

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
БЕНЗИЛПЕНІЦИЛІН
(BENZYL PENICILLIN)

Склад:

діюча речовина: benzylpenicillin;

1 флакон містить бензилпеніциліну натрієвої солі стерильної - 500 000 ОД або 1 000 000 ОД.

Лікарська форма. Порошок для розчину для ін'єкцій.

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

Клінічні характеристики.**Показання.**

Інфекції, спричинені чутливими до препарату мікроорганізмами:

- *інфекції дихальних шляхів і ЛОР-органів:* ангіна, пневмонія, гнійний плеврит, дифтерія, скарлатина, актиномікоз легень;
- *інфекції сечостатевої системи:* цистит, сифіліс, гонорея, кольпіт, ендocerвіцит, ендометрит, аднексит, сальпіngo-оофорит;
- *інфекції органа зору:* кон'юнктивіт, блефарит, дакріоцистит;
- гнійні інфекції шкіри та м'яких тканин;
- септичний ендокардит, сепсис;
- остеомієліт;
- ранові інфекції;
- бешіха;
- сибірка;
- менінгіт;
- перитоніт;
- інфекції жовчовивідних шляхів.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до бензилпеніциліну та до β -лактамних антибіотиків (пеніцилінів, цефалоспоринів, карбапенемів);
- бронхіальна астма;
- сінна гарячка;
- кропив'янка та інші алергічні захворювання;
- епілепсія (для ендоліомбального введення);
- період годування груддю.

Спосіб застосування та дози.

Перед введенням необхідно провести попередню шкірну пробу на переносимість препарату та новокаїну за умови використання його для розведення, при відсутності протипоказань до її проведення.

Препарат вводять внутрішньом'язово, підшкірно, внутрішньовенно (струминно або краплинно), інтратекально, у порожнини організму. Найпоширеніший внутрішньом'язовий шлях введення.

Внутрішньовенно: при інфекціях середньої тяжкості разова доза препарату для дорослих становить зазвичай 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 гангрені – до 40 000 000-60 000 000 ОД. Зазвичай добова доза для дітей віком до 1 року становить 50 000-100 000 ОД/кг, старше 1 року – 50 000 ОД/кг, при необхідності добову дозу можна збільшити до 200 000-300 000 ОД/кг, за життєвими показниками

– до 500 000 ОД/кг. Кратність введення препарату – 4-6 разів на добу. Розчин Бензилпеніциліну готують безпосередньо перед його застосуванням. Для внутрішньовенного струминного введення разову дозу (1 000 000-2 000 000 ОД) препарату розчиняють у 5-10 мл стерильної води для ін'єкцій або у 0,9 % розчину натрію хлориду і вводять повільно протягом 3-5 хвилин. Для внутрішньовенного краплинного введення 2 000 000-5 000 000 ОД антибіотика розчиняють у 100-200 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або 5 % розчину глюкози і вводять зі швидкістю 60-80 крапель за 1 хвилину.

Внутрішньовенно препарат вводять 1-2 рази на добу, поєднуючи з внутрішньом'язовими введеннями. *Внутрішньом'язово:* при інфекціях середньої тяжкості разова доза препарату для дорослих становить зазвичай 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 гангрені – до 40 000 000-60 000 000 ОД. Зазвичай добова доза для дітей віком до 1 року становить 50 000-100 000 ОД/кг, старше 1 року – 50 000 ОД/кг, при необхідності добову дозу можна збільшити до 200 000-300 000 ОД/кг, за життєвими показаннями – до 500 000 ОД/кг. Кратність введення препарату – 4-6 разів на добу. Для внутрішньом'язового введення додають до вмісту флакона 1-3 мл стерильної води для ін'єкцій або 0,9 % розчину натрію хлориду, або 0,5 % розчину новокаїну. Розчин, що утворився, вводять глибоко у м'яз у верхній зовнішній квадрант сідниці.

Підшкірно: Бензилпеніцилін застосовують для обколювання інфільтратів у концентрації 100 000-200 000 ОД у 1 мл 0,25-0,5% розчину новокаїну. У порожнини (черевну, плевральну тощо) розчин Бензилпеніциліну дорослим вводять у концентрації 10 000-20 000 ОД в 1 мл, дітям – 2 000-5 000 ОД у 1 мл. Розчиняють у стерильній воді для ін'єкцій або 0,9 % розчині натрію хлориду. Тривалість лікування – 5-7 днів з наступним переходом на внутрішньом'язове введення.

Інtrateкально: препарат вводять при гнійних захворюваннях головного, спинного мозку, мозкових оболонок. Дорослим призначають у дозі 5 000-10 000 ОД, дітям старше 1 року – 2 000-5 000 ОД, вводять повільно – 1 мл за хвилину 1 раз на добу. Препарат розводять у стерильній воді для ін'єкцій або у 0,9 % розчині натрію хлориду із розрахунку 1 000 ОД у 1 мл. Перед ін'єкцією із спинномозкового каналу видаляють 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 місяців і більше (сепсис, септичний ендокардит тощо).

Побічні реакції.

Реакції гіперчутливості: шкірні висипання, свербіж, пропасниця, озноб, артралгія, набряки, кропив'янка, багатоформна ексудативна еритема, ексфолювативний дерматит, ангіоневротичний набряк Квінке, анафілактичний шок.

З боку органів дихання: бронхоспазм.

З боку центральної та периферичної нервової системи: запаморочення, головний біль, шум у вухах. Ендолюмбальне введення може викликати нейротоксикоз (нудота, блювання, симптоми менінгізму, судоми).

З боку травного тракту: нудота, стоматит, глосит, діарея, псевдомембранозний коліт, порушення функції печінки.

З боку сечостатевої системи: інтерстиціальний нефрит.

З боку серцево-судинної системи: коливання артеріального тиску, порушення насосної функції міокарда.

З боку крові та лімфатичної системи: еозинофілія, позитивні результати тесту Кумбса, гемолітична анемія, лейкопенія, тромбоцитопенія, агрунолоцитоз.

Інші: в ослаблених хворих, новонароджених, осіб літнього віку при тривалому лікуванні може виникнути суперінфекція, викликана стійкою до препарату мікрофлорою (дріжджоподібні гриби, грамнегативні мікроорганізми). У пацієнтів, які проходять курс лікування з приводу сифілісу, може також виникати реакція Яриш-Герксгеймера вторинно до бактеріолізу.

Передозування.

Проявляється токсичною дією на ЦНС (частіше при ендолумбальному введенні). Виникає рефлекторне збудження, головний біль, нудота, блювання, судоми, міальгія, артралгія, симптоми менінгізму, кома. В таких випадках введення препарату слід припинити. Лікування – симптоматичне, яке включає гемодіаліз, перитонеальний діаліз, особливу увагу слід приділяти водно-електролітному балансу.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування в період вагітності можливе лише у тому випадку, коли очікувана користь для жінки перевищує потенційний ризик для плода. При необхідності застосування препарату слід припинити годування груддю.

Діти. З особливою обережністю слід застосовувати препарат дітям віком до 2 років.

Особливості застосування.

Перед початком лікування пацієнтів необхідно перевірити на гіперчутливість. Після обстеження та введення препарату протягом 30 хвилин треба бути готовим до введення адреналіну. Пацієнтів слід попередити щодо можливості виникнення алергічних реакцій, та при необхідності повідомляти про них лікареві. Тим, у кого розвинулись алергічні реакції на препарат, слід припинити лікування та призначити симптоматичне лікування адреналіном, антигістамінами препаратами та кортикостероїдами.

Розчини Бензилпеніциліну застосовують одразу після приготування. 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 або поєднувати Бензилпеніцилін з іншими антибіотиками або синтетичними хіміотерапевтичними засобами. При цьому слід враховувати можливість посилення побічної дії. Хворим старше 60 років та вагітним жінкам не рекомендується призначати великі дози (понад 10 000 000 ОД на добу). При тривалому лікуванні слід контролювати електролітний баланс, формулу крові та функцію нирок. З особливою обережністю препарат слід застосовувати немовлятам, пацієнтам, хворим на сифіліс, тяжку кардіоміопатію, алергічний діатез, бронхіальну астму, гіповолемію, епілепсію, пацієнтам із порушеннями функції нирок та печінки та хворим на цукровий діабет.

У хворих із відомою гіперчутливістю до цефалоспоринів можлива перехресна алергія.

Довготривала тяжка діарея може спричинити підозру щодо розвитку псевдомембранозного коліту. Цей стан є небезпечним для життя, тому препарат слід терміново відмінити з подальшим комплексним лікуванням.

При розчиненні Бензилпеніциліну у розчині новокаїну може утворюватись мутний розчин внаслідок утворення новокаїнової солі бензилпеніциліну, що не є перешкодою для внутрішньом'язового введення препарату.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Не впливає на здатність керувати автотранспортними засобами та працювати з іншими складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. У поєднанні з аміноглікозидами, макролідами, сульфаніламідними препаратами бензилпеніцилін виявляє синергічну дію. Ефект препарату зменшують бактеріостатичні лікарські засоби (хлорамфенікол), а підвищують його активність інгібітори бета-лактамаз. Не рекомендується поєднувати бензилпеніцилін з нестероїдними протизапальними засобами, етинілестрадіолом, препарат підвищує ефективність непрямих антикоагулянтів. Діуретики, алопуринол, блокатори каналів своєї секреції, фенілбутазон, нестероїдні

протизапальні препарати блокують каналцеву секрецію, внаслідок чого підвищується концентрація бензилпеніциліна у плазмі крові, збільшується період його напіввиведення та зростає ризик розвитку токсичної дії. При сумісному застосуванні з алопуринолом підвищується ризик розвитку шкірного висипу. Бензилпеніцилін знижує кліренс і збільшує токсичність метотрексату, може знижувати ефект пероральних контрацептивів.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Бензилпеніцилін має антимікробну бактерицидну дію. Механізм дії: 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 *грампозитивних бактерій Staphylococcus spp., Streptococcus spp. (у т. ч. Streptococcus pneumoniae), Corynebacterium diphtheriae, Bacillus anthracis, деяких грамнегативних мікроорганізмів (у т. ч. Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis), анаеробних спороутворюючих паличок, а також Actinomyces spp., Spirochaetaceae.*

Препарат неактивний відносно більшості грамнегативних бактерій, рикетсій, вірусів, найпростіших, грибів. Руйнується пеніциліназою. За останні роки відзначається зміна чутливості гонококів, гемолітичних стрептококів, стафілококів і пневмококів до бензилпеніциліну.

Фармакокінетика. При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація препарату в крові створюється через 30-60 хвилин; через 3-4 години після одноразової ін'єкції у крові є сліди антибіотика. При підшкірному введенні швидкість всмоктування менш постійна, зазвичай максимальна концентрація у крові спостерігається через 60 хвилин. Концентрація та тривалість циркуляції бензилпеніциліну у крові залежать від введеної дози. Зв'язується з білками крові на 60 %. Антибіотик добре проникає в органи, тканини та рідини організму, за винятком ліквору, тканини ока та простати, але при запаленні оболонок мозку його концентрація у спинномозковій рідині підвищується. Період напіввиведення становить 30-60 хвилин, при порушенні функції нирок – 4-10 годин, а при одночасному порушенні функції печінки та нирок – до 16-30 годин. З організму швидко виводиться нирками (клубочкова фільтрація та каналцева секреція) у незміненому вигляді. У незначній кількості екскретується зі слиною, потом, грудним молоком, жовчю. Не має кумулятивного ефекту.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: кристалічний порошок білого або майже білого кольору.

Несумісність. Бензилпеніцилін не можна змішувати в одній ємкості з іншими лікарськими засобами. Не рекомендується застосовувати як розчинник розчин Рінгера або інші натрійвмісні розчини, які містять глюкозу. Препарат несумісний з іонами металів та симпатоміметичними амінами.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 500 000 ОД або 1 000 000 ОД у флаконах; у флаконах № 10 в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ВАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження. Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.