Инструкция по применению
Бициллин-5 Порошок для приготовления суспензии для внутримышечного введения

Характеристики



Форма выпуска: Порошок
Страна: Россия
Производитель: Синтез
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Бензатина бензилпенициллин+Бензилпенициллин прокаина
Количество в упаковке: 1
Дозировка действующего вещества: 1 500 000 ЕД

Описание

Белый или белый со слегка желтоватым оттенком порошок, склонный к комкованию, образующий при прибавлении воды стойкую суспензию.

Действующее вещество

Бензатина бензилпенициллин+Бензилпенициллин прокаина

Состав

Состав на 1 флакон: Действующие вещества: бензатина бензилпенициллин - 1200000 ЕД, бензилпенициллин прокаина (бензилпенициллина новокаиновая соль) - 300000 ЕД.

Форма выпуска

Порошок

Фармакокинетика

Бициллин-5 является препаратом пролонгированного действия, высокая концентрация антибиотика в крови сохраняется до 4-х недель. Бензатина бензилпенициллин После внутримышечной инъекции бензатина бензилпенициллин очень медленно гидролизуется, высвобождая бензилпенициллин. Максимальная концентрация препарата в сыворотке крови достигается через 12-24 часа после инъекции. Длительный период полувыведения обеспечивает стабильную и длительную концентрацию препарата в крови: на 14 день после введения 2400000 МЕ препарата концентрация в сыворотке составляет 0,12 мкг/мл, на 21-й день после введения 1200000 МЕ препарата - 0,06 мкг/мл (1 МЕ = 0,6 мкг). Диффузия препарата в жидкости полная, диффузия в ткани очень слабая. Связь с белками плазмы 40-60%. бензатина бензилпенициллин проходит в небольших количествах через плацентарный барьер, а также проникает в грудное молоко матери. Биотрансформация препарата незначительная. Выводится преимущественно почками в неизмененном виде. За 8 суток выделяется до 33% введенной дозы. Бензилпенициллин Максимальная концентрация в плазме крови при внутримышечном введении достигается через 20-30 мин. Период полувыведения препарата составляет 30-60 мин, при почечной недостаточности 4-10 ч и более. Связь с белками плазмы - 60%. Проникает в органы, ткани и биологические жидкости, кроме ликвора, тканей глаза и предстательной железы. При воспалении менингеальных оболочек проникает через гематоэнцефалический барьер. Проходит через плаценту и проникает в грудное молоко. Выводится почками в неизмененном виде.

Показания

Препарат Бициллин-5 показан к применению у взрослых и детей. Инфекции, вызываемые чувствительными микроорганизмами: сифилис и другие заболевания, вызываемые бледной трепонемой (фрамбезия), стрептококковые инфекции (исключая инфекции, вызванные стрептококками группы В) - острый тонзиллит, скарлатина, рожистое воспаление, профилактика ревматизма.

Способ применения и дозы

Внутримышечно. Взрослым - по 1200000 ЕД + 300000 ЕД 1 раз в 4 недели. Детям дошкольного возраста - 480000 ЕД + 120000 ЕД 1 раз в 3 недели, детям старше 8 лет - 960000 ЕД + 240000 ЕД 1 раз в 4 недели. Для приготовления суспензии используют стерильную воду для инъекций, изотонический раствор натрия хлорида или 0,25-0,5% раствор прокаина (новокаина). Суспензию Бициллин-5 готовят асептически, непосредственно перед употреблением (ex tempore): во флакон с препаратом под давлением медленно (со скоростью 5 мл за 20-25 сек) вводят 5-6 мл растворителя. Содержимое флакона перемешивают и встряхивают вдоль продольной оси флакона до образования гомогенной суспензии. Допускается наличие пузырьков на поверхности суспензии у стенок флакона. Суспензию Бициллин~5 немедленно после приготовления вводят глубоко внутримышечно в верхний наружный квадрант ягодичной мышцы. Растирание ягодичной мышцы после инъекции не рекомендуется. При задержке введения немедленно после приготовления изменяются физические и коллоидные свойства суспензии, в результате чего может затрудняться ее движение через иглу шприца.

Противопоказания

Гиперчувствительность к препаратам группы пенициллинов и к другим бета-лактамным антибиотикам. Гиперчувствительность к прокаину.

Применение при беременности и кормлении грудью

Бициллин-5 в небольших количествах проникает через плацентарный барьер и в молоко матери. Применение при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Рекомендуется прекратить грудное вскармливание при необходимости назначения препарата.

Побочные действия

Инфекции и инвазии При длительной терапии - суперинфекция устойчивыми микроорганизмами и грибами. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: гемолитическая анемия, анемия, тромбоцитопения, лейкопения, гипокоагуляция. Нарушения со стороны иммунной системы: анафилактический шок, реакция Яриша-Герксгеймера, анафилактоидные реакции (астматический приступ, пурпура, симптомы со стороны желудочно-кишечного тракта). Психические нарушения: синдром Хойна (острый пенициллиновый психотический синдром). Нарушения со стороны нервной системы: нейропатия. Желудочно-кишечные нарушения: стоматит, глоссит, диарея, рвота, псевдомембранозный колит. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: гепатит, холестаз. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: крапивница, ангионевротический отек, мультиформная экссудативная эритема, эксфолиативный дерматит, у пациентов с сопутствующими дерматомикозами могут развиваться парааллергические реакции (из-за сходства антигенов пенициллинов и метаболитов дерматофитов), синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла. Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: артралгия, боли в суставах. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: нефропатия, интерстициальный нефрит. Общие нарушения и реакции в месте введения: лихорадка, боль в месте введения, инфильтраты в месте инъекции, синдром Николау (острая медикаментозная эмболия сосудов кожи). Лабораторные и инструментальные данные: положительная прямая реакция Кумбса, умеренное транзиторное повышение активности сывороточных трансаминаз.

Передозировка

Симптомы При очень высоких дозах пенициллины могут вызывать развитие энцефалопатии (нарушение сознания, двигательные нарушения, судороги). Лечение При подозрении на передозировку требуется мониторинг состояния пациента и симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими препаратами

Совместное применение не рекомендуется Так как производные пенициллина действуют только на делящиеся микробные клетки, препарат не следует комбинировать с бактериостатическими антибактериальными препаратами (например, макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины). Комбинации с другими антибактериальными препаратами возможны только в случае, если можно ожидать синергического, или, хотя бы аддитивного действия комбинации препаратов. Комбинации, которые следует применять с осторожностью При одновременном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (индометацином, фенилбутазоном, салицилатами), пробенецидом, аллопуринолом следует иметь в виду возможность конкурентного ингибирования выведения препаратов из организма. Применение пробенецида приводит к торможению канальцевой секреции бензилпенициллина, в результате чего происходит увеличение концентрации препарата в сыворотке крови и периода его полувыведения. Кроме того, пробенецид ингибирует транспорт пенициллина из спинномозговой жидкости, поэтому одновременный прием пробенецида в еще большей степени снижает проникновение бензилпенициллина в ткани мозга. Одновременное применение с пероральными антикоагулянтами может усилить их свойства (как антагонистов витамина К) и увеличить риск развития кровотечений. Рекомендуется частый контроль международного нормализованного отношения (МНО), при этом должна осуществляться коррекция дозы антагониста витамина К как во время, так и после окончания лечения препаратом. При совместном применении с дигоксином значительно возрастает риск развития брадикардии. Уменьшает экскрецию метотрексата, следствием чего может явиться повышение его токсичности.

Особые указания

Препарат не следует вводить в ткани со сниженным кровоснабжением. Перед началом терапии следует провести тщательный сбор анамнеза на предмет возможной сенсибилизации к пенициллинам и/или другим бета-лактамным антибиотикам. При лечении препаратом могут наблюдаться тяжелые (вплоть до развития анафилактического шока) и иногда фатальные аллергические реакции. Пациента следует проинформировать о возможных симптомах аллергии и о необходимости немедленно информировать врача об их возникновении. В случае появления аллергических реакций лечение препаратом следует немедленно прекратить и при необходимости назначить симптоматическую терапию. В 5-10 % случаев аллергические реакции на пенициллин могут быть перекрестными с аллергическими реакциями на цефалоспорины. В связи с этим при указаниях в анамнезе на аллергические реакции на цефалоспорины противопоказано применение

пенициллинов. Следует соблюдать особую осторожность в отношении следующих групп пациентов: пациенты с бронхиальной астмой, кожными аллергическими высыпаниями имеют повышенный риск реакций гиперчувствительности. Такие пациенты должны оставаться под наблюдением врача, как минимум, в течение 30 мин после инъекции препарата. В случае возникновения аллергических реакций препарат должен быть отменен, при необходимости показано проведение симптоматической и /или противошоковой терапии, пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью (см. раздел4.2), пациенты с сопутствующими дерматомикозами (возможно развитие парааллергических реакций). Руководствуясь общими принципами, за пациентами, подверженными развитию реакций гиперчувствительности, по возможности необходимо установить медицинское наблюдение минимум в течение получаса после введения антибиотика, так как тяжелые реакции гиперчувствительности немедленного типа могут возникать даже после первого введения препарата. При терапии сифилиса, вследствие массивного лизиса бактерий и высвобождения эндотоксинов, может развиться реакция Яриша-Герксгеймера (лихорадка, озноб, другие общие и локальные симптомы). По прошествии 2-12 часов после введения препарата могут возникнуть головная боль, потливость, озноб, миалгия, артралгия, тошнота, тахикардия, повышение и последующее снижение артериального давления. Эти симптомы проходят через 10-12 часов. Пациент должен быть проинформирован о том, что эти реакции являются обычными транзиторными осложнениями лечения антибиотиками. В случае возникновения реакции Яриша-Герксгеймера должна проводиться соответствующая симптоматическая терапия для устранения или снижения выраженности ее симптомов. У пациентов с сахарным диабетом, вследствие нарушения периферического кровообращения, возможно замедление абсорбции препарата в системный кровоток. Препарат не следует вводить в ткани с нарушенной перфузией. Нельзя вводить подкожно, внутривенно, эндолюмбально, а также в полости тела. Следует проводить периодической контроль функции почек и картины периферической крови при длительном применении препарата (более 5 дней). В случае случайного подкожного введения может возникнуть болезненное уплотнение в месте введения. Болезненность может уменьшиться после прикладывания льда к месту введения. При случайном внутрисосудистом введении препарата могут отмечаться преходящее чувство тревоги и нарушения зрения (синдром Хойна). Симптоматика, как правило, проходит в течение часа. При выраженности симптомов может потребоваться введение седативных препаратов. Па фоне применения препарата возможно развитие синдрома Николау, острой медикаментозной эмболии сосудов кожи. Синдром Николау - редкое осложнение, возникающее при внутримышечном введении лекарственных препаратов, чьи проявления включают некроз кожи и/или подлежащих тканей различной степени выраженности. При

случайном внутриартериальном введении препарата могут наблюдаться серьезные осложнения, такие как тромбоз артерий и некроз тканей (гангрена). Начальными проявлениями этих осложнений могут быть бледные "пятна" на коже ягодичной области. В результате высокого давления в месте введения может наблюдаться ретроградный заброс препарата в общую подвздошную артерию, аорту или спинальные артерии. Для того, чтобы избежать случайного внутрисосудистого введения препарата, рекомендуется перед проведением внутримышечной инъекции произвести аспирацию с целью выявления возможного попадания иглы в сосуд. Растирание ягодицы после инъекции не рекомендуется. Повторные инъекции в один и тот же участок мышечной ткани при длительном лечении депо-пенициллинами (например, лечение сифилиса) могут привести к повреждению данного участка ткани и локальному увеличению васкуляризации. Последующие инъекции увеличивают вероятность попадания вводимого вещества непосредственно в кровь путем прямого введения в кровеносный сосуд в связи с повышенным давлением во время введения или по причине "растирания" места, где было создано депо препарата. При длительном лечении рекомендуется выбирать участок для следующей инъекции на значительном расстоянии от места предыдущего введения. При лечении венерических заболеваний, если имеется подозрение на сифилис, перед началом терапии следует выполнить темнопольную микроскопию и затем в течение 4 месяцев необходимо проведение серологических исследований. В случае врожденного сифилиса также следует исследовать спинномозговую жидкость (СМЖ). Если вовлечение центральной нервной системы (ЦНС) (нейросифилис) не могут быть исключены, следует использовать другие препараты пенициллина, лучше проникающие в СМЖ. При тяжелых гнойно-воспалительных заболеваниях (тяжелая пневмония, эмпиема, сепсис, менингит, перитонит) требуются препараты, создающие более высокую концентрацию бензилпенициллина в плазме крови. Следует использовать водорастворимые соли препарата. В случае возникновения тяжелой, стойкой диареи следует заподозрить псевдомембранозный колит (возможные симптомы - водянистый стул с примесями крови/слизи, тенезмы, диффузная спастическая боль в животе, лихорадка). Данное состояние может быть жизнеугрожающим, терапия препаратом должна быть немедленно отменена, назначена соответствующая терапия, основанная на чувствительности выявленного патогена (например, ванкомицин внутрь 250 мг 4 раза сутки). Препараты, тормозящие перистальтику кишечника, противопоказаны. В связи с возможностью развития грибковых поражений целесообразно при лечении бензилпенициллином применять витамины группы В и витамин С. В случае подозрения на развитие грибковой инфекции показано применение противогрибковых лекарственных препаратов. Необходимо учитывать, что применение препарата в недостаточных дозах или слишком раннее прекращение лечения часто приводит к появлению резистентных

штаммов возбудителей. Возможность появления резистентных штаммов возбудителей следует учитывать при долговременном лечении. В случае возникновения вторичных инфекций (суперинфекций) следует принять соответствующие меры. Влияние на результаты диагностических лабораторных исследований У пациентов, получающих бензилпенициллин, наблюдается положительная прямая реакция Кумбса. После отмены пенициллина прямой антиглобулиновый тест может оставаться положительным в течение 6-8 недель. Определение белков мочи с помощью преципитатных методов (сульфосалициловая кислота, трихлоруксусная кислота), метода с Юлина-Чокальтеу или биуретовым методом может привести к ложноположительным результатам. Таким образом, белок в моче необходимо определять другими методами. Определение аминокислот в моче с помощью нингидринового Метода может также привести к ложноположительным результатам. Пенициллины связываются с альбуминами. При электрофорезе при определении содержания альбумина может наблюдаться ошибочная бисальбуминемия. При терапии бензилпенициллином неферментативное определение глюкозы и уробилиногена в моче может приводить к ложноположительным результатам. При лечении бензилпенициллином могут наблюдаться повышенные значения 17-кетостероидов (с использованием реакции Циммермана) в моче. С осторожн

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в местах, недоступных для детей.