Состав

действующее вещество: цефуроксим;

5 мл готовой суспензии во флаконе содержат цефуроксима (в форме цефуроксима аксетила) 125 мг;

вспомогательные вещества: повидон К30, стеариновая кислота, сахароза, фруктовый ароматизатор, аспартам (Е 951), ксантановая камедь, калия ацесульфам.

Лекарственная форма

Гранулы для приготовления суспензии.

Основные физико-химические свойства: белые или почти белые рассыпчатые гранулы.

Фармакотерапевтическая группа

Противомикробные средства для системного применения. Бета-лактамные антибиотики. Код АТХ J01D C02.

Фармакодинамика

Цефуроксима аксетил - пероральная форма бактерицидного цефалоспоринового антибиотика цефуроксима, который является устойчивым к действию большинства бета-лактамаз и активен против широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов.

Бактерицидное действие цефуроксима обусловлено угнетением синтеза клеточной оболочки микроорганизмов.

Приобретенная резистентность к антибиотику отличается в разных регионах и может меняться со временем, а для отдельных штаммов может отличаться существенно. Желательно при наличии обратиться к местным данным чувствительности к антибиотику, особенно при лечении тяжелых инфекций.

Цефуроксим обычно активен в отношении таких микроорганизмов in vitro:

Чувствительные микроорганизмы:
Грамположительные аэробы: Staphylococcus aureus (метицилинчувствительные)* Коагулазоотрицательные стафилококк (метицилинчувствительный) Streptococcus pyogenes Streptococcus agalactiae
Грамнегативные аэробы: Haemophilus influenzae Haemophilus parainfluenzae Moraxella catarrhalis
Спирохети: Borrelia burgdorferi
Микроорганизмы, приобретенная резистентность которых может составлять проблему:
Грампозитивные аэробы: Streptococcus pneumoniae

Грамнегативные аэробы: Citrobacter freundii Enterobacter aerogenes Enterobacter cloacae Escherichia coli Klebsiella pneumoniae Proteus mirabilis штаммы Proteus (другие чем P. vulgaris) штаммы Providencia
Грампозитивные анаэробы: штаммы Peptostreptococcus штаммы Propionibacterium
Грамнегативные анаэробы: штаммы Fusobacterium штаммы Bacteroides
Резистентные микроорганизмы:
Грампозитивные аэробы: Enterococcus faecalis Enterococcus faecium

Грамнегативные аэробы: штаммы Acinetobacter. штаммы Campylobacter Morganella morganii Proteus vulgaris Pseudomonas aeruginosa Serratia marcescens
Грамнегативные анаэробы: Bacteroides fragilis
Другие: штаммы Chlamydia штаммы Mycoplasma штаммы Legionella

* Все метициллин S. aureus нечувствительны к цефуроксиму.

Фармакокинетика

После перорального применения цефуроксима аксетил абсорбируется в кишечнике, гидролизуется на слизистой оболочке и в виде цефуроксима попадает в кровоток.

Усвоение суспензии Зиннат повышается при одновременном приеме с пищей. Уровень абсорбции суспензии цефуроксима ниже, чем у таблеток, что приводит к более низкому уровню в плазме крови и уменьшенной системной биодоступности. Максимальный уровень цефуроксима в сыворотке крови наблюдается через 2 - 3 часа после применения препарата. Период полувыведения составляет примерно 1-1,5 часа. Уровень связывания с белками - 33-55% в зависимости от методики определения. Цефуроксим выделяется почками в неизмененном виде путем канальцевой секреции и клубочковой фильтрации.

Одновременное применение пробенецида увеличивает площадь под кривой средней концентрации в сыворотке крови на 50%.

Уровень цефуроксима в сыворотке крови уменьшается вследствие диализа.

Показания

Зиннат предназначен для лечения инфекций, перечисленные ниже, у взрослых и детей старше 3 месяцев:

- Острый стрептококковый тонзиллит и фарингит.
- Острый бактериальный синусит.
- Острый средний отит.
- Обострение хронического бронхита, вызванное возбудителями, чувствительными к цефуроксим аксетилу.
- Цистит.
- Пиелонефрит.
- Неосложненные инфекции кожи и мягких тканей.
- Ранние проявления болезни Лайма.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цефалоспориновым антибиотикам, цефуроксиму и любому из компонентов препарата. Тяжелые реакции гиперчувствительности в анамнезе (например анафилактические реакции) к любым бета-лактамным антибиотикам другого типа (пенициллины, монобактамами и карбапенемы).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Препараты, уменьшающие кислотность желудочного сока, могут уменьшать биодоступность Зинната и имеют свойство сводить к минимуму эффект ускорения абсорбции после еды.

Как и другие антибиотики, Зиннат может влиять на флору кишечника, вследствие чего возможно уменьшение реабсорбции эстрогенов и снижению эффективности комбинированных пероральных контрацептивов.

Поскольку при ферроцианидном тесте может наблюдаться ложноотрицательный результат, для определения уровня глюкозы в крови и плазме у пациентов, которые лечатся цефуроксима аксетилом, рекомендуется использовать глюкозооксидазную или гексокиназную методику. Цефуроксим не влияет на щелочно-пикратный анализ определения креатинина.

Одновременное применение с пробенецидом приводит к значительному уменьшению показателей максимальной концентрации, площади под кривой «концентрация в сыворотке - время» и периода полураспада цефуроксима. Поэтому одновременное применение с пробенецидом не рекомендуется.

Одновременное применение с пероральными антикоагулянтами может привести к повышению показателя МНО (международного нормализованного отношения).

Уровень цефуроксима в сыворотке крови уменьшается путем проведения диализа.

При лечении цефалоспоринами сообщалось о положительном тесте Кумбса. Этот феномен может влиять на перекрестную пробу на совместимость крови.

Особенности применения

Реакции гиперчувствительности

Особую осторожность нужно соблюдать при наличии у пациентов в анамнезе аллергической реакции на пенициллины или другие бета-лактамные антибиотики, поскольку существует риск появления перекрестной чувствительности. Как и при применении всех бета-лактамных противомикробных лекарственных средств, были зафиксированы серьезные и иногда летальные случаи реакций гиперчувствительности. В случае появления тяжелых реакций гиперчувствительности лечение цефуроксимом следует немедленно прекратить и дать пациенту соответствующую неотложную медицинскую помощь.

Перед началом терапии необходимо определить, наблюдались у пациента в прошлом тяжелые реакции повышенной чувствительности к цефуроксиму, другим цефалоспоринам или бета-лактамным лекарственных средствам других типов. Цефуроксим следует с осторожностью назначать пациентам, которые в анамнезе имеют случаи нетяжелых реакций повышенной чувствительности к другим бета-лактамным лекарственным средствам.

Особую осторожность нужно соблюдать при наличии у пациентов в анамнезе аллергической реакции на пенициллины или другие бета-лактамные антибиотики.

Применение цефуроксима аксетила (так же, как и других антибиотиков) может привести к чрезмерному росту Candida. Длительное применение может также привести к чрезмерному росту других нечувствительных микроорганизмов (например Enterococci, Clostridium difficile), что может, в свою очередь, требовать прекращения лечения.

При применении антибиотиков может развиться псевдомембранозный колит от легкой формы до угрожающей для жизни. Поэтому важно иметь это ввиду, если у пациентов возникает диарея во время или после антибактериальной терапии. Если возникает длительно выражена диарея или пациент ощущает резкую схваткообразные боли в животе, лечение нужно немедленно прекратить, а пациента - тщательно обследовать.

В состав гранул для приготовления суспензии входит сахароза, что следует учитывать при назначении препарата больным сахарным диабетом. Гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь по 125 мг/5 мл содержат 3 г сахарозы на дозу 5 мл. Гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь 250 мг/5 мл содержат 2,3 г сахарозы на дозу 5 мл.

Во время лечения Зиннатом болезни Лайма наблюдалась реакция Яриша - Герксгеймера, которая возникала непосредственно вследствие бактерицидного действия Зинната на микроорганизм, который вызывает болезнь Лайма, - спирохету Borrelia burgdorferi. Пациент должен знать, что это частое явление при антибиотикотерапии болезни Лайма, не требующее лечения.

В состав суспензии входит аспартам, который является источником фенилаланина, и поэтому его не следует применять для лечения больных фенилкетонурией.

При проведении последовательной терапии время изменения парентеральной терапии на пероральную определяется тяжестью инфекции, клиническим состоянием пациента и чувствительностью патогенного микроорганизма. При отсутствии клинического улучшения в течение 72 часов парентеральную терапию следует продолжать. Перед началом проведения последовательной терапии следует ознакомиться с соответствующей инструкцией по применению цефуроксима натрия.

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

Поскольку препарат может вызвать головокружение, пациентов следует предупреждать, что управлять автомобилем и работать с механизмами нужно с осторожностью.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Существуют ограниченные данные по применению цефуроксима беременным. В исследованиях на животных не выявлено отрицательного влияния цефуроксима аксетила на беременность, развитие эмбриона и плода, роды, постнатальное развитие ребенка нет. Зиннат следует назначать беременным только в случае, если польза применения лекарственного средства преобладает возможные риски.

Кормление грудью

Цефуроксим проникает в грудное молоко в небольших количествах. При применении терапевтических доз лекарственного средства не ожидается развития побочных реакций, но нельзя исключить риск появления диареи или грибковой инфекции слизистых оболочек. Поэтому в связи с этими реакциями может потребоваться прекращение кормления грудью. Также следует учитывать возможность сенсибилизирующего действия лекарственного средства. Цефуроксим назначают во время кормления грудью только после оценки врачом соотношения пользы и риска его применения.

Фертильность

Отсутствуют данные о влиянии цефуроксима аксетила на фертильность у человека. В исследованиях репродуктивной функции на животных не зафиксировано влияния этого лекарственного средства на фертильность.

Способ применения и дозы

Чувствительность к антибиотику меняется в зависимости от региона и может меняться со временем. При необходимости следует обратиться к местным данным чувствительности к антибиотику.

Обычная продолжительность лечения составляет 7 дней (может быть от 5 до 10 дней).

Для лучшего усвоения препарат в форме суспензии рекомендуется принимать во время еды.

Дозировка препарата для взрослых и детей в зависимости от инфекции приведены в таблицах 1, 2.

Взрослые и дети (³ 40 кг)

Таблица 1

Показания к применению	Доза

Острый тонзиллит и фарингит, острый бактериальный синусит	250 мг 2 раза в сутки
Острый средний отит	500 мг 2 раза в сутки
Обострение хронического бронхита	500 мг 2 раза в сутки
Цистит	250 мг 2 раза в сутки
Пиелонефрит	250 мг 2 раза в сутки
Неосложненные инфекции кожи и мягких тканей	250 мг 2 раза в сутки
Болезнь Лайма	500 мг 2 раза в сутки в течение 14 дней (терапия может длиться от 10 до 21 дня)

Дети (<40 кг)

Таблица 2

Показания к применению	Доза
Острый тонзиллит и фарингит, острый бактериальный синусит	10 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 125 мг 2 раза в сутки
Средний отит или более серьезные инфекции у детей в возрасте от 2 лет	15 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 250 мг 2 раза в сутки
Цистит	15 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 250 мг 2 раза в сутки

Пиелонефрит	15 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 250 мг 2 раза в сутки в течении 10 – 14 дней
Неосложненные инфекции кожи и мягких тканей	15 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 250 мг 2 раза в сутки
Болезнь Лайма	15 мг/кг 2 раза в сутки, максимальная доза – 250 мг 2 раза в сутки в течении 14 дней (от 10 до 21 дня)

Для детей от 3 месяцев, масса тела которых меньше 40 кг, режим дозирования уточняется согласно массой тела или возрастом ребенка. Для детей от 3 месяцев до 18 лет рекомендуемая доза составляет 10 мг/кг массы тела 2 раза в сутки для большинства инфекций (максимальная суточная доза 250 мг). При среднем отите или более серьезных инфекциях рекомендуемая доза составляет 15 мг/кг массы тела 2 раза в сутки (максимальная суточная доза 500 мг).

Для удобства применения многодозовых суспензии 125 мг/5 мл или 250 мг/5 мл ниже приводятся две таблицы (3, 4), позволяют упрощенно уточнять дозу препарата (например, с помощью мерной ложечки в 5 мл с дополнительным уровнем 2,5 мл) по возрасту и лекарственной форме.

Таблица 3

10 мг/кг (2 раза в сутки) при большинстве инфекций

Возраст	Доза (мг) 2 раза в сутки	Количество мл на разовую дозу	
		125 мг/5 мл	250 мг/5 мл
3 – 6 месяцев	40 – 60	2,5	-
6 месяцев – 2 года	60 – 120	2,5 – 5	-

2 года – 18 лет	125	5	2,5

Таблица 4

15 мг/кг (2 раза в сутки) для лечения среднего отита и тяжелых форм инфекций

Возраст	Доза (мг) 2 раза в сутки	Количество мл на разовую дозу	
		125 мг/5 мл	250 мг/5 мл
3 – 6 месяцев	60 – 90	2,5	-
6 месяцев – 2 года	90 – 180	5 – 7,5	2,5
2 года – 18 лет	180 – 250	7,5 – 10	2,5 - 5

Цефуроксим также изготавливается в форме натриевой соли для парентерального введения («Зинацеф»). Это дает возможность последовательно применять различные формы одного антибиотика, когда клинически целесообразно перейти с парентеральной формы применения препарата на пероральную.
Продолжительность как парентерального, так и перорального лечения определяется с учетом тяжести инфекции и состояния больного.

Больные с почечной недостаточностью
Цефуроксим выводится почками. Пациентам с выраженным нарушением функции почек рекомендуется уменьшить дозу цефуроксима, чтобы компенсировать его медленное выведение (см. Таблицу 5).

Таблица 5

Клиренс креатинина	T1/2 (часы)	Рекомендуемая дозировка

≥ 30 мл/мин	1,4 – 2,4	Корректировать дозу не требуется (применяют стандартную дозу от 125 мг до 500 мг 2 раза в сутки)
10 – 29 мл/мин	4,6	Стандартная индивидуальная доза каждые 24 часа
<10 мл/мин	16,8	Стандартная индивидуальная доза каждые 48 часов
В течение гемодиализа	2 – 4	Одну дополнительную стандартную дозу следует применять после каждого диализа

Больные с печеночной недостаточностью

Нет данных о применении этого лекарственного средства пациентам с нарушением функции печени. Цефуроксим выводится почками, поэтому ожидается, что имеющиеся нарушения функции печени не влияют на фармакокинетику цефуроксима.

Инструкция по растворению гранул во флаконе:

- Тщательно встряхните флакон, чтобы достичь рассыпчатости гранул. Все гранулы должны быть легкосыпучими во флаконе. Снимите крышку и защитную мембрану. Если защитная мембрана повреждена или отсутствует, верните препарат в аптеки.
- Добавьте холодную воду в мерный колпачок до мерной линии указанной на нем. Если предварительно воду кипятили, перед добавлением она должна остыть до комнатной температуры. Не смешивайте суспензию с горячими или теплыми жидкостями. Используйте холодную воду, чтобы предотвратить сгущение суспензии.
- Налейте все количество воды во флакон. Закройте флакон крышкой. Оставьте флакон, чтобы дать возможность воде полностью растворить гранулы - примерно на 1 минуту.
- Переверните флакон и интенсивно взболтайте (примерно 15 сек) пока все гранулы в флаконе перемешаются с водой.
- Переверните флакон вверх и интенсивно взбалтывайте в течение 1 минуты пока все гранулы не перемешаются с водой.

Сразу после растворения флакон с суспензию необходимо поместить в холодильник для хранения при температуре 2-8 ° С (не замораживать) и оставить минимум на 1 час перед применением первой дозы. Растворенную суспензию можно хранить до 10 дней при условии хранения в холодильнике при температуре 2-8 °С.

Всегда перед применением следует тщательно встряхнуть флакон. Используйте мерную ложку, предоставляемую для применения каждой дозы.

При желании растворенная во флаконе суспензия может быть разведена дальше холодным фруктовым соком или молоком непосредственно перед применением и применена сразу после разведения.

Дети

Опыта применения Зинната для лечения детей в возрасте до 3 месяцев нет.

Передозировка

При передозировке цефалоспорином возможно раздражение головного мозга и неврологические осложнения, включая энцефалопатию, судороги и кому. Симптомы передозировки могут возникать, если доза лекарственного средства ни была соответствующим образом скорректирована для пациентов с нарушением функции почек (см. Разделы «Способ применения и дозы» и «Особенности применения»).

Уровень цефуроксима в сыворотке крови можно уменьшить путем гемодиализа и перитонеального диализа.

Побочные реакции

Побочные реакции при применении цефуроксима аксетила выражены умеренно и имеют в основном обратимый характер.

Категории частоты следующих побочных реакций являются оценочными, поскольку для большинства явлений (например, плацебо-контролируемых исследований) надлежащие данные для расчета точной частоты отсутствуют. Кроме того, частота возникновения побочных реакций, связанных с применением цефуроксима аксетила, может изменяться в зависимости от показаний к применению лекарственного средства.

Для определения частоты побочных реакций от очень частых к редким использовали данные клинических исследований. Частоту всех других побочных

реакций (т.е. тех, которые возникали с частотой <1/10000) преимущественно определяли на основании данных послерегистрационного применения лекарственного средства. Полученная частота является скорее показателем отчетности, чем настоящей частотой явления. Данные плацебо-контролируемых исследований отсутствуют. Категория частоты, рассчитанная по результатам клинических исследований, основывается на данных, касающихся лекарственного средства (которые были оценены врачом-исследователем).

Побочные реакции, сведения о которых приведены ниже, классифицированы по органам и системам и по частоте их возникновения. Категории частоты: очень часто (≥ 1 на 10), часто (≥ 1 на 100 и <1 на 10), нечасто (≥ 1 на 1000 и <1 на 100), редко (≥ 1 на 10000 и <1 на 1000) очень редко (<1 на 10000) и неизвестно (нельзя оценить на основании существующих данных).

Инфекции и инвазии

Часто: чрезмерный рост Candida.

Неизвестно: чрезмерный рост Clostridium difficile.

Со стороны крови и лимфатической системы

Часто: эозинофилия.

Нечасто: положительный тест Кумбса, тромбоцитопения, лейкопения (иногда глубокая).

Очень редко: гемолитическая анемия.

Цефалоспорины как класс имеют свойство абсорбироваться на поверхности мембраны эритроцитов и взаимодействовать с антителами, что может привести к положительной пробе Кумбса (влияние на определение совместимости крови) и (очень редко) к гемолитической анемии.

Со стороны иммунной системы

Реакции гиперчувствительности, включающие:

Нечасто: кожная сыпь.

Редко: крапивница, зуд.

Очень редко: медикаментозная лихорадка, сывороточная болезнь, анафилактический шок.

Неизвестно: реакция Яриша-Герксгеймера.

Со стороны нервной системы

Часто: головная боль, головокружение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: гастроэнтерологические расстройства, включая диарею, тошноту, боль в животе.

Нечасто: рвота.

Редко псевдомембранозный колит (см. Раздел «Особенности применения»).

Со стороны пищеварительной системы

Часто: транзиторное повышение уровня печеночных ферментов (АЛТ, АСТ, ЛДГ), которое обычно имеет обратный характер.

Очень редко: желтуха (главным образом холестатическая), гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Очень редко: полиморфная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (экзантематозный некролиз) (см. «Со стороны иммунной системы»).

Неизвестно: ангионевротический отек.

Дети.

Профиль безопасности применения цефуроксима у детей соответствует аналогичному профиля у взрослых пациентов.

Срок годности

2 года.

После растворения срок годности суспензии во флаконе - до 10 дней при условии хранения в холодильнике при температуре 2-8 ° С.

Условия хранения

Хранить при температуре ниже 30 ° С. После растворения суспензию хранить в холодильнике при температуре 2-8 ° С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

Гранулы для приготовления 100 мл суспензии во флаконе из темного стекла с крышкой и защитной мембраной, с пластиковым мерным колпачком на крышке. Флакон вместе с мерным колпачком и мерной ложкой в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Глаксо Оперейшнс ЮК Лимитед (Великобритания)/ Glaxo Operations UK Limited (United Kingdom).

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Глаксо Оперейшнс ЮК Лимитед, Хармир Роуд, Барнард Кастл, Дюрхем, DL12 8DT, Великобритания/Glaxo Operations UK Limited, Harmire Road, Barnard Castle, Durham, DL12 8DT, United Kingdon.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.