Бициллин-1



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бензатина бензилпенициллин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Порошок для приготовления суспензии для в/м введения белого или белого со слегка желтоватым оттенком цвета, склонный к комкованию, образующий при добавлении воды стойкую суспензию.

	1 фл.
бензатина бензилпенициллин	2.4 млн. ЕД

Флаконы объемом 10 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антибиотик группы пенициллинов пролонгированного действия, разрушающихся пенициллиназой. Оказывает бактерицидное действие. В основе механизма действия лежит нарушение синтеза пептидогликана - мукопептида клеточной оболочки, что приводит к ингибированию синтеза клеточной стенки микроорганизма, подавлению роста и размножения бактерий.

Активен в отношении грамположительных бактерий: Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus pneumoniae, Streptococcus pyogenes группы А), Staphylococcus spp. (не образующих пенициллиназу), Corynebacterium diphtheriae; *грамотрицательных бактерий:* Neisseria gonorrhoeae, Neisseria meningitidis; *анаэробных бактерий:* Bacillus anthracis, Clostridium spp., Actinomyces israelii; *также в отношении* Treponema spp.
К препарату *устойчивы* Staphylococcus spp., образующие пенициллиназу.

Фармакокинетика

Всасывание

После в/м инъекции бензатина бензилпенициллин очень медленно гидролизуется, высвобождая бензилпенициллин. C_{max} в сыворотке крови достигается через 12-24 ч после инъекции.

Распределение и метаболизм

Длительный период полувыведения обеспечивает стабильную и длительную концентрацию препарата в крови: на 14-й день после введения 2.4 млн. ЕД препарата концентрация в сыворотке составляет 0.12 мкг/мл; на 21-й день после введения 1.2 млн. ЕД - 0.06 мкг/мл (1 ЕД=0.6 мкг). Диффузия препарата в жидкости полная, диффузия в ткани

очень слабая.

Связывание с белками плазмы - 40-60 %.

Бензатина бензилпенициллин проникает в небольших количествах через плацентарный барьер, а также выделяется с грудным в молоком.

Биотрансформация препарата незначительная.

Выведение

Выводится преимущественно почками в неизмененном виде. За 8 сут выделяется до 33 % введенной дозы.

Показания к применению:

Для лечения инфекций, вызываемых чувствительными к препарату микроорганизмами:

— сифилис (в качестве монотерапии);

— фрамбезия;

— пинта;

— острый тонзиллит;

— скарлатина.

Для профилактики инфекций, вызываемых чувствительными к препарату микроорганизмами:

— повторные атаки после острой ревматической лихорадки;

— рецидивы рожи;

— раневая инфекция;

— послеоперационные осложнения.

Относится к болезням:

- Инфекции
- Лихорадка
- Ревматизм
- Ревматическая лихорадка
- Сифилис
- Скарлатина
- Тонзиллит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к бета-лактамным антибиотикам (пенициллинам и цефалоспоринам).

С *осторожностью* следует назначать при склонности к аллергическим реакциям, псевдомембранозном колите, почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Препарат вводят только глубоко в/м в верхний наружный квадрант ягодицы. При появлении крови в шприце, свидетельствующей о попадании иглы в сосуд, следует извлечь шприц и произвести инъекцию в другое место. При необходимости двух инъекций препарат следует вводить в разные ягодицы.

Препарат нельзя вводить в/в!

Взрослым при *превентивном лечении сифилиса* назначают однократно 2.4 млн. ЕД; при *первичном сифилисе* - по 1 инъекции (2.4 млн. ЕД) в/м с интервалом 7 дней (курс - 2 инъекции); при *вторичном и раннем скрытом сифилисе* - по 1 инъекции (2.4 млн. ЕД) в/м с интервалом 7 дней (курс - 3 инъекции).

Для *профилактического лечения* **ребенка, рожденного матерью с нелеченным сифилисом,** - по 1 инъекции (50 000 ЕД/кг массы тела) в/м с интервалом 7 дней (курс - 3 инъекции), доза делится пополам и вводится в разные ягодицы.

При *профилактическом лечении* **ребенка в связи с недостаточным лечением матери или серорезистентностью сифилиса** - по 1 инъекции (50 000 ЕД/кг массы тела) в/м с интервалом 7 дней (курс - 2 инъекции).

При *лечении фрамбезии и пинты (эндемические трепонематозы)* **детям** - 1.2 млн. ЕД однократно; **взрослым** - 2.4 млн ЕД однократно.

При *остром тонзиллите, скарлатине, роже, раневых инфекциях в острой фазе* **детям до 12 лет -** 0.6 млн. ЕД каждые 3 дня или 1.2 млн. ЕД каждые 2-4 недели в зависимости от тяжести инфекции; **взрослым** - 1.2-2.4 млн. ЕД 1 раз в неделю.

Для *профилактики повторных атак после перенесенной острой ревматической лихорадки* **детям с массой тела <25 кг** - 0.6 млн. ЕД 1 раз в 3 недели; **детям с массой тела >25 кг** - 1.2 млн. ЕД 1 раз в 3 недели; **подросткам и взрослым** - 2.4 млн. ЕД 1 раз в 3 недели. Длительность профилактики устанавливается индивидуально.

Для *профилактики рецидивов рожи* **детям** - 0.6 ЕД 1 раз в 2 недели или 1.2 млн. ЕД каждые 3-4 недели; **взрослым** при *сезонных рецидивах* - 2.4 млн. ЕД 1 раз в 4 недели на протяжении 3-4 месяцев ежегодно; при *частых рецидивах* - 2.4 млн. ЕД 1 раз в 3-4 недели на протяжении 2-3 лет.

Для *профилактики послеоперационных инфекций* **детям** - 0.6 млн. ЕД или 1.2 млн. ЕД; **взрослым** - 2.4 млн. ЕД каждые 7-14 дней до полного выздоровления.

При **почечной недостаточности** дозы снижаются в соответствии с КК: при **КК от 10 до 50 мл/мин** вводят 75% от суточной дозы препарата, при **КК <10 мл/мин** вводят 25-50% от суточной дозы препарата.

Правила приготовления раствора
Суспензию препарата готовят в асептических условиях непосредственно перед использованием: во флакон вводят 3-5 мл воды для инъекций или 0.9 % раствора натрия хлорида. Смесь перемешивают до получения равномерной взвеси, быстро вращая флакон между ладонями в течение не менее 1 мин или осторожно встряхивая флакон в направлении его продольной оси в течение 30 с.

Побочное действие:

Аллергические реакции: анафилактический шок, крапивница, лихорадка, боли в суставах, ангионевротический отек, эксфолиативный дерматит, полиморфная эритема, затруднение дыхания. При терапии сифилиса из-за высвобождения эндотоксинов может развиться реакция Яриша-Герксгеймера.

Со стороны системы кроветворения: обратимые анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: стоматит, глоссит, тошнота, рвота, диарея, кандидоз, были описаны отдельные случаи развития псевдомембранозного колита при применении препарата; редко умеренное транзиторное повышение уровня сывороточных трансаминаз.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - острый интерстициальный нефрит.

При длительной терапии возможно развитие суперинфекции устойчивыми микроорганизмами и грибами.

Применение высоких доз бета-лактамных антибиотиков, особенно при почечной недостаточности, может вызвать развитие энцефалопатии (в т.ч. нарушение сознания, двигательные нарушения, судороги).

У детей возможно развитие местных реакций на введение препарата.

Передозировка:

В настоящее время о случаях передозировки препарата Бициллин-1 не сообщалось.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бензатина бензилпенициллин 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 кормление грудью при необходимости назначения препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении Бициллина-1 с НПВС (индометацином, фенилбутазоном, салицилатами), аллопуринолом, пробенецидом следует иметь в виду возможность конкурентного ингибирования выведения препаратов из организма.

При одновременном применении с Бициллином-1 бактерицидных антибиотиков (в т.ч. цефалоспоринов, циклосерина, ванкомицина, рифампицина, аминогликозидов) отмечается синергизм действия; бактериостатических антибиотиков (в т.ч. макролидов, хлорамфеникола, линкозамидов, тетрациклинов) - антагонизм действия.

Бициллин-1 повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (подавляя кишечную микрофлору, снижает протромбиновый индекс).

Бициллин-1 снижает эффективность пероральных контрацептивов и лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется парааминобензойная кислота.

При одновременном применении Бициллина-1 с этинилэстрадиолом возрастает риск развития прорывных кровотечений.

При одновременном применении Бициллина-1 и аллопуринола повышается риск развития аллергических реакций (кожной сыпи).

Особые указания и меры предосторожности:

При появлении любых аллергических реакций необходимо прекратить введение препарата и назначить соответствующее лечение. Могут наблюдаться тяжелые и иногда фатальные аллергические реакции вплоть до развития анафилактического шока.

При сборе анамнеза следует обращать внимание на переносимость проводимого ранее лечения пенициллинами. При указаниях в анамнезе на аллергию на пенициллин препарат категорически противопоказан. 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 назначение пенициллинов.

Нельзя вводить препарат п/к, в/в, эндолюмбально, а также в полости тела. При случайном внутрисосудистом введении могут отмечаться преходящее чувство тревоги и нарушения зрения (синдром Уанье). Для того, чтобы избежать случайного внутрисосудистого введения препарата, рекомендуется перед проведением в/м инъекции произвести аспирацию с целью выявления возможного попадания иглы в сосуд.

При лечении венерических заболеваний, если имеется подозрение на сифилис, перед началом терапии и затем в течение 4 мес необходимо проведение микроскопических и серологических исследований.

В связи с возможностью развития грибковых поражений целесообразно при лечении препаратом назначать витамины группы В и витамин С, а при необходимости - нистатин и леворин.

Необходимо учитывать, что применение препарата в недостаточных дозах или слишком раннее прекращение лечения часто приводит к появлению резистентных штаммов возбудителей.

При нарушениях функции почек

При **почечной недостаточности** дозы снижаются в соответствии с КК: при **КК от 10 до 50 мл/мин** вводят 75% от суточной дозы препарата, при **КК менее 10 мл/мин** вводят 25-50% от суточной дозы препарата.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, прохладном месте при температуре не выше 15°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Bicillin-1