ДАТА ВВЕДЕНИЯ 25 АВГУСТА 2006Г
ПРИКАЗ ФЕДЕРАЛЬНОЙ СЛУЖБЫ ПО НАДЗОРУ В СФЕРЕ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
ОТ 25.08.06 № 6611ЗМ-ПР-РЕГ/06

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

ЦЕЗОЛИН

Регистрационный номер:

Торговое название: Цезолин

Международное непатентованное название: цефазолин

Химическое название: (6R-транс)-3-5-Метил-1,3,4-тиадиазол-2-ил)-тиометил-8-оксо-7-1Н-тетразол-1-илацетил)амино-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. Один флакон содержит цефазолина 0,5 г или 1,0 г в виде цефазолина натриевой соли.

Описание: белый или почти белый кристаллический порошок

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик, цефалоспорин.

Код АТХ: [J01DA04].

ФАМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика: Цефалоспориновый антибиотик I поколения для парентерального применения. Действует бактерицидно, нарушая синтез клеточной стенки микроорганизмов. Имеет широкий спектр действия, активен в отношении грамположительных (Staphylococcus spp., Staphylococcus aureus (не продуцирующие и продуцирующие пенициллиназу; в т.ч. Streptococcus pneumoniae), Corynebacterium diphtheriae, Bacillus anthracis) и грамотрицательных (Neisseria meningitidis, Neisseria gonorrhoeae, Shigella spp., Salmonella spp., Escherichia coli, Klebsiella spp., Treponema spp., Leptospira spp.) микроорганизмов. Активен в отношении Haemophilus influenzae, некоторых штаммов Enterobacter и Enterococcus.

Неэффективен в отношении Pseudomonas aeruginosa, индолположительных штаммов Proteus spp., Mycobacterium tuberculosis, Serratia spp., анаэробных микроорганизмов, метициллинрезистентных штаммов Staphylococcus spp.

Фармакокинетика: Время достижения максимальной концентрации (Tcmax) при внутримышечном (в/м) введении в дозе 500 и 1000 мг, соответственно – 2 и 1 ч; Максимальная концентрация (Cmax) - 38 и 64 мкг/мл; после внутривенного (в/в) введения TCmax - в конце инфузии, после в/в введения 1000 мг Cmax - 180 мкг/мл. Проникает в суставы, ткани сердечно-сосудистой системы, в брюшную полость, почки и мочевыводящие пути, плаценту, среднее ухо, дыхательные пути, кожу и

мягкие ткани. В небольших количествах выделяется с грудным молоком. Концентрация в ткани желчного пузыря и желчи значительно выше, чем в сыворотке крови. При обструкции желчного пузыря концентрация в желчи меньше, чем в плазме. Объем распределения - 0.12 л/кг. Связь с белками плазмы - 85%. Период полувыведения (T1/2) при в/м введенении – 1.8 ч, при в/в введении - 2 ч. При нарушении функции почек T1/2 - 20-40 ч.

Выводится преимущественно почками в неизмененном виде: в течение первых 6 ч - 60-90%, через 24 ч - 70-95%. Cmax в моче 1000 мкг/мл и 4000 мкг/мл после в/м введения и дозах 500 мг и 1000 м, соответственно.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Бактериальные инфекции верхних и нижних дыхательных путей, мочевыводящих и желчевыводящих путей, органов малого таза, кожи и мягких тканей, костей и суставов; эндокардит, сепсис, перитонит, средний отит, остеомиелит, мастит; раневые, ожоговые и послеоперационные инфекции; сифилис, гонорея и др. заболевания, вызванные чувствительными к цефазолину микроорганизмами. Профилактика хирургических инфекций в пред- и послеоперационном периоде.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к препаратам группы цефалоспоринов и другим бета-лактамным антибиотикам.

Беременность и лактация. При необходимости применения препарата грудное вскармливание прекращают.

Не назначают новорожденным (до 1 месяца).

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

Почечная/печеночная недостаточность, псевдомембранозный энтероколит.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутримышечно, внутривенно (струйно или капельно).

Средняя суточная доза для взрослых – 1 г; кратность введения – 2 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 6 г, кратность введения может быть увеличена до 3-4 раз в сутки.

Средняя продолжительность лечения Цезолином составляет 7-10 дней. Для профилактики послеоперационной инфекции – 1 г за 30 мин до операции, 0,5-1 г – во время операции и по 0,5-1 г – каждые 6-8 ч в течение суток после операции.

Больным с нарушениями функции почек требуется изменение режима дозирования, в соответствии со значениями клиренса креатинина (КК). При КК 55 мл/мин и более, или при содержании креатинина в плазме 1,5 мг% и менее, можно вводить полную дозу. При КК 54-35 мл/мин или при содержании креатинина в плазме 3-1,6 мг% - можно полную дозу, но интервалы между инъекциями увеличить до 8 ч. При КК 34-11 мл/мин или содержанием креатинина в плазме 4,5-3,1 мг% - ½ дозы с интервалами 12 ч. Больным с КК 10 мл/мин и менее, или при содержании креатинина в плазме 4,6 мг% и более – ½ средней дозы каждые 18-24 ч. Все рекомендуемые дозы вводят после начальной ударной дозы.

Средняя суточная доза для детей – 20-50 мг/кг; при тяжелом течении инфекции доза может быть увеличена до 100 мг/кг/сут. Кратность введения – 3-4 раза в сутки. У детей с нарушениями функции почек, коррекцию режима дозирования производят в зависимости от значений КК. При КК 70-40 мл/мин – 60 % от средней суточной дозы и вводят через 12 ч. При КК 40-20 мл/мин – 25 % средней суточной дозы с

интервалом 12 ч. Детям с КК 5-20 мл/мин – 10 % средней суточной дозы каждые 24 ч. Все рекомендуемые дозы вводят после начальной ударной дозы.

Приготовление растворов.

Для внутримышечного введения препарат растворяют в 2-3 мл воды для инъекций, изотонического раствора хлорида натрия или 0,25-0,5% растворе новокаина и вводят глубоко в мышцу.

Для внутривенного капельного введения препарат растворяют в 100-250 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5 % растворе глюкозы; инфузию проводят в течение 20-30 минут (скорость введения 60-80 капель в минуту).

Для внутривенного струйного введения разовую дозу препарата разводят в 10 мл изотонического раствора натрия хлорида и вводят медленно в течение 3-5 мин.

Во время разведения флаконы энергично встряхивают до полного растворения порошка.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

Аллергические реакции: гипертермия, кожная сыпь, крапивница, кожный зуд, бронхоспазм, эозинофилия, отек Квинке, артралгия, анафилактический шок, мультиформная эритема, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны нервной системы: судороги.

Со стороны мочевыделительной системы: у больных с заболеваниями почек при лечении большими дозами (6 г) - нарушение функции почек (в этих случаях дозу снижают и лечение проводят под контролем динамики содержания азота мочевины и креатинина в крови).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боль в животе, псевдомембранозный энтероколит, редко - холестатитечекая желтуха, гепатит.

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

При длительном лечении - дисбактериоз, суперинфекция, вызываемая устойчивыми к антибиотику штаммами, кандидамикоз (в т.ч. кандидозный стоматит).

Лабораторные показатели: положительная реакция Кумбса, повышение активности "печеночных" трансаминаз, гиперкреатининемия, увеличение протромбинового времени.

Местные реакции: при в/м введении - болезненность (в месте введения), при в/в введении - флебит.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Не рекомендуется одновременный прием с антикоагулянтами и диуретиками. При одновременном применении цефазолина и "петлевых диуретиков" происходит блокада его канальцевой секреции.

Аминогликозиды увеличивают риск развития поражения почек. Фармацевтически несовместим с аминогликозидами (взаимная инактивация).

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, увеличивают концентрацию в крови, замедляют выведение и повышают риск развития токсических реакций.

Пробенецид нарушает экскрецию цефазолина.

Одновременное назначение с этанолом может вызывать дисульфирам-подобные реакции.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Пациенты, имевшие в анамнезе аллергические реакции на пенициллины и карбапенемы, могут иметь повышенную чувствительность к цефалоспориновым антибиотикам.

Во время лечения цефазолином возможно получение положительных прямой и непрямой проб Кумбса, а также ложноположительной реакции мочи на сахар.

При назначении препарата возможно обострение заболеваний ЖКТ, особенно колита.

Пациентам, использующим препарат, необходимо воздержаться от употребления алкоголя.

Безопасность применения у недоношенных детей и детей первого года жизни не установлена.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения во флаконах по 0,5 г или 1,0 г. Каждый флакон упакован в картонную пачку с инструкцией по применению.

Срок годности

3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Список Б. В сухом месте при температуре не выше 30°С. Хранить в недоступных для детей местах.

Условия отпуска из аптек

По рецепту врача.

Производитель:

«ЛЮПИН Лтд.», Индия

159, Си Эс Ти Роуд, Калина, Сантакруз (Ист), Мумбай 400 098

Представительство в РФ:

119571, г. Москва, ул. 26 Бакинских комиссаров, д.9, офис 40.

Тел./факс: (495) 434-6408/8152

E-mail: lupin@co.ru

Директор ИДКЭЛС В.В.Чельцов

Представитель фирмы LUPIN LIMITED MUMBAI INDIA Правин Самбрей