкість.

Реакції у місці введення: біль та інфільтрат у місці внутрішньом'язового введення, біль по ходу вени, запалення тканин, флебіт.

Ефекти, зумовлені біологічною дією: можливий розвиток суперінфекції (у т.ч. кандидоз, вагініт).

Інші: кровотечі та крововиливи, аутоімунна гемолітична анемія, інтерстиціальний нефрит, аритмії (при швидкому струминному введенні).

При лікуванні інфекцій, спричинених спірохетою, може виникнути ускладнення, подібне до реакції Герксгеймера. Це може призвести до гарячки, ознобу, головного болю, болю у суглобах.

Передозування.

Симптоми: можливі гарячка, лейкопенія, тромбоцитопенія, гостра гемолітична анемія, шкірні, шлунково-кишкові реакції та реакції печінки, задишка, ниркова недостатність, стоматит, анорексія, тимчасова втрата слуху, втрата орієнтації у просторі, енцефалопатія (особливо при нирковій недостатності).

Лікування. Специфічний антидот відсутній. Рівні цефотаксиму у сироватці можна знизити гемодіалізом або перитонеальним діалізом. У разі необхідності проводять симптоматичну терапію.

При появі анафілактичного шоку слід негайно вжити відповідних заходів. При перших ознаках реакції підвищеної чутливості (шкірні висипання, кропив'янка, головний біль, нудота, втрата свідомості) введення цефотаксиму слід припинити. У разі тяжкої реакції підвищеної чутливості або анафілактичної реакції слід розпочати відповідну терапію (введення епінефрину та/або глюкокортикоїдів). При інших клінічних станах можуть знадобитися додаткові заходи, наприклад, штучне дихання, застосування антагоністів гістамінових рецепторів. У разі судинної недостатності слід вжити реанімаційні заходи.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату у період вагітності протипоказане.

На період лікування препаратом слід припинити годування груддю.

Діти.

Дітям віком до 2,5 років препарат внутрішньом'язово не призначають.

Особливості застосування.

З обережністю призначають препарат при порушеннях функції нирок або печінки, при підвищеній чутливості до пеніцилінів в анамнезі. При порушеннях функції нирок дозу препарату слід зменшити з урахуванням вираженості ниркової недостатності і чутливості збудника. При тривалому застосуванні препарату слід контролювати функцію нирок, проводити профілактику дисбактеріозу. Доцільно регулярно контролювати клітинний склад периферичної крові, функцію печінки. Під час застосування препарату можливий розвиток хибнопозитивної проби Кумбса.

Анафілактичні реакції. Застосування цефалоспоринів вимагає уточнення алергологічного анамнезу (алергічний діатез, реакції гіперчутливості до бета-лактамних антибіотиків). При розвитку у пацієнта реакції гіперчутливості лікування слід припинити. Застосування цефотаксиму суворо протипоказане пацієнтам із наявністю в анамнезі реакції гіперчутливості негайного типу до цефалоспоринів. У випадку будь-яких сумнівів присутність лікаря при першому введенні препарату обов'язкова через можливий розвиток анафілактичної реакції. Відома перехресна алергія між цефалоспорином і пеніцилінами, що виникає у 5-10 % випадків. У людей, в анамнезі яких є вказівки на алергію до пеніцилінів, препарат застосовують з особливою обережністю.

Псевдомембранозний коліт. У перші тижні лікування може виникати псевдомембранозний коліт, що проявляється тяжкою тривалою діареєю. Діагноз підтверджується при колоноскопії і/або гістологічному дослідженні. Ці ускладнення розцінюють як досить серйозні: негайно припиняють введення препарату і призначають адекватну терапію, що включає пероральний прийом ванкоміцину або метронідазолу. Поєднання застосування цефотаксиму з нефротоксичними препаратами вимагає контролю функції нирок, застосування більше 10 днів – контролю складу крові. Пацієнтам літнього віку і ослабленим пацієнтам призначають вітамін К (профілактика гіпокоагуляції).

Як і при прийомі інших антибіотиків широкого спектра дії, тривале застосування може призводити до підвищеного росту нечутливих мікроорганізмів, що потребує припинення лікування. Якщо під час лікування виникає суперінфекція, слід застосовувати антимікробну терапію. При визначенні рівня глюкози у сечі методом відновлення можуть бути одержані хибнопозитивні результати. Для запобігання цьому слід використовувати ферментний тест.

Під час лікування не можна вживати алкоголь, оскільки можливі ефекти, схожі з дією дисульфіраму (гіперемія обличчя, спазм у животі і ділянці шлунка, нудота, блювання, головний біль, зниження артеріального тиску, тахікардія, утруднення дихання).

У разі застосування лідокаїну в якості розчинника при внутрішньом'язовому введенні перед ін'єкцією слід робити шкірну пробу на переносимість лідокаїну.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Через можливість виникнення побічних реакцій з боку нервової системи слід уникати керування транспортними засобами або роботи з іншими механізмами у період лікування.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні з нефротоксичними препаратами (аміноглікозиди) і сильнодіючими діуретиками (етакринова кислота, фуросемід), колістином, поліміксином підвищується ризик розвитку ниркової недостатності.

Під час лікування цефотаксимом може знижуватись ефективність пероральних контрацептивів, тому в цей період необхідно використовувати додаткову контрацепцію. Цефотаксим не слід застосовувати разом із бактеріостатичними антибіотиками (наприклад тетрациклінами, еритроміцином і хлорамфеніколом), оскільки можливий антагоністичний ефект.

При сумісній терапії розчини цефотаксиму не слід змішувати з розчинами аміноглікозидів – їх необхідно вводити окремо.

Одночасне застосування ніфедипіну підвищує біодоступність цефотаксиму на 70 %.

Пробенецид блокує канальцеву секрецію цефотаксиму та подовжує його період напіввиведення.

Цефотаксим не слід застосовувати разом з лідокаїном:

- ☐ при внутрішньовенному введенні;
- ☐ дітям віком до 30 місяців;
- ☐ пацієнтам з гіперчутливістю до лідокаїну в анамнезі;

- пацієнтам з блокадою серця.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Цефотаксим-Дарниця – напівсинтетичний цефалоспориновий антибіотик III покоління для парентерального застосування. Діє бактерицидно. Має широкий спектр дії.

До препарату чутливі: *Streptococci* (за винятком групи D), включаючи *Streptococcus pneumoniae*; *Staphylococcus aureus*, у т.ч. пеніциліназоутворювальні та пеніцилінаzoneутворювальні штами; *Bacillus subtilis* і *mycoides*; *Neisseria gonorrhoeae* (пеніциліназоутворювальні та пеніцилінаzoneутворювальні штами), *Neisseria meningitidis*, інші види *Neisseria*; *Escherichia coli*; *Klebsiella spp.*, включаючи *Klebsiella pneumoniae*; *Enterobacter spp.* (деякі штами резистентні); *Serratia spp.*; *Proteus* (індолпозитивні та індолнегативні види); *Salmonella*; *Citrobacter spp.*; *Providencia*; *Shigella*; *Yersinia*; *Haemophilus influenzae* і *parainfluenzae* (пеніциліназоутворювальні та пеніцилінаzoneутворювальні штами, у т.ч. стійкі до ампіциліну); *Bordetella pertussis*; *Moraxella*; *Aeromonas hydrophilia*; *Veillonella*; *Clostridium perfringens*; *Eubacterium*; *Propionibacterium*; *Fusobacterium*; *Bacteroides spp.* і *Morganella*.

До дії препарату непостійно чутливі: *Pseudomonas aeruginosa*; *Acinetobacter*; *Helicobacter pylori*; *Bacteroides fragilis* і *Clostridium difficile*

До дії препарату стійкі: *Streptococcus* групи D, *Listeria* і метициліностійкі стафілококи.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Через 5 хвилин після одноразового внутрішньовенного введення 1 г цефотаксиму його концентрація у сироватці крові становить 100 мкг/мл. Після внутрішньом'язового введення цефотаксиму у тій же дозі максимальна концентрація у крові досягається через 0,5 години і становить 24 мкг/мл. Бактерицидна концентрація у крові зберігається протягом 12 годин.

Розподіл. Зв'язування з білками плазми крові становить у середньому, 25-40 %. Цефотаксим добре проникає у тканини і біологічні рідини організму. Виявляється в ефективних концентраціях у плевральній, перитонеальній, синовіальній рідинах. Проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр.

Біотрансформується з утворенням активного метаболіту.

Виведення. Приблизно 60-70 % введеної дози препарату виводиться з сечею у незміненому вигляді, а решта – у вигляді метаболітів. Частково виводиться з жовчю. Період напіввиведення препарату становить 1 годину при внутрішньовенному введенні і 1-1,5 години – при внутрішньом'язовому введенні. При нирковій недостатності та у пацієнтів літнього віку період напіврозпаду препарату збільшується приблизно у 2 рази. У новонароджених дітей період напіврозпаду препарату становить від 0,75 до 1,5 години, а у недоношених дітей – від 1,4 до 6,4 години.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: кристалічний порошок білого або злегка жовтуватого кольору, гігроскопічний.

Несумісність.

Розчин препарату несумісний з розчинами аміноглікозидів в одному шприці або крапельниці. Для розведення застосовувати розчини, перелічені у розділі «Спосіб застосування та дози».

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C.

Упаковка.

По 0,5 г або 1 г порошку у флаконі; по 1, 5, 40 флаконів в упаковці.

По 1 флакону по 0,5 г порошку та 1 ампулі розчинника (Вода для ін'єкцій-Дарниця в ампулі по 5 мл) в упаковці.

По 1 флакону по 1 г порошку та 1 ампулі розчинника (Вода для ін'єкцій-Дарниця в ампулі по 10 мл) в упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.