

ЦЕФУРОКСИМ

1. Цефуроксим.

2. Аксетин, Зинацеф, Зиннат, Кетоцеф, Суперо, Цефуксин, Цефурабол, Цефуроксима натриевая соль, Цефуроксима натриевая соль стерильная.

3. Средства для профилактики и лечения инфекций (Антибактериальные средства).

4. Цефалоспориновый антибиотик II поколения для перорального и парентерального применения. Обладает широким спектром противомикробного действия.

Высокоактивен в отношении грамположительных микроорганизмов, включая штаммы, устойчивые к пенициллинам (за исключением штаммов, резистентных к метициллину), *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pyogenes* (и другие β -гемолитические стрептококки), *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus* группы B (*Streptococcus agalactiae*), *Streptococcus mitis* (группы *viridans*), *Bordetella pertussis*, большинство *Clostridium* spp.; грамотрицательных микроорганизмов (*Escherichia coli*, *Klebsiella* spp., *Proteus mirabilis*, *Providencia* spp., *Proteus rettgeri*, *Haemophilus influenzae*, включая штаммы, резистентные к ампициллину, *Haemophilus parainfluenzae*, включая штаммы, резистентные к ампициллину, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, включая штаммы, продуцирующие и не продуцирующие пенициллиназу, *Neisseria meningitidis*, *Salmonella* spp., *Borrelia burgdorferi*; грамположительных и грамотрицательных анаэробов (*Peptococcus* spp., *Peptostreptococcus* spp., *Fusobacterium* spp., *Propionibacterium* spp.).

К цефуроксиму не чувствительны: *Clostridium difficile*, *Pseudomonas* spp., *Campylobacter* spp., *Acinetobacter calcoaceticus*, *Listeria monocytogenes*, устойчивые к метициллину штаммы *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, *Legionella* spp., *Streptococcus (Enterococcus) faecalis*, *Morganella morganii*, *Proteus vulgaris*, *Enterobacter* spp., *Citrobacter* spp., *Serratia* spp., *Bacteroides fragilis*.

5. Уровень убедительности доказательств А. Доказана эффективность при внебольничных инфекциях респираторного тракта, мочевыводящей системы различной степени тяжести. Эффективное средство для проведения предоперационной профилактики послеоперационных осложнений.

6. Цена за 1 флакон (750 мг) – 98,88 руб.[1]; 106,68 руб.[3].

Результаты анализа «затраты - эффективность» не выявили преимуществ цефуроксима перед другими β -лактамами антибиотиками, макролидами, и фторхинолонами при лечении внебольничных инфекций и проведении предоперационной профилактики послеоперационных осложнений.

7. Нарушает синтез клеточной стенки бактерий, оказывает бактерицидное действие.

Парентеральное введение: после внутримышечного введения 750 мг C_{max} достигается через 15-60 мин и составляет 27 мкг/мл. При внутривенном введении 750 мг и 1,5 г C_{max} через 15 мин составляет 50 и 100 мкг/мл, соответственно. Терапевтическая концентрация сохраняется 5,3 и 8 ч, соответственно.

$T_{1/2}$ при внутривенном и внутримышечном введении – 1,3-1,5 ч, у новорожденных детей - 2-2,5 ч. Связь с белками плазмы - 33-50%. Не метаболизируется в печени.

Выводится почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции 85-90% в неизменном виде в течение 8 ч (большая часть препарата выводится в течение первых 6 ч, создавая при этом высокие концентрации в моче); через 24 ч выводится полностью (50% - путем канальцевой секреции, 50% - путем клубочковой фильтрации).

Терапевтические концентрации регистрируются в плевральной жидкости, желчи, мокроте, миокарде, коже и мягких тканях. Концентрации цефуроксима, превышающие минимальную подавляющую концентрацию для большинства микроорганизмов, могут быть достигнуты в костной ткани, синовиальной и внутриглазной жидкостях. При менингите проникает через гемато – энцефалический барьер. Проходит через плаценту и проникает в грудное молоко.

Внутри: хорошо всасывается и быстро гидролизует в слизистой оболочке кишечника, распределяется в экстрацеллюлярной жидкости. Биодоступность после еды повышается (до 37-52%).

C_{max} в плазме создается после применения таблеток через 2,5-3 ч, суспензии – 2,5-3,5 ч, $T_{1/2}$ – 1,2-1,3 ч и 1,4-1,9 ч, соответственно.

Выводится в неизменном виде почками: у взрослых 50% дозы - через 12 ч. При нарушении функции почек $T_{1/2}$ удлиняется.

8. Пневмония, абсцесс легких, эмпиема плевры, синусит, тонзиллит, фарингит, отит, пиелонефрит, цистит, асимптоматическая бактериурия, гонорея, рожа, пиодермия, импетиго, фурункулёз, флегмона, раневая инфекция, эризипеллоид, остеомиелит, септический артрит, эндометрит, аднексит, цервицит, сепсис, менингит, боррелиоз. Профилактика инфекционных осложнений при операциях на органах грудной клетки, брюшной полости, таза, суставов.

9. Гиперчувствительность (в том числе к другим цефалоспорином, пенициллинам и карбапенемам).

10. Микробиологические критерии имеют значение для прогноза клинической эффективности, поэтому перед применением антибиотика определяют чувствительность к нему выделенных возбудителей.

Клинические: ранние (1 – 2 суток) – субъективная оценка больного о результатах лечения, температурная реакция; поздние – подтверждение эрадикации возбудителя, лабораторные и инструментальные подтверждения выздоровления.

11. Внутривенно и внутримышечно взрослым назначают по 750 мг 3 раза в сутки; при инфекциях тяжелого течения - дозу увеличивают до 1500 мг 3-4 раза в сутки (при необходимости, интервал между введениями может быть сокращен до 6 ч). Средняя суточная доза - 3000-6000 мг.

Детям назначают по 30-100 мг/кг/сут. в 3-4 приема. При большинстве инфекций оптимальная доза составляет 60 мг/кг/сут. Новорожденным и детям до 3 мес назначают 30 мг/кг/сут. в 2-3 приема.

При гонорее - внутримышечно, 1500 мг однократно (или в виде 2 инъекций по 750 мг с введением в разные области, например, в обе ягодичные мышцы).

При бактериальном менингите - внутривенно, по 3000 мг каждые 8 ч; детям младшего и старшего возраста - 150-250 мг/кг/сут. в 3-4 приема, новорожденным - 100 мг/кг/сут.

При операциях на брюшной полости, органах таза и при ортопедических операциях - внутривенно, 1500 мг при индукции анестезии, затем дополнительно - внутримышечного 750 мг, через 8 и 16 ч после операции.

При операциях на сердце, легких, пищеводе и сосудах - внутривенно, 1500 мг при индукции анестезии, затем - внутримышечно, по 750 мг 3 раза в сутки в течение последующих 24-48 ч.

При пневмонии - внутримышечно или внутривенно, по 1500 мг 2-3 раза в сутки в течение 48-72 ч, затем переходят на прием внутрь по 500 мг 2 раза в сутки в течение 7-10 дней.

При обострении хронического бронхита назначают внутримышечно или внутривенно, по 750 мг 2-3 раза в сутки в течение 48-72 ч, затем переходят на прием внутрь по 500 мг 2 раза в сутки в течение 5-10 дней. DDD=0,5 г (перорально), 3 г (парентерально).

12. Лечение продолжают в течение 48-72 ч после исчезновения симптомов; в случае инфекций, вызванных *Streptococcus pyogenes*, курс лечения - не менее 7-10 дней. Симптомы: возбуждение центральной нервной системы, судороги. Лечение: контроль и поддержание жизненно важных функций организма, гемодиализ и перитонеальный диализ.

13. Пациенты, имевшие в анамнезе аллергические реакции на пенициллины, могут иметь гиперчувствительность к цефалоспориновым антибиотикам. В процессе лечения необходим контроль функции почек, особенно у больных, получающих препарат в высоких дозах.

Готовый к употреблению раствор можно хранить при комнатной температуре в течение 7 ч, в холодильнике - в течение 48 ч. Допускается применение пожелтевшего за время хранения раствора.

Во время лечения нельзя употреблять этанол.

У пациентов, получающих цефуроксим, при определении уровня глюкозы в крови рекомендуют использовать тесты с глюкозооксидазой или гексокиназой.

При переходе от парентерального введения к приему внутрь следует учитывать тяжесть инфекции, чувствительность микроорганизмов и общее состояние пациента. Если через 72 ч после приема цефуроксима внутрь не отмечается клинического улучшения, необходимо продолжить парентеральное введение.

14. С осторожностью - в периоде новорожденности, при недоношенности, хронической почечной недостаточности, кровотечениях и неспецифическом язвенном колите; у ослабленных и истощенных пациентов, при беременности, и в период лактации.

При хронической почечной недостаточности необходима коррекция режима дозирования: при клиренсе креатинина 10-20 мл/мин назначают внутривенно или внутримышечно по 750 мг 2 раза в сутки, при клиренсе креатинина менее 10 мл/мин - по 750 мг 1 раз в сутки.

Пациентам, находящимся на непрерывном гемодиализе с использованием артерио-венозного шунта или на гемофильтрации высокой скорости в отделениях интенсивной терапии, назначают 750 мг 2 раза в сутки; для пациентов, находящихся на гемофильтрации низкой скорости, назначают дозы, рекомендуемые при нарушении функции почек.

Категория влияния на плод - В (FDA)

(http://www.drugbank.ca/drugBank/drugStructureFile/drug_files/fda_labels/DB01112.pdf)

<http://www.fda.gov/cder/foi/label/2007/050672s028lbl.pdf>

<http://www.fda.gov/cder/foi/label/2007/050558s067,050643s021lbl.pdf>).

15. Нарушение функции почек, дизурия; зуд в промежности, вагинит; диарея, тошнота, рвота, метеоризм, спазмы и боль в животе, изъязвления слизистой оболочки полости рта, кандидоз полости рта, глоссит, редко - псевдомембранозный энтероколит, нарушение функции печени, холестаза; анемия, эозинофилия, нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения; удлинение протромбинового времени. Во время лечения возможна прямая реакция Кумбса и ложноположительная реакция мочи на глюкозу; раздражение, инфильтрат и боль в месте введения, флебит; аллергические реакции (озноб, сыпь, зуд, крапивница, редко - мультиформная эритема, бронхоспазм, синдром Стивенса-Джонсона, анафилактический шок).

16. Одновременное пероральное назначение "петлевых" диуретиков замедляет канальную секрецию, снижает почечный клиренс, повышает концентрацию в плазме и увеличивает $T_{1/2}$ цефуроксима.

При одновременном применении с аминогликозидами и диуретиками повышается риск возникновения нефротоксических эффектов.

Препараты, снижающие кислотность желудочного сока, уменьшают всасывание цефуроксима и его биодоступность.

Фармацевтически совместим с водными растворами, содержащими до 1% лидокаина гидрохлорида, 0,9% раствором хлорида натрия, 5% и 10% раствором декстрозы, 0,18% раствором хлорида натрия и 4% раствором декстрозы, 5% раствором декстрозы и 0,9% раствором хлорида натрия, раствором Рингера, раствором Хартмана, раствором лактата натрия, гепарином (10 ед/мл и 50 ед/мл) в 0,9% растворе натрия хлорида.

Фармацевтически несовместим с аминогликозидами, раствором натрия бикарбоната 2,74%.

17. Не применяются.

18. Пациент предупреждается обо всех возможных нежелательных эффектах при использовании цефуроксима, а также о возможности проведения ступенчатой терапии, с переходом на пероральный прием препарата. Необходимо строго придерживаться схемы назначения препарата. При появлении нежелательных реакций необходимо немедленно сообщать врачу.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Порошок для приготовления раствора для инъекций 250, 750, 1500 мг (флаконы); гранулы для приготовления суспензии, для приема внутрь, (пакетики одноразовые) 125, 250 мг; гранулы для приготовления суспензии, для приема внутрь (флаконы) 125, 250 мг/5 мл - 50, 70, 100, 120, 150 мл.

Фирмы: Medochemie Ltd, Кипр; GlaxoWellcome SPA, Италия; GlaxoSmithKline, Великобритания; Pliva, Хорватия; Lifepharm SpA, Италия; Aurobindo Pharme Ltd, Индия.

21. Список Б. Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.