

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування лікарського засобу

БІЦИЛІН®-3 (BICILLIN®-3)

Склад:

діюча речовина:

1 флакон містить: біцилін-3, порошок 600000 ОД (суміш бензатину бензилпеніциліну стерильного (біциліну-1) 200000 ОД, бензилпеніциліну натрієвої солі стерильної 200000 ОД, бензилпеніциліну новокаїнової солі стерильної 200000 ОД).

Лікарська форма. Порошок для суспензії для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: порошок білого або білого зі злегка жовтуватим відтінком кольору.

Фармакотерапевтична група.

Антибактеріальні лікарські засоби для системного застосування. Комбінації пеніцилінів, чутливих до дії β-лактамаз. Код АТХ J01C E30.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Препарат проявляє бактерицидну дію шляхом інгібування синтезу мукопептидів клітинної оболонки мікроорганізмів. Активний відносно грампозитивних мікроорганізмів: *Staphylococcus* spp. (крім тих, що продукують пеніциліназу), *Streptococcus* spp. (у т.ч. *Streptococcus pneumoniae*), *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*; грамнегативні: *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Actinomyces israelii*, а також *Treponema* spp., анаеробних, що утворюють спори. До дії препарату стійкі більшість грамнегативних бактерій, мікобактерії, гриби, віруси, найпростіші.

Фармакокінетика.

Біцилін – форма бензилпеніциліну пролонгованої дії. При внутрішньом'язовому введенні препарат утворює депо у м'язовій тканині. У перші години після ін'єкції утворюється високий рівень бензилпеніциліну у крові. Біцилін добре розподіляється у тканинах і рідинах організму. Препарат виявляється у високих концентраціях у печінці, нирках, легенях, слизових оболонках, має здатність проникати у фібринозні тканини. Біцилін переважно виводиться із сечею у біологічно активній формі (50-70 %), у незначних кількостях – зі слиною, потом, молоком, жовчю.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування інфекцій, спричинених чутливими до препарату мікроорганізмами, у випадках, коли необхідне тривале підтримання постійної концентрації лікарського засобу в крові:

- *інфекції дихальних шляхів і ЛОР-органів:* стрептококові фарингіти і тонзиліти;
- *інфекції сечостатевої системи:* сифіліс;
- бешіха;
- загострення ревматизму.

Протипоказання.

Гіперчутливість до β-лактамних антибіотиків (пеніцилінів, цефалоспоринів, карбапенемів), новокаїну;

Бронхіальна астма, кропив'янка, сінна гарячка та тяжкі алергічні реакції.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні з бактерицидними антибіотиками (у т.ч. цефалоспоринами, циклосерином, ванкоміцином, рифампіцином, аміноглікозидами) відзначається синергізм дії; з бактеріостатичними антибіотиками (у т.ч. макролідами, хлорамфеніколом, лінкозамідами, тетрацикліном) – антагонізм.

Біцилін®-3 знижує ефективність пероральних контрацептивів і етинілестрадіолу (ризик розвитку проривних кровотеч). Не рекомендується поєднувати з нестероїдними протизапальними засобами. Бензилпеніцилін знижує кліренс і збільшує токсичність метотрексату.

При одночасному застосуванні з алопуринолом підвищується ризик розвитку алергічних реакцій.

Фармакокінетична взаємодія. При одночасному застосуванні діуретики, алопуринол, фенілбутазон, НПВС знижують канальцеву секрецію і підвищують концентрацію пеніциліну. Слід мати на увазі можливість конкурентного інгібування процесу виведення з організму при одночасному застосуванні бензилпеніциліну з протизапальними і жарознижувальними засобами (індометацином, фенілбутазоном, саліцилатами у високих дозах). Аспірин, пробенецид, тіазидні діуретики, фуросемід, етакринова кислота збільшують період напіввиведення бензилпеніциліну, підвищуючи його концентрацію у плазмі крові, внаслідок чого зростає ризик розвитку його токсичної дії шляхом впливу на канальцеву секрецію нирок. Алопуринол підвищує ризик розвитку алергічних реакцій (шкірний висип).

Уникати одночасного застосування з хлорамфеніколом, еритроміїном, тетрацикліном, сульфаніламидами.

При одночасному застосуванні з метотрексатом зменшується екскреція останнього та збільшується ризик його токсичності.

Пеніциліни можуть спотворювати діагностичні тести, наприклад, визначення глюкози в сечі за допомогою мідного купоросу, прямий антиглобулінової тест (тест Кумбса), деякі тести для визначення сироваткових білків або білку у сечі. Пеніциліни також можуть спотворювати результати тестів, в яких використовуються бактерії, наприклад, тест Гатрі на фенілкетонурію, в якому використовуються мікроорганізми *Bacillus subtilis*.

Особливості застосування.

Перед початком лікування Біциліном®-3, слід перевірити пацієнта на переносимість препарату і зробити пробу на переносимість місцевих анестетиків. Необхідно з'ясувати, чи не відзначались реакції на препарати групи (β-лактамних та/або новокаїну) при їх попередньому застосуванні. Пацієнтам, схильним до алергічних реакцій, препарат призначати з обережністю. При появі ознак алергічних реакцій Біцилін®-3 слід відмінити та призначити відповідну терапію.

З метою запобігання виникнення побічних реакцій слід дотримуватись тільки внутрішньом'язового введення препарату.

У хворих з відомою гіперчутливістю до цефалоспоринів слід брати до уваги можливість перехресної алергії.

Тяжкі і іноді летальні випадки гіперчутливості (анафілактична реакція) спостерігалися у хворих, які перебували на пеніциліновій терапії. Такі реакції виникають частіше у пацієнтів з відомими тяжкими алергічними реакціями в анамнезі.

Для лікування симптомів анафілактичної реакції може бути необхідним: негайне введення адреналіну, стероїдів (внутрішньовенно) та невідкладна терапія дихальної недостатності.

З особливою обережністю слід застосовувати препарат пацієнтам із сінною гарячкою, кропив'янкою та іншими алергічними захворюваннями.

Нейтропенія була широко поширена у пацієнтів, які отримували високі дози β-лактамів і захворюваність була відзначена у пацієнтів, які отримували лікування протягом 10 днів і більше. Моніторинг лейкоцитів рекомендується проводити протягом тривалого часу при лікуванні високими дозами.

Препарат не рекомендується застосовувати для лікування хворих із гострим лімфолейкозом або інфекційним мононуклеозом у зв'язку з підвищеним ризиком еритематозних висипань на

шкірі. Слід мати на увазі, що у хворих з цукровим діабетом може бути знижене всмоктування діючої речовини з внутрішньом'язового депо.

При тяжких розладах функції нирок великі дози пеніциліну внаслідок нейротоксичної дії можуть спричинити церебральні порушення, судоми, кому.

Слід дотримуватися обережності при застосуванні препарату у пацієнтів з тяжкою кардіопатією, гіповолемією, епілепсією, порушенням функції нирок або печінки. Печінковий, нирковий та гематологічний статус повинні контролюватися в ході тривалої терапії високими дозами.

Тривале застосування препарату може призводити до розвитку колонізації стійких мікроорганізмів або дріжджів. Можливе виникнення суперінфекції, що потребує ретельного спостереження за такими пацієнтами.

При виникненні тяжкої діареї, характерної для псевдомембранозного коліту (у більшості випадків спричиненого *Clostridium difficile*), рекомендується зупинити застосування препарату і вжити відповідних заходів. Застосування засобів, які пригнічують перистальтику, протипоказано. При лікуванні венеричних захворювань з підозрою на сифіліс перед початком терапії та протягом 4 місяців після її завершення необхідно провести серологічне дослідження. Для пригнічення або полегшення реакції Яриша-Герксгеймера при першому застосуванні препарату рекомендується вводити 50 мг преднізолону або його еквівалент.

У хворих на сифіліс у стадії, що виявляється ураженням серцево-судинної системи, кровоносних судин і мозкових оболонок, реакції Яриша-Герксгеймера можна уникнути шляхом застосування преднізолону по 50 мг на добу або еквівалентного стероїду протягом 1-2 тижнів. Свіжоприготовлені розчини для ін'єкцій або інфузій необхідно використовувати негайно. Навіть при зберіганні у холодильнику водні розчини натрієвої солі бензилпеніциліну розпадаються з утворенням продуктів розпаду та метаболітів.

Слід уникати контакту шкіри з пеніцилінами, оскільки може виникнути сенсибілізація.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Протипоказано.

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

Рекомендується утримуватися від діяльності, що вимагає швидкості психомоторних реакцій (управління транспортом, робота з потенційно небезпечними механізмами), враховуючи можливі небажані реакції з боку нервової системи (запаморочення, головний біль, шум у вухах).

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначати тільки дорослим!

Перед введенням необхідно зібрати у пацієнта анамнез переносимості препарату та місцевого анестетика та провести попередню внутрішньошкірну пробу на переносимість препарату та пробу на переносимість місцевого анестетика!

Біцилін®-3 вводити тільки внутрішньом'язово! Внутрішньовенне введення препарату заборонено!

Препарат дорослим у дозі 600000 ОД вводити 1 раз у 6 днів. Зазвичай тривалість лікування становить від 3 до 12 місяців залежно від тяжкості захворювання.

Правила приготування і введення суспензії. Суспензію готувати асептично, безпосередньо перед застосуванням. У флакон додати 5-6 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або стерильної води для ін'єкцій, або 0,25-0,5 % розчину новокаїну, перемішати до утворення гомогенної суспензії та вводити глибоко внутрішньом'язово у верхній зовнішній квадрант сідничного м'яза (2 ін'єкції робити у різні сідниці).

Перед введенням суспензії Біциліну®-3 необхідно переконатися, що голка не потрапила у кровоносну судину. Якщо з'являється кров, голку необхідно витягнути і ін'єкцію провести в інше місце.

Діти.

Ефективність та безпеку щодо застосування лікарського засобу дітям не досліджували.

Передозування.

Можлива токсична дія на центральну нервову систему, а саме: рефлекторне збудження, головний біль, нудота, блювання, судоми, міальгія, артралгія, симптоми менінгізму, кома. У таких випадках введення препарату слід припинити.

Лікування: симптоматичне, яке включає гемодіаліз, перитонеальний діаліз, особливу увагу слід приділяти відновленню водно-електролітного балансу.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, включаючи шкірні висипання, свербіж, пропасницю, озноб, артралгію, набряки, кропив'янку, мультиформну ексудативну еритему, ексфолюативний дерматит, контактний дерматит; анафілактичні або анафілактоїдні реакції, включаючи бронхіальну астму, тромбоцитопенічну пурпуру, симптоми з боку шлунково-кишкового тракту, ангіоневротичний набряк Квінке, анафілактичний шок, що може мати летальний наслідок у разі несвоєчасного та неякісного надання медичної допомоги; сироваткова хвороба, можливі реакції у місці введення.

З боку органів дихання: бронхоспазм, ларингоспазм.

З боку центральної та периферичної нервової системи: запаморочення, головний біль, шум у вухах.

З боку травного тракту: нудота, блювання, стоматит, глосит, забарвлення язика в чорний колір, діарея, псевдомембранозний коліт, гепатит, застій жовчі.

З боку сечостатевої системи: інтерстиціальний нефрит.

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

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

Місцеві реакції: можливі реакції в місці введення, включаючи біль.

Інші: в ослаблених хворих, новонароджених, осіб літнього віку при тривалому лікуванні може виникнути суперінфекція, спричинена стійкою до препарату мікрофлорою (дріжджоподібні гриби, грамнегативні мікроорганізми). У пацієнтів, які проходять курс лікування з приводу сифілісу, може також виникати реакція Яриша-Герксгеймера вторинно до бактеріолізу, для якої характерні наступні симптоми: підвищення температури тіла, озноб, міальгія, головний біль, загострення шкірних симптомів, тахікардія, вазодилатація зі зміною артеріального тиску. Реакція може бути небезпечною при серцево-судинному сифілісі або станах, при яких існує серйозний ризик підвищеного локального пошкодження, наприклад, атрофія зорового нерва.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Не слід змішувати суспензію Біциліну®-3 з іншими ін'єкційними розчинами. Не рекомендується застосовувати як розчинник розчин Рінгера або інші натрійвмісні розчини, які містять глюкозу.

Препарат несумісний з іонами металів та симпатоміметичними амінами.

Упаковка.

По 600000 ОД у флаконах.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник/заявник. ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.