ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
Цефсон (Cefson)

Регистрационный номер:

Торговое название: Цефсон

Международное непатентованное название: цефтриаксон

Лекарственная форма: Порошок для приготовления раствора для внутримышечного введения. Порошок для приготовления раствора для внутривенного введения.

Состав: 1 флакон с препаратом содержит:
действующее вещество: цефтриаксон натрия в пересчете на цефтриаксон 500 мг, 1000 мг.
1 ампула с растворителем для приготовления раствора для внутримышечного введения содержит: лидокаина гидрохлорида 2,0 мл, 3,5 мл.
1 ампула с растворителем для приготовления раствора для внутривенного введения содержит: вода для инъекций 5 мл, 10 мл.

Описание: белый или белый с желтоватым оттенком порошок. Слабо гигроскопичен.
Растворитель: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: антибиотик-цефалоспорин.

Код АТХ J01DD04.

Фармакологическое действие
Фармакодинамика
Цефсон- полусинтетический цефалоспориновый антибиотик III поколения широкого спектра действия.
Бактерицидная активность Цефсона обусловлена подавлением синтеза клеточных мембран. Препарат отличается большой устойчивостью к действию бета-лактамаз (пенициллиназы и цефалоспориназы) грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов. Цефсон активен в отношении следующих микроорганизмов:
Грамотрицательные аэробы: Enterobacter aerogenes, Enterobacter cloacae, Escherichia coli, Haemophilus influenzae (в том числе штаммы, устойчивые к ампициллину), Haemophilus parainfluenzae, Klebssiella spp. (в том числе Klebssiella pneumoniae), Neisseria gonorrhoeae (в том числе штаммы, образующие и необразующие пенициллиназу), Neisseria meningitidis, Proteus mirabilis, Proteus vulgaris, Morganella morganii, Serratia marcescens, Citrobacter freundii, Citrobacter diversus, Providencia spp., Salmonella spp., Shigella spp., Acinetobacter calcoaceticus.
Ряд штаммов вышеперечисленных микроорганизмов, которые проявляют устойчивость к другим антибиотикам, таким как пенициллины, цефалоспорины, аминогликозиды, чувствительны к цефтриаксону. Отдельные штаммы Pseudomonas aeruginosa также чувствительны к препарату.

«АСФАРМА-РОС» ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

Грамположительные аэробы: Staphylococcus aureus (в том числе штаммы, образующие пенициллиназу), Staphylococcus epidermidis (стафилококки, устойчивые к метициллину, проявляют устойчивость ко всем цефалоспоринам, включая цефтриаксон), Streptococcus pyogenes (бета-гемолитические стрептококки группы А), Streptococcus agalactiae (стрептококки группы В), Streptococcus pneumoniae.
Анаэробы: Bacteroides spp., Clostridium spp. (за исключением Clostridium difficile).

Фармакокинетика

При внутримышечном введении цефтриаксон хорошо абсорбируется из места введения и достигает высоких концентраций в сыворотке. Биодоступность препарата - 100%.
Средняя концентрация в плазме достигается через 2-3 часа после инъекции. При повторном внутримышечном или внутривенном введении в дозах 500-2000 мг с интервалом от 12 до 24 часов происходит накопление цефтриаксона в концентрации, которая на 15%-36% превышает концентрацию, достигаемую при однократном введении. При введении в дозе от 1500 до 3000 мг период полувыведения составляет от 5,8 до 8,7 часов; объем распределения - от 5,78 до 13,5 л; плазменный клиренс – 0.58-1.45 л/ч, почечный клиренс – 0.32-0.73 л/ч. Цефтриаксон обратимо связывается с белками плазмы крови. От 33% до 67% препарата выводится в неизменном виде почками, остальная часть экскретируется с желчью в кишечник, где биотрансформируется в неактивный метаболит.
Проникновение в спинномозговую жидкость: у новорожденных и у детей при воспалении мозговой оболочки цефтриаксон проникает в ликвор, при этом в случае бактериального менингита в среднем 17% от концентрации препарата в плазме диффундирует в спинномозговую жидкость, что примерно в 4 раза больше, чем при асептическом менингите. Через 24 часа после внутривенного введения цефтриаксона в дозе 50-100 мг/кг массы тела концентрации в спинномозговой жидкости превышают 1.4 мг/л. У *взрослых* больных менингитом через 2-24 часа, после введения дозы 50 мг/кг массы тела, концентрации цефтриаксона в спинномозговой жидкости во много раз превосходят минимальные подавляющие концентрации для самых распространенных возбудителей менингита.

Показания к применению

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными возбудителями: сепсис; менингит; диссеминированный боррелиоз Лайма (ранние и поздние стадии заболевания); инфекции органов брюшной полости (перитонит, инфекции желчных путей и желудочно-кишечного тракта); инфекции костей, суставов, мягких тканей, кожи, а также раневые инфекции; инфекции у больных с ослабленным иммунитетом; инфекции органов малого таза; инфекции почек и мочевыводящих путей; инфекции дыхательных путей, особенно пневмония, и инфекции ЛОР-органов; инфекции половых органов, включая гонорею.
Профилактика инфекций в послеоперационном периоде.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цефалоспоринам (в т. ч. к другим цефалоспоринам, пенициллинам, карбапенемам).
С осторожностью: назначают препарат при неспецифическом язвенном колите, при нарушениях функции печени и почек, при энтерите и колите, связанных с применением антибактериальных препаратов; недоношенным и новорожденным детям с гипербилирубинемией; беременность и в период лактации.

АСФАРМА-РОС
ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

Применение при беременности и в период лактации
Применение Цефсона при беременности возможно только в тех случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (цефтриаксон проникает через плацентарный барьер).
При необходимости применения Цефсона в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания (цефтриаксон выделяется с грудным молоком).

Способ применения и дозы
Препарат вводят внутримышечно или внутривенно (капельно, струйно).

Стандартный режим дозирования
Взрослые и дети старше 12 лет: по 1000-2000 мг *один раз в сутки* (каждые 24 часа). В тяжелых случаях или при инфекциях, возбудители которых обладают лишь умеренной чувствительностью к цефтриаксону, суточную дозу можно увеличивать до 4000 мг.
Новорожденные (до 2 недель): 20-50 мг/кг массы тела один раз в сутки. Суточная доза не должна превышать 50 мг/кг массы тела. При определении дозы не нужно делать различия между доношенными и недоношенными детьми.
Грудные дети и дети младшего возраста (с 15 дней до 12 лет): 20-80 мг/кг массы тела один раз в сутки.
Детям с массой тела свыше 50 кг назначают дозы для взрослых.
Внутривенные дозы в 50 мг/кг или выше следует вводить капельно в течение не менее 30 минут.
Больные старческого возраста: обычные дозы для взрослых, без поправок на возраст.
Продолжительность лечения зависит от течения заболевания. Как и всегда при антибиотикотерапии, введение Цефсона следует продолжать больным еще в течение минимум 48-72 часов после нормализации температуры и подтверждения эрадикации возбудителя.
Дозирование в особых случаях
При *бактериальном менингите у грудных детей и детей младшего возраста* лечение начинают с дозы 100 мг/кг (но не более 4000 мг) 1 раз в сутки. После идентификации возбудителя и определения его чувствительности, дозу можно соответственно уменьшить. Наилучшие результаты при менингококковом менингите достигались при продолжительности лечения в 4 дня, при менингите, вызванном *Haemophilus influenzae* - 6 дней, *Streptococcus pneumoniae* - 7 дней.
Боррелиоз Лайма: 50 мг/кг (высшая суточная доза - 2000 мг) взрослым и детям старше 12 лет один раз в сутки в течение 14 дней.
Гонорея (вызванная пенициллиназообразующими и пенициллиназонеобразующими штаммами): однократное внутримышечное введение 250 мг Цефсона.
Профилактика послеоперационных инфекций, в зависимости от степени инфекционного риска, вводится 1000-2000 мг Цефсона однократно за 30-90 мин до начала операции. При операциях на толстой и прямой кишке хорошо зарекомендовало себя одновременное (но раздельное) введение Цефсона и одного из 5-нитроимидазолов, например, орнидазола.
У больных с *нарушением функции почек* нет необходимости уменьшать дозу, если функция *печени* остается нормальной. Суточная доза Цефсона не должна превышать 2000 мг лишь в случаях претерминальной почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин). У больных с *нарушением функции печени* нет необходимости уменьшать дозу, если функция *почек* остается нормальной.
При *сочетании тяжелой почечной и печеночной недостаточности* следует регулярно

«АСФАРМА-РОС»
ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

определять концентрацию цефтриаксона в плазме и при необходимости корректировать его дозу.
Больным на *диализе* дополнительного введения препарата после диализа не требуется. Следует, однако, контролировать концентрацию цефтриаксона в сыворотке на предмет возможной коррекции дозы, поскольку скорость выведения препарата у этих больных может снижаться.

Способ применения
Для внутримышечного введения: Содержимое флакона растворяют следующим образом:

Содержимое флакона	Растворитель (раствор лидокаина гидрохлорида 1 %)
500 мг	2,0 мл
1000 мг	3,5 мл

После приготовления каждый мл раствора содержит около 250 мг в пересчете на цефтриаксон.
Как и при других внутримышечных инъекциях Цефсон вводят в относительно крупную мышцу (ягодичную); пробная аспирация помогает избежать непреднамеренного введения в кровеносный сосуд. Рекомендуется вводить не более 1000 мг препарата в одну мышцу. Нельзя вводить раствор лидокаина внутривенно.

Для внутривенного введения: Содержимое флакона растворяют следующим образом:

Содержимое флакона	Растворитель (вода для инъекций)
500 мг	5,0 мл
1000 мг	10,0 мл

После приготовления каждый мл раствора содержит около 100 мг в пересчете на цефтриаксон. Раствор вводят медленно в течение 2-4 мин.
Для внутривенной инфузии растворяют 2000 мг Цефсона в 40 мл стерильной воды для инъекций или одного из инфузионных растворов, не содержащих кальция (0.9% раствор натрия хлорида, 2.5%, 5% или 10% раствор декстрозы, 5% раствор левулозы, 6% раствор декстрана в декстрозе). Раствор вводят в течение 30 мин.

Побочное действие
Аллергические реакции: крапивница, озноб или лихорадка, сыпь, зуд, редко- бронхоспазм, эозинофилия, эритема, экссудативная мультиформная (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), сывороточная болезнь, анафилактический шок.
Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, диарея или запор, метеоризм, абдоминальные боли, нарушение вкуса, стоматит, глоссит, псевдомембранозный энтероколит, нарушение функции печени (повышение активности «печеночных» трансаминаз, реже - щелочной фосфатазы или билирубина, холестатическая желтуха), псевдохолелитиаз желчного пузыря («sludge»-синдром), дисбактериоз.
Со стороны органов кроветворения: анемия, лейкопения, лейкоцитоз, нейтропения, гранулоцитопения, лимфопения, тромбоцитоз, тромбоцитопения, гемолитическая анемия,

«АСФАРМА-РОС» ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

гипокоагуляция, снижение концентрации пламенных факторов свертывания крови (II, VII, IX, X), удлинение протромбинового времени.
Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек (азотемия, повышение содержания мочевины в крови, гиперкреатининемия, глюкозурия, цилиндрурия, гематурия), олигурия, анурия.
Лабораторные показатели: азотемия, повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия.
Местные реакции: флебит, болезненность по ходу вены, болезненность и инфильтрат в месте внутримышечного введения.
Прочие: головная боль, головокружение, носовые кровотечения, кандидоз, суперинфекция.

Передозировка
При передозировке гемодиализ и перитонеальный диализ не снизят концентрации препарата. Специфического антидота нет. Лечение передозировки симптоматическое.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами
Цефтриаксон, подавляя кишечную флору, препятствует синтезу витамина К. При одновременном назначении с препаратами, снижающими агрегацию тромбоцитов (нестероидные противовоспалительные средства, салицилаты, сульфинпиразон), увеличивается риск развития кровотечений. При одновременном назначении с антикоагулянтами отмечается усиление действия последних.
При одновременном назначении с «петлевыми» диуретиками возрастает риск развития нефротоксического действия.
Цефтриаксон и аминогликозиды обладают синергизмом в отношении многих грамотрицательных бактерий.
Несовместим с этанолом.
Фармацевтическое взаимодействие
Растворы цефтриаксона не следует смешивать или вводить одновременно с другими противомикробными препаратами. Цефтриаксон нельзя смешивать с растворами, содержащими кальций

Особые указания
При одновременной тяжелой почечной и печеночной недостаточности, у больных, находящихся на гемодиализе, следует регулярно определять концентрацию препарата в плазме.
При длительном лечении необходимо регулярно контролировать картину периферической крови, показатели функционального состояния печени и почек.
В редких случаях при УЗИ желчного пузыря отмечаются затемнения, которые исчезают после прекращения лечения (даже если это явление сопровождается болями в правом подреберье, рекомендуется продолжение назначения антибиотика и проведение симптоматического лечения).
Во время лечения противопоказано применение этанола - возможны дисульфирамоподобные эффекты (покраснение лица, спазм в животе и в области желудка, тошнота, рвота, головная боль, снижение артериального давления, тахикардия, одышка).
Несмотря на подробный сбор анамнеза, что является правилом и для других цефалоспориновых антибиотиков, нельзя исключить возможность развития

«АСФАРМА-РОС» ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

анафилактического шока, который требует немедленной терапии – сначала внутривенно вводят эпинефрин, затем глюкокортикостероиды.
Исследования in vitro показали, что подобно другим цефалоспориновым антибиотикам, цефтриаксон способен вытеснять билирубин, связанный с альбумином сыворотки крови. Поэтому у новорожденных с гипербилирубинемией и, особенно, у недоношенных новорожденных, применение цефтриаксона требует еще большей осторожности.
Пожилым и ослабленным больным может потребоваться назначение витамина К.
Приготовленный раствор хранить при комнатной температуре не более 6 часов или в холодильнике при температуре 2-8°С не более 24 часов.

Форма выпуска
Порошок для приготовления раствора для внутримышечного введения: По 500 мг или 1000 мг во флакон бесцветного стекла, укупоренный пробкой из бромбутиловой резины, обжатой алюминиевым кольцом или алюминиевым колпачком «flip off».
Растворитель (раствор лидокаина гидрохлорида 1 %): По 2 мл или 3,5 мл в ампулу бесцветного стекла.
По 1 флакону с препаратом и 1 ампуле с растворителем вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.
По 100 флаконов с препаратом помещают в картонную коробку (для стационаров) с инструкциями по применению (50 штук).
Порошок для приготовления раствора для внутривенного введения: По 500 мг или 1000 мг во флакон бесцветного стекла, укупоренный пробкой из бромбутиловой резины, обжатой алюминиевым кольцом или алюминиевым колпачком «flip off».
Растворитель (вода для инъекций): По 5 мл или 10 мл в ампулу бесцветного стекла.
По 1 флакону с препаратом и 1 ампуле с растворителем вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.
По 1 флакону с препаратом и 1 ампуле с растворителем в поддон из поливинилхлорида; по 1 поддону вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.
По 100 флаконов с препаратом помещают в картонную коробку (для стационаров) с инструкциями по применению (50 штук).

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

Условия хранения
В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. После приготовления препарат сохраняет активность в течение 14 дней при температуре хранения 2-8 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Производитель:
«Мустафа Невзат Илач Санан А.Ш.», Турция.
Пак иш Меркези, проф. Др. Булент, Таркан Сокак № 5/1, 34349 Гайреттепе, Стамбул, Турция, тел/факс: +902122757956

«АСФАРМА-РОС» ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ

П N014008/01-100608

Дистрибьютор/Претензии потребителей направлять по адресу:
ООО «Асфарма-Рос», Россия
603000, г. Нижний Новгород, ул. Нижегородская д.22, оф.6
тел/факс: (8312)30-68-97, 37-06-60,
e-mail: asfarma@mts-nn.ru

И.о.директора ИТЭЛС А.Н. Васильев

Представитель фирмы: С.А. Греб

«АСФАРМА-РОС» ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ