Состав

діюча речовина: cefprozime;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить цефподоксиму проксетилу еквівалентно цефподоксиму 100 мг або 200 мг;

допоміжні речовини: кальцію карбоксиметилцелюлоза, крохмаль кукурудзяний, кросповідон (тип Б), лактоза моногідрат, натрію лаурилсульфат, гідроксипропілцелюлоза, магнію стеарат, Opadry White 03H58900 (гіпромелоза, титану діоксид (E 171), пропіленгліколь).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства:

таблетки, покрытые пленочной оболочкой, по 200 мг: круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета, с четкими краями, с оттиском «С7» с одной стороны и гладкие с другой стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Фармакодинамика

Цефподоксиму проксетил є бета-лактамним антибіотиком, що належить до пероральних цефалоспоринів третього покоління і є неактивною формою цефподоксиму. Після перорального застосування він абсорбується в кишечнику, де швидко гідролізується неспецифічними естеразами в цефподоксим, який потім системно абсорбується.

Механізм дії цефподоксиму базується на пригніченні синтезу клітинних стінок бактерій. Цефподоксим стійкий до дії більшості бета-лактамаз.

Цефподоксим, як було показано, володіє в умовах *in vitro* бактерицидною активністю проти численних грампозитивних і грамнегативних бактерій.

Він дуже активний проти грампозитивних мікроорганізмів:

- *Streptococcus pneumoniae*
- Стрептококи групи А (*S. pyogenes*), В (*S. agalactiae*), С, F і G
- Інші стрептококи (*S. mitis*, *S. sanguis* і *S. salivarius*)
- *Corynebacterium diphtheriae*

Він дуже активний проти грамнегативних мікроорганізмів:

- Haemophilus influenzae (штами, що продукують і не продукують бета-лактамази)
- Haemophilus para-influenzae (штами, що продукують і не продукують бета-лактамази)
- Branhamella catarrhalis (штами, що продукують і не продукують бета-лактамази)
- Neisseria meningitidis
- Neisseria gonorrhoeae
- Escherichia coli
- Klebsiella Spp. (K. pneumoniae; K. oxytoca)
- Proteus mirabilis

Він помірно активний щодо чутливих до дії метициліну стафілококів, штамів, що продукують і не продукують пеніцилінази (S. aureus і S. epidermidis).

Крім того, як і щодо інших цефалоспоринів, такі мікроорганізми є стійкими до дії цефподоксиму: ентерококи, стійкі до дії метициліну стафілококи (S. aureus і S. epidermidis), Staphylococcus saprophyticus, Pseudomonas aeruginosa та Pseudomonas spp., Clostridium difficile, Bacteroides fragilis і споріднені види.

Як і у разі застосування інших антибіотиків, щоразу, коли це можливо, чутливість потрібно підтверджувати шляхом тестування в умовах in vitro.

Фармакокінетика

Абсорбція

Абсорбція цефподоксима проксетила, прийнятого перорально натощак в формі таблетки, соответствующей 100 мг цефподоксима, составляет 40-50%. Она увеличивается с приемом пищевых продуктов, поэтому рекомендуется использовать препарат во время еды.

Цефподоксима проксетил абсорбируется в кишечнике и гидролизуется в активный метаболит цефподоксима.

Распределение

Концентрация в плазме крови

После перорального приема дозы 100 мг максимальная концентрация цефподоксима в плазме крови (C_{max}) составляет 1-1,2 мг/л. После разового приема дозы 200 мг максимальная концентрация в плазме крови составляет

2,2–2,5 мг/л. В обоих случаях (100 или 200 мг) C_{max} достигается (T_{max}) за 2–3 часа.

Остаточные концентрации через 12 ч после приема 100 мг и 200 мг составляют соответственно 0,08 мг/л и 0,18 мг/л.

После приема в течение 14,5 дня дозы 100–200 мг дважды в сутки фармакокинетические параметры цефподоксима в плазме крови не изменяются, что означает отсутствие накопления действующего вещества.

Объем распределения цефподоксима составляет 30–35 л у молодых здоровых добровольцев (0,43 л/кг).

Связывание с белками плазмы крови

Уровень связывания цефподоксима составляет 40%, в основном с альбумином. Такое связывание не имеет характера насыщенности.

Проникновение в ткани и жидкости

Цефподоксим хорошо проникает в паренхиму легких, слизистую бронхов, плевральную жидкость, миндалины и межклеточную жидкость.

Через 4–7 ч после разового приема 100 мг концентрация в миндалинах составляет 0,24–0,1 мкг/г (20–25 % концентрации в плазме крови).

После разового приема 200 мг цефподоксима концентрация в межклеточной жидкости составляет 1,5–2,0 мг/л (80% концентрации в плазме крови).

Через 3–12 часов после разового приема 200 мг цефподоксима концентрация в легких составляет 0,6–0,2 мкг/г; в плевре – 0,6 – 0,8 мг/л.

В слизистой бронхов через 1–4 ч после приема 200 мг концентрация цефподоксима составляет около 1 мкг/г (40–45 % концентрации в плазме крови).

Измеренные концентрации превышают минимальную угнетающую концентрацию для чувствительных организмов.

Биотрансформация и вывод

После абсорбции главным метаболитом является цефподоксим, выделяемый вследствие гидролиза проксетила цефподоксима.

Цефподоксим очень мало метаболизируется.

После абсорбции цефподоксима проксетила 80% высвобождающегося цефподоксима выводится в неизменной форме с мочой.

Период полувыведения цефподоксима составляет в среднем 2,4 часа.

Пациенты группы риска

Фармакокинетические параметры цефподоксима очень мало изменяются у пациентов пожилого возраста с нормальной почечной функцией.

Однако слабое повышение максимальной концентрации в сыворотке крови и периода полувыведения не требует снижения дозы для таких пациентов, за исключением лиц, у которых почечный клиренс менее 40 мл/мин.

При почечной недостаточности, когда клиренс креатинина менее 40 мл/мин, увеличение периода полувыведения из плазмы крови и максимальной концентрации в плазме крови требует снижения дозы наполовину и приема препарата 1 раз в день.

В случае печеночной недостаточности незначительные кинетические изменения, которые наблюдаются, не требуют особой коррекции дозировки.

Показания

Лечение у взрослых инфекций, вызванных чувствительными к препарату возбудителями, такими как:

- тонзиллиты;
- острые синуситы;
- острые бронхиты;
- обострение хронических бронхитов;
- бактериальные пневмонии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цефподоксиму или другим препаратам группы цефалоспоринов или к любому из вспомогательных веществ.

Немедленные и/или тяжелые реакции повышенной чувствительности (анафилаксии) на пенициллин или другие бета-лактамы антибиотики в анамнезе.

Редкая наследственная непереносимость галактозы, лактазная недостаточность Лаппа или синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования показали, что биодоступность препарата уменьшается примерно на 30%, когда цефподоксим применяют с препаратами, нейтрализующими рН желудка или ингибирующими секрецию кислоты. Таким образом, такие препараты, как антациды минерального типа и H₂-блокаторы, например ранитидин, которые могут привести к увеличению рН желудочного сока, следует принимать через 2–3 ч после применения цефподоксима.

H₂-антагонисты гистамина и антациды снижают биодоступность цефподоксима.

Повышение уровня рН желудка: анти-H₂ (ранитидин) и антикислоты (гидроксид алюминия, бикарбонат натрия) приводят к снижению биологической эффективности.

Снижение уровня рН желудка (пентагастрин) увеличивает биологическую эффективность. Клинические последствия остаются невыясненными.

Одновременное применение с пробенецидом уменьшает выведение цефалоспоринов. Цефалоспорины потенциально повышают антикоагулянтный эффект кумаринов и снижают контрацептивный эффект эстрогенов.

Рекомендуется регулярно контролировать показатели международного нормализованного отношения (МНО) во время и вскоре после одновременного применения цефподоксима с пероральным антикоагулянтом.

Ложноположительные результаты реакции на глюкозу в моче возможны при использовании раствора Бенедикта или Фелинга или тест-таблеток сульфата меди, но не при проведении ферментативных реакций в присутствии глюкозооксидазы.

Сообщалось о многочисленных случаях усиления действия пероральных антикоагулянтов у пациентов, получающих антибиотики. Четко выраженный инфекционный или воспалительный процесс, возраст и общее состояние пациента оказываются факторами риска возникновения такого действия.

Независимо от характера пищи биологическая эффективность цефподоксима повышается, если принимают во время еды.

Особенности применения

До начала лечения необходимо проверить наличие в анамнезе пациента тяжелых реакций повышенной чувствительности к цефподоксиму, другим цефалоспорином или любому другому типу бета-лактамовых антибиотиков.

Препарат следует назначать с осторожностью пациентам с наличием в анамнезе нетяжелых реакций гиперчувствительности.

Как и при применении других бета-лактамов, были зарегистрированы серьезные, а иногда и летальные реакции повышенной чувствительности. В случае появления тяжелых реакций гиперчувствительности лечение цефподоксимом следует немедленно прекратить и приступить к проведению соответствующих неотложных мероприятий.

При тяжелой почечной недостаточности может возникнуть необходимость в уменьшении дозы препарата в зависимости от клиренса креатинина.

Цефподоксим всегда следует с осторожностью назначать пациентам с наличием в анамнезе желудочно-кишечного заболевания, особенно колита.

О случаях развития колита, связанного с применением антибактериального препарата, и псевдомембранозного колита сообщалось при применении почти всех антибиотиков, включая цефподоксим; по степени тяжести эти состояния могут варьироваться от легкого до угрожающего жизни. Это важно принять во внимание, если у пациентов во время или после применения цефподоксима развивается диарея. Следует рассмотреть вопрос о прекращении лечения цефподоксимом и назначении специфического лечения против *Clostridium difficile*. Лекарственные средства, ингибирующие перистальтику, назначать не следует.

Как и в случае применения других бета-лактамов, могут развиваться нейтропения и реже – агранулоцитоз, особенно при длительном лечении. Если лечение длится более 10 дней, то рекомендуется контролировать показатели системы крови; при обнаружении нейтропении лечение прекращают.

Цефалоспорины могут поглощаться поверхностью мембран эритроцитов и вступать в реакцию с антителами, направленными против препарата. Это может привести к положительному тесту Кумбса и очень редко – к развитию гемолитической анемии. Перекрестная реактивность на пенициллин может наблюдаться при развитии такой реакции.

Нарушения функции почек были отмечены при лечении цефалоспориновыми антибиотиками, в частности, в сочетании с потенциально нефротоксическими препаратами, такими как аминогликозиды и/или диуретики. В этих случаях рекомендуется контролировать функцию почек.

Как и в отношении других антибиотиков широкого спектра, длительное применение цефподоксима проксетила может привести к избыточному росту нечувствительных микроорганизмов, в результате чего может потребоваться

прекратить лечение.

При любых проявлениях аллергии необходимо прекратить применение препарата.

Прием цефалоспоринов требует предварительного обследования, у 5 – 10% больных с аллергией на пенициллин наблюдается перекрестная реактивность на цефалоспорины.

Применять цефалоспорины следует с чрезвычайной осторожностью пациентам с чувствительностью к пенициллину: необходимо суровое медицинское наблюдение с момента первого применения.

Применение цефалоспоринов категорически запрещается при наличии в анамнезе аллергии на цефалоспорины немедленного типа. В случае подозрения на такую аллергию при первом приеме препарата обязательно присутствие врача с целью лечения возможной анафилактической реакции.

Реакции повышенной чувствительности (анафилаксии), наблюдаемые в связи с этими двумя типами бета-лактамов, могут быть серьезными и иногда летальными.

Приступ диареи может быть симптомом псевдомембранозного колита, диагностика которого происходит с помощью колоноскопии. Такой случай редко встречающегося при применении цефалоспоринов псевдомембранозного колита требует немедленного прекращения лечения и начала соответствующей специфической терапии антибиотиками (ванкомицин). В таком случае необходимо полностью избегать приема продуктов, способствующих копростазу.

Данное лекарственное средство содержит лактозу, поэтому оно противопоказано пациентам с врожденной галактоземией, синдромом пониженного поглощения глюкозы и галактозы или дефицитом лактазы.

Бактериостатические антибиотики (хлорамфеникол, эритромицин, сульфаниламиды, тетрациклины) снижают эффективность цефподоксима.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Во время лечения цефподоксимом сообщалось о случаях головокружения, которые могут повлиять на способность управлять автомобилем или работать с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Клинические данные о влиянии цефподоксима на беременность отсутствуют. Принимая во внимание ожидаемую пользу, применение цефподоксима во время беременности может рассматриваться несмотря на недостаточные клинические данные и данные исследований на животных. Следует с осторожностью назначать препарат беременным при необходимости.

Результаты исследований на животных свидетельствуют об отсутствии прямого или опосредованного негативного действия препарата на беременность, эмбриональное/фетальное развитие, роды или послеродовое развитие.

Цефподоксим проникает в грудное молоко человека, поэтому рекомендуется прекратить кормление грудью в период лечения.

Способ применения и дозы

Взрослым препарат применяют перорально 2 раза в сутки с интервалом 12 часов во время еды.

Острый бактериальный синусит: 2 таблетки по 200 мг/сут: по 1 таблетке (200 мг) утром и вечером. При острых максиллярных синуситах эффективно применение препарата в течение 5 дней.

Тонзиллиты: по 100 мг 2 раза в сутки.

Острый бронхит: по 200 мг 2 раза в день.

Обострение хронических бронхитов: по 200 мг 2 раза в день.

Бактериальная пневмония: по 200 мг 2 раза в день.

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы препарата для пациентов пожилого возраста с нормальной функцией почек не требуется.

Нарушение функции почек

Коррекция дозы цефподоксима не требуется, если клиренс креатинина превышает 40 мл/мин. Если клиренс креатинина ниже 40 мл/мин, дневную дозу уменьшают наполовину и принимают 1 раз в день.

Почечная недостаточность

Коррекция дозы для пациентов с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина.

40 мл/мин./1,73м³ не требуется. Если значение клиренса креатинина ниже этого показателя, то дозу необходимо корректировать соответствующим образом (см. таблицу ниже).

Клиренс креатинина (мл/мин)	Рекомендуемая доза
39-10	Унифицированную дозу ¹ назначают в виде разовой дозы каждые 24 часа (т.е. половину обычной дозы для взрослых)
<10	Унифицированную дозу ¹ назначают в виде разовой дозы каждые 48 часов (т.е. четверть обычной дозы для взрослых)
Пациенты, находящиеся на гемодиализе	Унифицированную дозу ¹ назначают после каждого сеанса диализа

1 - Унифицированная доза составляет 100 мг или 200 мг в зависимости от типа инфекции. Продолжительность лечения зависит от тяжести заболевания и определяется индивидуально.

Нарушение функции печени

Коррекция дозы не требуется.

Дети

На сегодняшний день отсутствует информация о применении препарата детям.

Передозировка

У разі передозування цефподоксиму показана підтримуюча та симптоматична терапія.

У разі передозування, зокрема у пацієнтів з нирковою недостатністю, може розвинутися енцефалопатія зворотної дії. Специфічний антидот невідомий.

Побочные реакции

Главным образом наблюдались нарушения пищеварительной системы: диарея, тошнота, рвота, боли в животе. Общие расстройства: астения, утомляемость, недомогание.

Также сообщалось о нескольких редких случаях таких побочных реакций:

Со стороны пищеварительной системы: как и в случае применения других антибиотиков широкого спектра, сообщалось о редких случаях энтероколита с геморрагической диареей, а также о редких случаях псевдомембранозного колита, метеоризм, острый панкреатит.

Со стороны гепатобилиарной системы: умеренное временное повышение трансаминаз, аспартатаминотрансферазы, аланинаминотрансферазы и щелочных фосфатаз, повышение билирубина, острый гепатит.

Со стороны кожи: аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, отек Квинке, анафилактический шок, различные сыпи, локализованная пузырьчатая сыпь, полиморфная эритема, синдром Стивенса - Джонсона и синдром Лайелла, эритема.

Со стороны нервной системы: головные боли, чувство головокружения, парестезии.

Со стороны почек и мочевыводящей системы: слабое повышение мочевины крови и креатининемия, ОПН.

Со стороны кровеносной системы: тромбоцитоз, тромбоцитопения, лейкопения и гиперэозинофилия, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, эозинофилия, лимфоцитоз, нейтропения, лейкоцитоз.

Со стороны органа слуха и равновесия: звон в ушах.

Срок годности

3 роки.

Условия хранения

Хранить при температуре ниже 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері. По 1 блістеру в картонній коробці.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

Медрайк Лимитед.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Участок № 45А и Б, Промышленный парк Анрич, ИДА Болларам, Округ Санга Редди, Телангана, Болларам (Вилледж), Джиннарам (Мандал), Санга Редди (Дист.), Телангана, Индия

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).