

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
БЕНЗИЛПЕНІЦИЛІН
(BENZYL PENICILLINUM)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: benzylpenicillin; (2S, 5R, 6R)-3,3-диметил-7-оксо-6-[[фенілацетил)аміно]-4-тіа-1-азабіцикло [3,2,0] гептан-2-карбоксилат натрію;

основні фізико-хімічні властивості: дрібнокристалічний порошок білого кольору;

склад: 1 флакон містить бензилпеніциліну натрієвої солі 500 000 ОД або 1 000 000 ОД.

Форма випуску. Порошок для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Протимікробні засоби для системного застосування. Пеніциліни, чутливі до дії бета-лактамаз. Код АТС J01C E01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Бензилпеніцилін має антимікробну бактерицидну дію. Препарат перешкоджає утворенню пептидних зв'язків за рахунок інгібування транспептидази, порушує пізні етапи синтезу пептидоглікану клітинної стінки, що призводить до лізису клітин, що діляться. Препарат активний відносно грам-позитивних бактерій (стафілококів, стрептококів, пневмококів, коринебактерій дифтерії, анаеробних спороутворюючих паличок, палички сибірки), грам-негативних коків (гонококів та менінгококів), а також відносно спірохет, деяких актиноміцетів. До дії бензилпеніциліну стійкі пеніциліназоутворюючі штами стафілококів та інших мікроорганізмів. Препарат не активний відносно більшості грам-негативних бактерій, рикетсій, вірусів, найпростіших, грибів. Руйнується пеніциліназою.

Фармакокінетика. При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація у сироватці крові досягається через 30 - 60 хв; через 3 - 4 год після одноразової ін'єкції у крові антибіотик виявляється у слідових концентраціях. При підшкірному введенні швидкість всмоктування менш стабільна, зазвичай максимальна концентрація у сироватці крові досягається через 60 хв. Зв'язування з білками плазми крові становить 60 %. Добре проникає у тканини та рідини організму, за винятком ліквору, тканин ока та простати, але при запаленні оболонок мозку його концентрація у спинномозковій рідині підвищується. Період напіввиведення становить 30 - 60 хв, при порушенні функції нирок – 4 - 10 год, а при одночасному порушенні функції нирок та печінки - до 16-30 год. З організму виводиться нирками у незміненому вигляді. У незначній кількості екскретується зі слиною, потом, молоком, жовчю. Не має кумулятивного ефекту.

Показання для застосування. Бензилпеніцилін застосовують при захворюваннях, спричинених чутливими до нього мікроорганізмами: пневмонії, гострому, підгострому, септичному ендокардиті, перикардиті, менінгіті, гострих та хронічних остеомієлітах, гнійному плевриті, інфекціях сечовивідних та жовчовивідних шляхів, ранових інфекціях, гнійних інфекціях шкіри, м'яких тканин, слизових оболонок, різних формах ангіни, дифтерії, скарлатині, бешиховому запаленні, сибірці, сифілісі, гонорейі та інших інфекційних захворюваннях. Препарат призначають також при лікуванні гнійно-запальних захворювань в акушерсько-гінекологічній та отоларингологічній практиці.

Спосіб застосування та дози. Препарат вводять внутрішньом'язово, підшкірно, внутрішньовенно (струминно або краплинно), ендолумбально. Найбільш поширений внутрішньом'язовий спосіб введення. При внутрішньом'язовому та внутрішньовенному введенні добова доза для дорослих варіює від 250 000 до 60 000 000 ОД. При інфекціях середньої тяжкості разова доза препарату становить звичайно 250 000 - 500 000 ОД; добова – 1 000 000 - 2 000 000 ОД; при тяжких інфекціях вводять до 10 000 000 - 20 000 000 ОД на добу; при газовій ганрені – до 40 000 000 - 60 000 000 ОД. Добова доза

для дітей віком до 1 року становить 50 000 - 100 000 ОД/кг, від 1 року – 50 000 ОД/кг, за життєвими показаннями – 500 000 ОД/кг. Кратність введення препарату – 4 - 6 разів на добу.

Розчини Бензилпеніциліну готують безпосередньо перед їх застосуванням. Для внутрішньом'язового введення до вмісту флакона додають 1 - 3 мл стерильної води для ін'єкцій або ізотонічного розчину натрію хлориду або 0,5% розчину новокаїну. Приготовлений розчин вводять глибоко у верхньозовнішній квадрант сідниці. Для внутрішньом'язового струминного введення призначену разову дозу розчиняють 5 - 10 мл стерильної води для ін'єкцій або ізотонічного розчину натрію хлориду і вводять повільно протягом 3 - 5 хв. Для внутрішньовенного краплинного введення призначену разову дозу антибіотика розчиняють у 100 - 200 мл ізотонічного розчину натрію хлориду або 5% розчину глюкози і вводять зі швидкістю 60 - 80 крапель за хвилину. Внутрішньовенно препарат вводять 1 - 2 рази на добу, поєднуючи із внутрішньом'язовими ін'єкціями. Підшкірно Бензилпеніцилін застосовують для обколювання інфільтратів у концентрації 100 000 - 200 000 ОД в 1 мл 0,25 - 0,5% розчину новокаїну. У порожнини (черевну, плевральну та ін.) розчин Бензилпеніциліну дорослим вводять у концентрації 10 000 - 20 000 ОД в 1 мл, дітям – 2000 - 5000 ОД в 1 мл. Розчиняють у стерильній воді для ін'єкції або ізотонічному розчині натрію хлориду. Тривалість лікування – 5 - 7 днів з наступним переходом на внутрішньом'язове введення. Ендолюмбально препарат вводять при інфекційних захворюваннях головного, спинного мозку, мозкових оболонки. Дорослим призначають у дозі 5000 - 10 000 ОД, дітям – 2000 - 5000 ОД, вводять повільно – 1 мл за хвилину, 1 раз на добу. Розчиняють у стерильній воді для ін'єкцій або ізотонічному розчині натрію хлориду із розрахунку 1000 ОД в 1 мл. Перед ін'єкцією антибіотика спочатку витягають 5 - 10 мл спинномозкової рідини і додають її до розчину антибіотика у рівній пропорції. Ін'єкції повторюють протягом 2 - 3 днів, після чого переходять на внутрішньом'язове введення.

Лікування хворих на сифіліс, гонорею проводять за спеціально розробленими схемами. Залежно від форми та тяжкості захворювання, Бензилпеніцилін застосовують від 7 - 10 днів до 2-х місяців і більше (сепсис, септичний ендокардит та ін.).

У хворих з вираженою печінковою або нирковою недостатністю дози препарату відповідно коригують. При кліренсі 100 - 60 мл/хв. (креатин сироватки крові – 0,8 - 1,5 мг %) пацієнтам віком до 60 років бензилпеніцилін можливо вводити в дозі до 60 000 000 МО на добу, після 60 років – 10 000 000 - 40 000 000 МО на добу за 3 введення з інтервалом 8 год; при кліренсі креатину 50 - 40 мл/хв (креатин сироватки крові – 1,5 - 2 мг %) вводять в дозі до 10 000 000 - 20 000 000 МО на добу за 3 введення з інтервалом 8 год; при кліренсі креатину 30 - 10 мл/хв (креатин сироватки крові – 2 - 8 мг %) вводять в дозі до 5 000 000 - 10 000 000 МО на добу за 2 - 3 введення з інтервалом 8 - 12 год; при кліренсі креатину менше 10 мл/хв (креатин сироватки крові – 15 мг %) вводять в дозі до 2 000 000 - 5 000 000 МО на добу за 1 - 2 введення з інтервалом 8 год.

Побічна дія. Можливі алергічні реакції (кропив'янка, еозинофілія, набряк Квінке, бронхоспазм, головний біль, артралгія, гарячка), дисфункція печінки, нефрит, нудота, блювання, порушення насосної функції міокарда. У цих випадках введення препарату негайно припиняють та проводять симптоматичну терапію. Ендолюмбальне введення може спричинити нейротоксикоз (нудота, блювання тощо), тому ендолюмбальні ін'єкції необхідно проводити з великою обережністю. В окремих випадках можливий розвиток анафілактичного шоку. При появі перших ознак шоку – вводять адреналін, серцево-судинні засоби (корглікон, еуфілін та ін.), гормональні препарати (гідрокортизон), десенсибілізуючі засоби (піпольфен, супрастин). За необхідності проводять штучну вентиляцію легень, терапію киснем. В ослаблених хворих, новонароджених, осіб літнього віку при тривалому лікуванні можливі тяжкі ураження слизових оболонок і шкіри, а також суперінфекція, спричинена стійкою до препарату мікрофлорою. Таким хворим призначають вітаміни групи В, аскорбінову кислоту, ністатин.

Протипоказання. Не призначати вагітним та у період годування груддю (лише за життєвими показаннями), підвищеній чутливості до препаратів групи пеніцилінів і цефалоспоринів, при бронхіальній астмі, сінній гарячці, кропив'янці.

Передозування. Застосування дуже великих доз препарату, особливо при ендоліумбальному введенні, може спричинити нейротоксичні явища (нудота, блювання, підвищене рефлекторне збудження, симптоми менінгізму, судоми, кома); порушення регуляції артеріального тиску. В таких випадках введення препарату слід припинити. Лікування симптоматичне.

Особливості застосування. Призначаючи пеніциліни, необхідно детально ознайомитися з анамнезом, чи не було раніше алергічних реакцій на попередні ін'єкції пеніцилінів. Пеніциліни протипоказані також хворим, які мають алергічні реакції на цефалоспорины, а також інші алергічні реакції, такі як бронхіальна астма, сінна гарячка, кропив'янка та ін., дітям з ескудативним діатезом. Розчин Бензилпеніциліну застосовують одразу після приготування. Не допускається додавання до розчинів препарату будь-яких інших лікарських засобів. Застосування препарату можливе лише при патологічних процесах, обумовлених чутливими до нього мікроорганізмами. При появі резистентності збудників до препарату його замінюють іншими антибіотиками. У випадку, коли ефект від застосування препарату відсутній через 3 - 5 днів після початку лікування, необхідно перейти до застосування інших антибіотиків. При додаванні Бензилпеніциліну до розчину новокаїну може утворюватися мутний розчин, але це не є перешкодою для внутрішньом'язового введення препарату. У зв'язку з можливістю розвитку грибкових уражень, доцільно при тривалому лікуванні бензилпеніциліном призначати вітаміни групи В та вітамін С, а за необхідності – ністатин та леворин. Необхідно враховувати, що застосування недостатніх доз препарату призводить до появи резистентних штамів збудників інфекцій.

З обережністю слід застосовувати препарат пацієнтам з порушенням функції нирок, із серцевою недостатністю, схильністю до алергічних реакцій, у період вагітності та годування груддю. Застосування препарату не впливає на швидкість реакції при керуванні автотранспортом.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Ефект препарату послаблюють засоби, що викликають бактеріостаз (тетрациклін). Пробенецид знижує канальцеву секрецію препарату, підвищуючи його концентрацію у плазмі крові, та подовжує період напіввиведення. Не рекомендується застосовувати як розчинник розчин Рингера або інші натріймісні розчини. У поєднанні з антибіотиками-аміноглікозидами, макролідами, а також із сульфаніламідними препаратами бензилпеніцилін виявляє синергічну дію. Допускається поєднання препарату з ністатином та леворином.

Ефект препарату знижують бактеріостатичні лікарські препарати (хлорамфенікол), а підвищують його активність клавуланова кислота та інші інгібітори бета-лактамаз.

Не рекомендується поєднувати бензилпеніцилін з НПЗЗ (індометацин, фенілбутазон, саліцилати).

Умови та термін зберігання. Зберігати у сухому, недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С. Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 500 000 ОД або 1 000 000 ОД порошку у флаконах № 1.

Виробник. ТОВ «АВАНТ».

Адреса. Україна, м. Київ, вул. Ежена Потье, 14.