

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату ЦЕФТАЗОБАК (CEFTAZOVAC)

Склад.

діючі речовини: ceftriaxone і tazobactam;

1 флакон містить цефтриаксон натрію еквівалентно цефтриаксону 1,0 г, тазобактам натрію еквівалентно тазобактаму 0,125 г.

Лікарська форма. Порошок для приготування розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Антибактеріальні засоби для системного застосування. Інші бета-лактамні антибіотики. Цефалоспорини третього покоління.

Цефтриаксон, комбінації.

Код АТС J01D D54.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування інфекцій, спричинених чутливими до дії препарату мікроорганізмами:

- інфекції нижніх дихальних шляхів;
- гострий середній бактеріальний отит;
- інфекції шкіри і м'яких тканин;
- інфекції сечовивідних шляхів (неускладнені і ускладнені);
- гонорея;
- бактеріальний сепсис;
- інфекції кісток і суглобів;
- інфекції органів черевної порожнини;
- менінгіт, спричинений *Haemophilus influenzae*, *Neisseria meningitidis*, *Streptococcus pneumoniae*.

Застосовується також для профілактики інфекцій, що можуть виникнути в хірургії.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активних речовин або до інгібіторів бета-лактамази, або до антибіотиків, які належать до груп цефалоспоринів та пеніцилінів. За наявності у хворого підвищеної чутливості до пеніциліну слід врахувати можливість перехресної алергічної реакції.

Через ризик виникнення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону в жодному разі не можна застосовувати Цефтазобак з кальцієвмісними розчинами (розчин Рінгера та інші). Кальцієвмісні розчини не слід призначати протягом 48 годин після останнього введення препарату.

У новонароджених та недоношених дітей описані випадки виникнення преципітатів у легенях та нирках, які спричинили летальні наслідки при одночасному введенні цефтриаксону та кальцієвмісних препаратів.

Цефтазобак протипоказаний для застосування новонародженим віком ≤ 28 днів за необхідності (чи очікуваній необхідності) лікування внутрішньовенними розчинами, які містять кальцій, у тому числі внутрішньовенні вливання, які містять кальцій, наприклад, парентеральне харчування, у зв'язку з ризиком виникнення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону.

Цефтазобак протипоказаний у недоношених дітей віком 41 тиждень із врахуванням строку внутрішньоутробного розвитку (гестаційний вік + вік після народження).

Печінково-ниркова недостатність, кровотечі і захворювання травного тракту в анамнезі, особливо виразковий неспецифічний коліт або ентерит.

Період вагітності (особливо перший триместр), якщо для цього немає екстрених показань.

Гіпербілірубінемія у новонароджених та недоношених.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі і діти старше 12 років: зазвичай призначають 1-2 г у перерахуванні на цефтриаксон 1 раз на добу (кожні 24 години). При тяжких інфекціях або інфекціях, збудники яких мають лише помірну

чутливість до цефтриаксону, добову дозу можна збільшувати до 4 г у перерахуванні на цефтриаксон.

Діти віком до 2 тижнів: 20-50 мг/кг маси тіла 1 раз на добу. Зважаючи на недорозвиненість ферментної системи, добова доза не має перевищувати 50 мг/кг маси тіла. При визначенні дози препарату для доношених і недоношених дітей відмінностей немає.

Діти віком від 15 днів до 12 років: 20-80 мг/кг маси тіла 1 раз на добу.

Дітям з масою тіла понад 50 кг призначають дози для дорослих.

Внутрішньовенні дози 50 мг/кг або вищі слід вводити шляхом інфузії протягом не менше 30 хв.

Хворі літнього віку

Хворим літнього віку корекція дози не потрібна.

Тривалість лікування

Тривалість лікування препаратом Цефтазобак залежить від характеру і ступеня тяжкості патологічного процесу і визначається, крім цього, даними бактеріологічних досліджень. Як прийнято при терапії антибіотиками, хворим слід продовжувати приймати Цефтазобак ще протягом щонайменше 48-72 годин після того, як температура нормалізується і аналізи покажуть відсутність збудників.

У разі лікування інфекцій, спричинених *Streptococcus pyogenes*, терапія препаратом Цефтазобак може бути продовжена до 10 днів.

Комбінована терапія

Є дані про те, що відносно багатьох грамнегативних бактерій існує синергізм між цефтриаксоном і аміноглікозидами. Незважаючи на те, що підвищену ефективність таких комбінацій не завжди можна передбачити, її слід мати на увазі за наявності тяжких, загрозливих для життя інфекцій, спричинених *Pseudomonas aeruginosa*. Через фізичну несумісність цефтриаксону й аміноглікозидів їх слід вводити окремо в рекомендованих дозах.

Менінгіт

При бактеріальному менінгіті у дітей віком від 15 днів до 12 років лікування розпочинають з дози 100 мг/кг маси тіла (але не більше 4 г, у перерахуванні на цефтриаксон) 1 раз на добу. Як тільки збудник буде ідентифікований, а його чутливість визначена, дозу можна відповідно знизити. Найкращі результати досягалися при такій тривалості лікування:

Neisseria meningitidis

Haemophilus influenzae

Streptococcus pneumoniae 4 дні, 6 днів, 7 днів

Гонорея

Для лікування гонореї (спричиненої утворюючими і неутворюючими пеніциліназу штамми) рекомендується призначати разову дозу 250 мг внутрішньом'язово.

Профілактика інфекцій у хірургії

Для профілактики післяопераційних інфекцій у хірургії рекомендується – залежно від ступеня небезпеки зараження – вводити разову дозу препарату Цефтазобак 1-2 г у перерахуванні на цефтриаксон за 30-90 хв до початку операції. При операціях на товстій і прямій кишці добре зарекомендувало себе одночасне (але окреме) введення Цефтазобаку і одного з 5-нітроїмідазолів, наприклад, орнідазолу.

Ниркова та печінкова недостатність

У хворих із порушеннями функції нирок немає необхідності знижувати дозу в тому випадку, якщо функція печінки залишається нормальною.

У хворих із порушеннями функції печінки немає необхідності знижувати дозу в тому випадку, якщо функція нирок залишається нормальною.

Лише у разі ниркової недостатності з кліренсом креатиніну менше 10 мл/хв добова доза не має перевищувати 2 г.

При одночасній тяжкій нирковій та печінковій недостатності слід регулярно визначати концентрацію цефтриаксону в плазмі крові та проводити корекцію дози препарату у разі необхідності.

Хворим, які перебувають на гемодіалізі, немає потреби в додатковому введенні препарату після діалізу. Однак слід контролювати концентрацію цефтриаксону в сироватці крові на предмет можливої корекції дози, оскільки у цих хворих може знижуватися швидкість виведення. Добова доза Цефтазобаку у хворих, які перебувають на гемодіалізі, не має перевищувати 2 г у перерахуванні на цефтриаксон.

Приготування розчинів

Необхідно готувати розчини безпосередньо перед їх застосуванням.

Свіжоприготовлені розчини зберігають свою фізичну і хімічну стабільність протягом 6 годин при кімнатній температурі (або протягом 24 годин при температурі 2-8 °С). Залежно від концентрації і тривалості зберігання колір розчинів може варіювати від блідо-жовтого до бурштинового. Ця властивість активної речовини не впливає на ефективність або переносимість препарату.

Внутрішньом'язова ін'єкція

Для внутрішньом'язової ін'єкції вміст одного флакона Цефтазобаку розчиняють у 3,5 мл 1 % розчину лідокаїну; ін'єкцію роблять глибоко у сідничний м'яз. Рекомендується вводити не більше 1 г в одну сідницю.

Розчин, що містить лідокаїн, не можна вводити внутрішньовенно.

Внутрішньовенна ін'єкція

Для внутрішньовенної ін'єкції вміст одного флакона Цефтазобаку розчиняють у 10 мл води для ін'єкцій; вводять внутрішньовенно повільно (2-4 хв).

Внутрішньовенне вливання

Внутрішньовенне вливання має тривати не менше 30 хв. Для приготування розчину для вливання розчиняють вміст двох флаконів Цефтазобаку в 40 мл одного з наступних інфузійних розчинів, вільних

від іонів кальцію: 0,9 % хлорид натрію, 0,45 % хлорид натрію + 2,5% глюкоза, 5 % глюкоза, 10 % глюкоза, 6 % декстран у розчині глюкози 5 %, 6-10 % гідроксіетильований крохмаль, вода для ін'єкцій. Зважаючи на можливу несумісність, розчини, які містять цефтриаксон, не можна змішувати з розчинами, які містять інші антибіотики, як при приготуванні, так і при введенні.

Не можна застосовувати розчинники, які містять кальцій, такі як розчин Рінгера чи розчин Гартмана, для розчинення Цефтазобаку у флаконах чи для розведення відновленого розчину для внутрішньовенного введення у зв'язку з вірогідністю утворення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону. Виникнення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону також може відбуватися при змішуванні Цефтазобаку з розчинами, які містять кальцій, в одній інфузійній системі внутрішньовенного введення. Цефтазобак не можна одночасно вводити внутрішньовенно з розчинами, які містять кальцій, у тому числі з тривалими інфузіями, які містять кальцій (наприклад, парентеральне харчування).

Побічні реакції.

При застосуванні препарату Цефтазобак можливі такі побічні явища, які регресували спонтанно або після відміни препарату.

З боку травного тракту: діарея, нудота, блювання, порушення смаку; рідко – біль у животі, дисбактеріоз, суперінфекція, панкреатит, стоматит, глосит; в окремих випадках – псевдомембранозний коліт;

з боку системи крові та лімфатичної системи: можливі зміни показників периферичної крові, еозинофілія, лейкопенія, гранулоцитопенія, анемія, гемолітична анемія, тромбоцитоз, збільшення протромбінового та тромбoplastинового часу; рідко – зменшення протромбінового часу, нейтропенія, лімфопенія, тромбоцитопенія; в окремих випадках – агранулоцитоз (< 500 клітин/мкл), який переважно розвивався після 10 днів застосування кумулятивної дози 20 г та більше, зниження рівня

плазмових факторів згортання крові (II, VII, IX, X), носова кровотеча, жовтяниця;

з боку центральної нервової системи: головний біль, озноб, запаморочення; рідко – підвищене потовиділення, припливи, судомні напади, відчуття серцебиття;

алергічні реакції: кропив'янка, свербіж, висипання, алергічний дерматит, набряки; рідко – пропасниця, озноб, сироваткова хвороба, бронхоспазм, алергічний пневмоніт; окремі випадки тяжких побічних ефектів – мультиформна ексудативна еритема (синдром Стівенса-Джонсона), токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла), анафілактичні або анафілактоїдні реакції; у поодиноких випадках – анафілактичний шок;

місцеві: біль або інфільтрат у місці введення (при внутрішньом'язовому введенні); у поодиноких випадках – запальні реакції стінки вени (при внутрішньовенному введенні), яких можна уникнути, застосовуючи повільну ін'єкцію (2-4 хв);

біохімічні: підвищення активності ферментів печінки і білірубіну в плазмі крові;

інші: підвищення рівня креатиніну сироватки та рівня креатиніну в сечі, виявляються циліндри, гематурія, олігурія, анурія, можливі гостра ниркова недостатність, аритмії, затемнення на ехограмі жовчного міхура, преципітація кальцієвих солей цефтриаксону в жовчному міхурі з відповідною симптоматикою, мікози статевих шляхів, кандидоз, вагініт.

Описані вкрай поодинокі випадки утворення конкрементів у нирках, головним чином у дітей віком від 3 років, які отримували великі добові дози цефтриаксону (≥ 80 мг/кг на добу) або кумулятивні дози більше 10 г, а також у тих, які мали додаткові фактори ризику (обмежене вживання рідини, постільний режим). Утворення конкрементів у нирках може мати безсимптомний характер або проявлятися клінічно, може

спричинити ниркову недостатність, яка минає після припинення лікування препаратом.

Передозування.

Симптоми: посилення проявів побічних ефектів.

Лікування: симптоматична терапія.

Специфічного антидоту немає.

Гемодіаліз та перитонеальний діаліз не ефективні.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Безпека застосування препарату Цефтазобак у вагітних не встановлена, тому його не рекомендується призначати у період вагітності, особливо в першому триместрі. Застосування препарату в період вагітності можливе лише за суворими показаннями, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода. Цефтриаксон у малих концентраціях виділяється в грудне молоко, тому на період лікування слід припинити годування груддю.

Діти.

Препарат застосовують дітям згідно з дозуванням, вказаним у розділі «Спосіб застосування та дози».

Особливості застосування.

Перед застосуванням препарату Цефтазобак необхідно переконатися, що у хворого не спостерігалися алергічні реакції на цефалоспорины, пеніциліни чи інші лікарські засоби (див. розділ “Протипоказання”).

Як і при застосуванні інших цефалоспоринів, не можна виключати можливість анафілактичного шоку, навіть якщо в анамнезі немає відповідних вказівок. У разі виникнення алергічних реакцій слід негайно відмінити препарат та призначити відповідне лікування.

Внутрішньом'язові ін'єкції у верхній зовнішній квадрант великого сідничного м'яза повинні бути глибокими. Перед введенням розчину препарату необхідно пересвідчитися, що голка знаходиться поза судиною.

На тлі застосування антибактеріальних препаратів, у тому числі й цефтриаксону, можливе виникнення псевдомембранозного коліту, причому його прояви можуть бути як помірними, так і такими, що становлять загрозу для життя людини. Тому при виникненні діареї після введення препарату Цефтазобак необхідно виключити діагноз псевдомембранозного коліту.

Як і при лікуванні іншими антибактеріальними препаратами, можуть розвинутиися суперінфекції.

Хворим, які перебувають на гемодіалізі, немає потреби в додатковому введенні препарату після діалізу. Однак слід контролювати концентрацію цефтриаксону в сироватці на предмет можливої корекції дози, оскільки у цих хворих може знижуватися швидкість виведення.

При артеріальній гіпертензії і порушенні водно-електролітного балансу слід контролювати вміст натрію в плазмі.

Особам літнього віку і ослабленим хворим доцільно призначати вітамін К.

Пацієнтам з недостатністю вітаміну К (порушення синтезу та/або харчування) може знадобитися контроль протромбінового числа під час терапії та призначення вітаміну К (10 мг/тиждень) при збільшенні протромбінового часу до початку чи під час терапії Цефтазобаком.

У поодиноких випадках на ехограмі жовчного міхура можуть спостерігатися затемнення, що помилково сприймаються за камені. Це преципітати кальцієвої солі цефтриаксону, які зникають після відміни або закінчення лікування Цефтазобаком. Подібні зміни рідко супроводжуються будь-якою симптоматикою. Але і в таких випадках рекомендується проводити лише консервативне лікування. Якщо ці явища супроводжуються клінічною симптоматикою, то рішення про відміну препарату приймає лікар.

Під час тривалого лікування препаратом Цефтазобак рекомендується регулярно контролювати картину крові.

Зафіксовані поодинокі випадки хибнопозитивних результатів Кумбса у пацієнтів, що проходили лікування цефтриаксоном. Подібно до інших антибіотиків, Цефтазобак може призвести до одержання хибнопозитивного результату проби на галактоземію при визначенні глюкози в сечі. Тому під час лікування Цефтазобаком глюкозурію слід визначати лише ферментним методом.

Заборонено змішувати в одній ємності чи вводити одночасно цефтриаксон з кальцієвмісними препаратами, навіть використовуючи різні венозні доступи. Описані летальні випадки утворення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону в легенях та нирках новонароджених. При цьому в деяких випадках венозні доступи та час введення цефтриаксону та кальцієвмісних препаратів були різні.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Немає даних щодо впливу Цефтазобаку на здатність керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами.

Слід інформувати пацієнтів про такі можливі побічні реакції при застосуванні препарату Цефтазобак: головний біль, запаморочення.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Через ризик виникнення преципітатів кальцієвих солей цефтриаксону в жодному разі не можна застосовувати Цефтазобак з кальцієвмісними розчинами (розчин Рінгера та інші). Кальцієвмісні розчини не слід призначати протягом 48 годин після останнього введення цефтриаксону.

У новонароджених та недоношених дітей описані випадки виникнення преципітатів у легенях та нирках, які спричинили летальні наслідки при одночасному введенні цефтриаксону та кальцієвмісних препаратів.

При застосуванні Цефтазобаку у комбінації з аміноглікозидами внаслідок синергізму підвищується ефективність щодо грамнегативних

мікроорганізмів, але необхідний вибір їх оптимальних доз. Немає вказівок на те, що цефтриаксон підвищує ниркову токсичність аміноглікозидів.

Нестероїдні протизапальні засоби, антиагреганти підвищують можливість кровотечі, петльові діуретики та нефротоксичні препарати (аміноглікозиди, полімексин В) можуть призвести до порушення функції нирок.

Бактеріостатичні антибіотики знижують бактерицидний ефект цефтриаксону.

Цефтриаксон не містить N-метилтіотетразольної групи, яка б могла викликати непереносимість етанолу або кровотечі, що властиво деяким іншим цефалоспорином. Пробенецид не впливає на виведення цефтриаксону.

Подібно до інших антибіотиків, цефтриаксон може знижувати терапевтичний ефект вакцини проти тифу, проте такий ефект розповсюджується лише на ослаблений штам Ty21.

Діуретики можуть погіршувати виведення цефалоспоринів.

Як і інші цефалоспорини, цефтриаксон може підвищувати антикоагулянтний ефект антагоністів вітаміну К (таких як варфарин).

In vitro був виявлений антагонізм між хлорамфеніколом та цефтриаксоном.

Відомо, що цефтриаксон не сумісний з амзакрином, ванкомицином, флуконазолом та аміноглікозидами.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Цефтазобак – антибактеріальний лікарський засіб, фіксована комбінація цефалоспоринового антибіотика третього покоління для парентерального застосування – цефтриаксону натрію та інгібітору бета-лактамаз – тазобактаму натрію.

Цефтриаксон – це стерильний напівсинтетичний антибіотик групи бета-лактамів, цефалоспорин третього покоління з пролонгованою дією. Має широкий спектр дії. Призначений для внутрішньовенного або внутрішньом'язового введення. Має бактерицидний ефект, механізм дії якого пов'язаний з пригніченням активності ферменту транспептидази, порушенням біосинтезу пептидоглікану клітинної стінки мікроорганізмів.

Тазобактам – це стерильний інгібітор бета-лактамаз Річмонта Сайкеса III класу: пеніцилінази та цефалоспоринози. Є похідною «пеніцилінового ядра», сульфон-пеніциланової кислоти. Тазобактам необоротно пригнічує більшість бета-лактамаз, що продукуються клінічно важливими грамнегативними та грампозитивними аеробними та анаеробними бактеріями, ковалентно зв'язуючись з їх ферментами. Зокрема тазобактам характеризується високим ступенем здатності до зв'язування з плазмідопосередкованими бета-лактамазами, які часто є причиною розвитку резистентності до пеніцилінових та цефалоспоринових антибіотиків. Тазобактам у рекомендованих дозах не стимулює хромосоми бета-лактамази.

Присутність тазобактаму значно розширює спектр дії цефтриаксону. До комбінації цефтриаксон/тазобактам чутлива більшість штамів мікроорганізмів, які продукують бета-лактамази і є стійкими до цефтриаксону.

Цефтриаксон активний як *in vitro* щодо:

Грампозитивних аеробів:

Staphylococcus aureus (включаючи штамми, що продукують пеніциліназу), *Staphylococcus epidermidis*, коагулазонегативні стафілококи, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes* (бета-гемолітичні стрептококи групи А), *Streptococcus agalactiae* (стрептококи групи В), бета-гемолітичні стрептококи (групи ні А, ні В), *Viridans group streptococci*.

Примітка. Стійкі до метициліну *Staphylococcus* spp. Резистентні до цефалоспоринів, у тому числі до цефтриаксону. *Enterococcus faecalis*, *Enterococcus faecium* *Listeria monocytogenes* також виявляють стійкість до цефтриаксону.

Грамнегативних аеробів:

Acinetobacter lwoffii, *Acinetobacter anitratus* (головним чином *A. baumannii*)*, *Acinetobacter calcoaceticus*, *Aeromonas hydrophila*, *Alcaligenes faecalis*, *Alcaligenes odorans*, алкагеноподібні бактерії, *Bacteroides fragilis*, *Borrelia burgdorferi*, *Campytophaga* spp., *Citrobacter diversus* (в тому числі *C. amalonaticus*), *Citrobacter freundii**, *Escherichia coli*, *Enterobacter aerogenes*, *Enterobacter cloacae*, *Enterobacter* spp. (інші) *, *Haemophilus ducreyi*, *Haemophilus influenzae* (включаючи штами, резистентні до ампіциліну, та штами, що продукують бета-лактамазу), *Haemophilus parainfluenzae*, *Hafnia alvei*, *Klebsiella oxytoca*, *Klebsiella pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis* (включаючи штами, що продукують бета-лактамазу), *Moraxella osloensis*, *Moraxella* spp. (інші), *Morganella morganii*, *Neisseria gonorrhoeae* (включаючи як штами, що продукують пеніциліназу, так і штами, що не продукують пеніциліназу), *Neisseria meningitidis*, *Pasteurella multocida*, *Plesiomonas shigelloides*, *Proteus mirabilis*, *Proteus penneri**, *Proteus vulgaris*, *Pseudomonas fluorescens**, *Pseudomonas aeruginosa*, *Pseudomonas* spp. (інші) *, *Providentia rettgeri**, *Providentia* spp. (інші), *Salmonella typhi*, *Salmonella* spp. (нетифоїдні), *Serratia marcescens*, *Serratia* spp. (інші) *, *Shigella* spp., *Vibrio* spp., *Yersinia enterocolitica*, *Yersinia* spp. (інші).

Багато із штамів вищезазначених мікроорганізмів, які мають множинну стійкість до таких антибіотиків, як амінопеніциліни та уреїдопеніциліни, цефалоспорини першого та другого покоління, аміноглікозиди, є чутливими до цефтриаксону.

Цефтриаксон не проявляє бактерицидну активність щодо *Chlamydia trachomatis*.

Анаероби:

Bacteroides spp. (жовчочутливі)*, *Clostridium* spp. (крім *C. difficile*), *Fusobacterium nucleatum*, *Fusobacterium* spp. (інші), *Gaffkia anaerobica* (раніше: *Peptococcus*), *Peptostreptococcus* spp.

* деякі ізоляти цих видів стійкі до цефтриаксону, головним чином, внаслідок утворення

бета-лактамаз;

** деякі ізоляти цих видів стійкі до цефтриаксону внаслідок утворення низки плазмідопосередкованих бета-лактамаз.

Фармакокінетика.

Фармакокінетика цефтриаксону має нелінійний характер, тому всі основні фармакокінетичні параметри, що базуються на загальних концентраціях препарату, за винятком періоду напіввиведення, залежать від дози.

Після внутрішньом'язового введення цефтриаксон всмоктується швидко і повністю. Біодоступність становить 100 %. Після одноразового внутрішньом'язового введення 1 г препарату максимум концентрації в плазмі крові визначається через 2-3 години і становить 80 мг/л; при внутрішньовенному введенні відповідно через 30 хв максимальна концентрація становить 100-150 мг/л.

Препарат оборотно зв'язується з альбумінами плазми (85-95 %), з підвищенням концентрації препарату в крові зв'язок з білками зменшується.

Препарат не гідролізується Н-плазмідними бета-лактамазами і більшістю хромосомнозумовлених пеніциліназ і цефалоспориназ, може впливати на мультирезистентні штами, толерантні до пеніцилінів і цефалоспоринів першого і другого покоління та аміноглікозидів.

Надбана стійкість деяких штамів бактерій зумовлена продукцією бета-лактамази, що інактивує цефтриаксон.

Препарат має високий ступінь стабільності в організмі і тривалий період напіввиведення. Стабільна концентрація препарату досягається через 4 години. Мінімальні антимікробні концентрації виявляються в крові більше 24 годин.

Після введення у дозі 1-2 г цефтриаксон добре розподіляється в тканинах і рідинах організму (синовіальній, перитонеальній, інтерстиціальній), при запаленні мозкових оболонок проникає в спинномозкову рідину, препарат визначається також у кістковій тканині, проходить через плаценту. Протягом більше ніж 24 години його концентрації набагато перевищують мінімальні пригнічувальні концентрації для більшості збудників інфекцій у тканинах та рідинах (у тому числі в легенях, серці, жовчних шляхах, печінці, середньому вусі та слизовій носа, кістках, а також секреті простати).

Після внутрішньовенного введення цефтриаксон швидко проникає в спинномозкову рідину, де бактерицидні концентрації щодо чутливих мікроорганізмів зберігаються протягом 24 годин.

Цефтриаксон проходить через плацентарний бар'єр та в невеликій кількості виділяється у грудне молоко (3-4 %).

50-60 % цефтриаксону виводиться у незміненому стані нирками протягом 48 годин і приблизно 40-50 % – у незміненому стані з жовчю.

Період напіввиведення при введенні препарату в дозі 0,15-3 г становить 5,8-8,7 години, об'єм розподілу – 5,8-15,5 л, плазмовий кліренс – 0,58-1,45 л/годину, нирковий кліренс – 0,32-0,73 л/годину.

У кишечнику під впливом мікробної флори препарат перетворюється у неактивний метаболіт, а не піддається системному метаболізму.

Період напіввиведення подовжується в осіб старше 75 років (до 16 годин), у дітей (до 6,5 доби), у немовлят (до 8 днів). При недостатній

функції нирок і печінки виведення цефтриаксону уповільнюється, можлива кумуляція.

Тазобактам добре проникає в тканини і рідини організму завдяки своїм гідрофільним властивостям.

Приблизно 30 % тазобактаму зв'язується з плазмою крові.

Незначним є зв'язування тазобактаму з білками.

Тазобактам метаболізується до єдиного метаболіту, що не проявляє фармакологічної та антибактеріальної активності.

Тазобактам та його метаболіт виводяться, головним чином, нирками; 80 % введеної дози виводиться у незміненому стані, а решта – як єдиний метаболіт. Період напіввиведення тазобактаму зростає приблизно на 18 % у пацієнтів з цирозом печінки порівняно зі здоровими добровольцями. Проте ця відмінність не є підставою для корегування дози.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: кристалічний порошок від майже білого до жовто-білого кольору.

Несумісність.

Ні в якому разі не можна застосовувати Цефтазобак з кальцієвмісними розчинами (розчин Рінгера, розчин Гартмана та інші). Кальцієвмісні розчини не слід призначати протягом 48 годин після останнього введення цефтриаксону.

Цефтриаксон, що входить до складу препарату Цефтазобак, фізично несумісний з аміноглікозидами. Їх необхідно вводити окремо в рекомендованих дозах.

Зважаючи на можливу несумісність, розчини, які містять цефтриаксон, не можна змішувати з розчинами, які містять інші антибіотики, як при приготуванні, так і при введенні.

Є дані, що цефтриаксон несумісний з амсакрином, ванкомицином, флуконазолом, аміноглікозидами, пентамідином і лабеталолом.

Термін придатності 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Приготовлений розчин зберігати не більше 6 годин при кімнатній температурі і не більше 24 годин при температурі 2-8 °С.

Упаковка.

Препарат вміщують у флакони зі скла, закупорені гумовою пробкою та алюмінієвим обтискним ковпачком, спорядженим кришкою фліп-оф, що забезпечує контроль першого відкриття.

По 1 флакону вміщують у пачку з картону для споживчої тари.

Категорія відпуску за рецептом.

Виробник.

Кілітч Драгс (Індія) Лімітед.

Місцезнаходження.

Хазара № 5/1, 5/2, 5/3, вилледж-Ніхалгарх Техсіл-Паонта Сахіб, Діст-Сірмоур, Хімакал Прадеш – 173025, Індія.

Заявник.

М.Біотек Лтд., Сполучене Королівство.