

# БЕЛАЦЕФ

## ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ

ОДОБРЕНО  
Министерство Здравоохранения  
Республики Узбекистан  
Государственное унитарное предприятие  
«Государственный центр экспертизы и  
стандартизации лекарственных средств,  
изделий медицинского назначения  
и медицинской техники»  
№17 от 18.07.2018 г.

Торговое название препарата: Белацеф  
Действующее вещество (МНН): цефтриакон  
Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для инъекций  
Состав:  
Один флаакон содержит:  
активное вещество - цефтриакон натрия 1,193 (эквивалентный цефтриакону 1,000 г)  
Описание: Почти белый или белый с хлопьеватым оттенком порошок  
Фармакотерапевтическая группа: Антибактериальные препараты для системного использования.  
Бета-лактамные антибактериальные препараты прочие. Цефалоспорины третьего поколения.  
Код ATХ J01DD04

### Фармакологические свойства

#### Фармакодинамика

Цефтриакон подавляет синтез бактериальной клеточной стенки после связывания с пенициллин-связывающими белками. В результате прекращается биосинтез клеточной стенки (пептидогликана), что приводит к разрушению и гибели бактериальной клетки.

Цефтриакон обладает широким спектром действий в отношении грамотрицательных и грамположительных микроорганизмов, вызывающих инфекции с бактериальными и грамотрицательными бактериями.

Устойчивость бактерий к цефтриакону может быть связана с одним или несколькими из следующих механизмов:

- гидролиз бета-лактамаз, в том числе при расширенном спектре бета-лактамаз, карбапенемаз и ферментов АмпC С, которые могут индуцироваться или быть постоянно активированы в некоторых аэробных грамотрицательных бактериях;
- снижение сродства пенициллин-связывающих белков к цефтриакону;
- непроницаемость наружной мембранны грамотрицательных микроорганизмов.

#### Цефтриакон обычно активен в отношении следующих нежелательных микроорганизмов

Грамположительные аэробы

*Streptococcus pyogenes* (Group A), *Streptococcus agalactiae* (Group B), *Streptococcus pneumoniae*, *Viridans Group Streptococci*, *Staphylococci coagulase-negative* (*methicillin-susceptible*), *Staphylococcus aureus* (*methicillin-susceptible*)

Грамотрицательные аэробы

*Clostridium perfringens*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Morganella morganii*, *Proteus vulgaris*, *Serratia marcescens*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Klebsiella oxytoca*.<sup>4</sup>

Анаэробы

*Bacteroides spp.*, *Fusobacterium spp.*, *Peptostreptococcus spp.*

#### Устойчивые микрорганизмы

Грамположительные аэробы

*Staphylococcus epidermidis*, *Staphylococcus haemolyticus*, *Staphylococcus hominis*.

Грамотрицательные аэробы

*Citrobacter freundii*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Morganella morganii*, *Proteus vulgaris*, *Serratia marcescens*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Klebsiella oxytoca*.

Анаэробы

*Bacteroides spp.*, *Fusobacterium spp.*, *Peptostreptococcus spp.*

#### Виды, возбудители, у которых возможно развитие приобретенной резистентности

Грамположительные аэробы

*Enterococcus spp.*, *Listeria monocytogenes*.

Грамотрицательные аэробы

*Acinetobacter baumannii*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Stenotrophomonas maltophilia*.

Анаэробы

*Clostridium difficile*.

Другие

*Chlamydia spp.*, *Chlamydophila spp.*, *Mycoplasma spp.*, *Legionella spp.*, *Ureaplasma urealyticum*.

Примечание:

£ все устойчивые к метициллину стафилококки, устойчивы и к цефтриакону

+ частота устойчивости составляет >50%

% % еседа устойчивых штаммов, продуцирующих бета-лактамазы.

#### Фармакокинетика

Фармакокинетика цефтриакона несет нелинейный характер. Все основные фармакокинетические параметры, основанные на общей концентрации препарата, за исключением периода полувыведения, зависят от дозы.

Максимальная концентрация в плазме крови после однократного внутривенного введения 1 г препарата составляет около 81 мг/л и достигается в пределах 2-3 часов после введения. Площадь под кривой «концентрация в плазме – время» после внутривенного и внутримышечного введения одинакова. Это означает, что биодоступность цефтриакона после внутривенного введения составляет 100%. Образец распределения цефтриакона составляет 7-12 л.

Цефтриакон обратимо связывается с альбумином. Связывание с белками плазмы составляет около 95% при концентрации в плазме ниже 100 мг/л. Связь является насыщающей и уменьшается с ростом концентрации (до 85% при концентрации в плазме 300 мг/л). Благодаря меньшей концентрации альбумина в каневой жидкости, доля свободного цефтриакона в ней выше, чем в плазме.

Цефтриакон не подвергается системному метаболизму; но преобразуется в неактивные метаболиты в каневом флюте.

После введения в дозе 1-2 г, цефтриакон хорошо проникает в ткани и жидкости организма. Более 24 часов его концентрация в макрофагах, миокарде, легких, почках, печени, мозге, кишечнике, а также спонгиозной ткани и синовиальной мембране, а также в перитонеальной полости, а также в синовиальной полости и в сокретах предстательной железы).

После внутривенного введения, цефтриакон быстро проникает в спинномозговую жидкость (СМЖ), где бактерицидные концентрации в отношении чувствительных микроорганизмов сохраняются в течение 24 часов. Пик концентрации цефтриакона в СМЖ достигается примерно через 4-6 часов после внутривенной инфузии. Концентрация цефтриакона в спинномозговой жидкости у пациентов с бактериальным менингитом, составляет до 25% от плазменных уровней (в сравнении с 2% уровнем у пациентов с невоспалительной мозговой оболочкой).

Цефтриакон проходит через плацентарный барьер и в малых концентрациях попадает в грудное молоко.

Плазменный клиренс общего цефтриакона (связанного и несвязанного) составляет 10 - 22 мл/мин. Чистый клиренс составляет 5-12 мл/мин. 50-60% цефтриакона выводится в неизмененном виде с мочой, главным образом путем клубочковой фильтрации, а 40-50% выводится в неизмененном виде с желчью. Период полувыведения цефтриакона у взрослых составляет около 8 часов.

#### Фармакокинетика у особых групп пациентов

У больных с нарушением функции почек, период полувыведения цефтриакона не повышается, в связи с компенсаторным увеличением почечного клиренса. Это также связано с увеличением плазменной свободной фракции цефтриакона, способствующей параллельному увеличению общего клиренса препарата, параллельно с увеличением объема перераспределения.

Глаукомы старше 75 лет

У пожилых людей старше 75 лет средний период полувыведения цефтриакона у взрослых составляет около 8 часов.

Дети

Период полураспада цефтриакона увеличен у новорожденных детей. От рождения до 14-дневного возраста, уровень свободного цефтриакона может дополнительном повышаться из-за таких факторов, как снижение клубочковой фильтрации и нарушение связывания с белками. У детей периода полураспада меньше, чем у новорожденных и взрослых пациентов. У новорожденных, младенцев и детей плацентарный клиренс и объем распределения цефтриакона выше, чем у взрослых.

#### Показания к применению

Инфекции у взрослых и детей, вызванные чувствительными к препаратуре возбудителями:

• инфекции дыхательных путей (внебольничная, внутрибольничная пневмония, обострение хронического обструктивного заболевания легких);

• острый средний отит;

• инфекции органов брюшной полости (перитонит, инфекции почек и мочевыводящих путей (включая пиелонефрит);

• осложненные инфекции почек и мочевыводящих путей;

• осложненные инфекции костей и мягких тканей;

• генитальные инфекции, включая гонорею, сифилис, магний шанкр;

• диссеминированная болезнь Лайма (спирохетоз) (II-III стадия) стадия заболевания);

• сепсис, бактериальный менингит, бактериальный эндокардит;

• при тифе и лихорадке;

• при сальмонеллезе и сальмонеллоносительстве;

• предоперационная профилактика инфекционных осложнений;

• лихорадка у пациентов с нейтропенией, которая предположительно может быть вызвана бактериальной инфекцией.

Белацеф следует назначать в комбинации с другими антибактериальными препаратами в случаях, когда предполагаемый ряд возбудителей не входит в спектр.

#### Способ применения и дозы

В случае подтверждённой бактериемии следует рассматривать необходимость назначения наиболее высоких рекомендемых доз.

\*\* в случае назначения доз выше 2 г в сутки кратность приема препарата можно разделить на 2 (каждые 12 часов)

Специальные режимы дозирования у взрослых и детей старше 12 лет (с массой тела ≥50 кг)

Острый средний отит: можно ввести однократную дозу 1-2 г препарата Белацеф внутримышечно, в тяжелых случаях при отсутствии успеха от предыдущего лечения, Белацеф можно назначить внутримышечно в дозе 1-2 г в сутки в течение 3 дней.

Гонорея: 500 мг одноразово внутримышечно.

Сифилис: обычно рекомендуемые дозы составляют 500 мг – 1 раз в сутки (при нейросифилисе дозу можно повысить до 2 г раз в сутки), продолжительность лечения 10-14 дней. Рекомендации по дозированию при сифилисе, включая неспецифическую терапию, основаны на ограничениях данных.

Диссеминированный боррелиоз Лайма (ранняя (II стадия) и поздняя (III стадия)): по 2 г однократно в сутки на протяжении 14-21 дней (периодически, в зависимости от степени риска развития инфекции в организме).

Предоперационная профилактика хирургических инфекций: в зависимости от степени риска развития инфекции в организме.

Глаукома: 1-2 г препарата Белацеф однократно за 30-90 мин до начала операции.

Пациенты пожилого возраста: обычные дозы для взрослых пациентов.

Дети

Новорожденные (от 15 дней жизни), грудные дети и дети младше 12 лет (с массой тела менее 50 кг)

Детям с массой тела 50 кг и выше назначают дозы для взрослых.

#### Способ применения и дозы детей старше 12 лет (с массой тела более 50 кг)

Острый средний отит: можно ввести однократную дозу 1-2 г препарата Белацеф внутримышечно, в тяжелых случаях при отсутствии успеха от предыдущего лечения, Белацеф можно назначить внутримышечно в дозе 1-2 г в сутки в течение 3 дней.

Гонорея: 500 мг одноразово внутримышечно.

Сифилис: обычно рекомендуемые дозы составляют 500 мг – 1 раз в сутки (при нейросифилисе дозу можно повысить до 2 г раз в сутки), продолжительность лечения 10-14 дней. Рекомендации по дозированию при сифилисе, включая неспецифическую терапию, основаны на ограничениях данных.

Диссеминированный боррелиоз Лайма (ранняя (II стадия) и поздняя (III стадия)): по 2 г однократно в сутки на протяжении 14-21 дней (периодически, в зависимости от степени риска развития инфекции в организме).

Предоперационная профилактика хирургических инфекций: однократное введение перед операцией в дозе 20-50 мг/кг массы тела.

Сифилис: рекомендованная доза 50 мг/кг массы тела один раз в сутки, продолжительность лечения 10-14 дней. Рекомендации по дозированию при сифилисе, в том числе при неспецифической терапии, основаны на ограничениях данных, поэтому необходимо принимать во внимание национальные руководства по лечению данных заболеваний.

Противопоказания:

Пациенты пожилого возраста

При отсутствии нарушения функции почек и почек – обычные дозы для взрослых, без поправок на возраст.

У больных с нарушением функции почек нет необходимости уменьшать дозу при условии отсутствия нарушения функции почек.

Специфические противопоказания:

Пациенты с аллергией на цефтриакон

При использовании цефтриакона в качестве растворителя для препарата Белацеф следует использовать специальный способ введения.

Если в качестве растворителя использовать лиодекан, полученный раствор не входит в список

допустимых растворов сразу после приготовления.

При использовании лиодекана в качестве растворителя для препарата Белацеф следует провести очистку на порошок из лиодекана.

При использовании лиодекана в качестве растворителя для препарата Белацеф следует использовать специальный способ введения.

При использовании лиодекана в качестве растворителя для препарата Белацеф следует использовать специальный способ введения.

При использовании лиодекана в качестве растворителя для препарата Белацеф следует использовать специальный способ введения.