

УТВЕРЖЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
19.08.15 № 527
Регистрационное
удостоверение
№ UA/3883/01/01

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

БИЦИЛЛИН®-3
(BICILLIN®-3)

Состав:

действующее вещество: бициллин-3, порошок 600000 ЕД (смесь бензатина бензилпенициллина стерильного (бициллина-1) 200000 ЕД, бензилпенициллина натриевой соли стерильной 200000 ЕД, бензилпенициллина новокаиновой соли стерильной 200000 ЕД).

Лекарственная форма. Порошок для приготовления суспензии для инъекций.

Основные физико-химические свойства: порошок белого или белого со слегка желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа.

Антибактериальные лекарственные средства для системного применения. Комбинации пенициллинов, чувствительных к действию β-лактамаз. Код АТХ J01C E30.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Препарат оказывает бактерицидное действие путем ингибирования синтеза мукопептидов клеточной оболочки микроорганизмов. Активный в отношении грамположительных микроорганизмов: *Staphylococcus* spp. (кроме тех, которые продуцируют пенициллиназу), *Streptococcus* spp. (в т.ч. *Streptococcus pneumoniae*), *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*; грамотрицательные: *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Actinomyces israelii*, а также *Treponema* spp., анаэробных, которые образуют споры. К действию препарата устойчивы большинство грамотрицательных бактерий, микобактерии, грибы, вирусы, простейшие.

Фармакокинетика.

Бициллин – форма бензилпенициллина пролонгированного действия. При внутримышечном введении препарат образует депо в мышечной ткани. В первые часы после инъекции образуется высокий уровень бензилпенициллина в крови. Бициллин хорошо распределяется в тканях и жидкостях организма. Препарат обнаруживается в высоких концентрациях в печени, почках, легких, слизистых оболочках, имеет способность проникать в фибриновые ткани. Бициллин преимущественно выводится с мочой в биологически активной форме (50-70 %), в незначительных количествах – со слюной, потом, молоком, желчью.

Клинические характеристики.

Показания.

Лечение инфекций, вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами, в случаях, когда необходима длительная поддержка постоянной концентрации лекарственного средства в крови:

- *инфекции дыхательных путей и ЛОР-органов:* стрептококковые фарингиты и тонзиллиты;

- инфекции мочеполовой системы: сифилис;
- рожистое воспаление;
- обострение ревматизма.

Противопоказания.

Гиперчувствительность к β -лактамным антибиотикам (пенициллинам, цефалоспорином, карбапенемам) и новокаину;

Бронхиальная астма, крапивница, сенная горячка, и тяжелые аллергические реакции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При одновременном применении с бактерицидными антибиотиками (в т.ч. цефалоспорином, циклосерином, ванкомицином, рифампицином, аминогликозидами) отмечается синергизм действия; с бактериостатическими антибиотиками (в т.ч. макролидами, хлорамфениколом, линкозамидами, тетрациклином) – антагонизм.

Бициллин®-3 снижает эффективность пероральных контрацептивов и этинилэстрадиола (риск развития прорывных кровотечений). Не рекомендуется сочетать с нестероидными противовоспалительными средствами. Бензилпенициллин понижает клиренс и увеличивает токсичность метотрексата.

При одновременном применении с аллопурином повышается риск развития аллергических реакций.

Фармакокинетическое взаимодействие. При одновременном применении диуретики, аллопуринол, фенилбутазон, НПВС снижают канальцевую секрецию и повышают концентрацию пенициллина.

Следует иметь в виду возможность конкурентного ингибирования процесса выведения из организма при одновременном применении бензилпенициллина с противовоспалительными, противоревматическими и жаропонижающими средствами (индометацином, фенилбутазоном, салицилатами в высоких дозах). Аспирин, пробенецид, тиазидные диуретики, фуросемид, этакриновая кислота увеличивают период полувыведения бензилпенициллина, повышая его концентрацию в плазме крови, вследствие чего возрастает риск развития его токсического действия путем влияния на канальцевую секрецию почек. Аллопуринол повышает риск развития аллергических реакций (кожная сыпь).

Избегать одновременного применения с хлорамфениколом, эритромиуином, тетрациклином, сульфониламидами.

При одновременном применении с метотрексатом уменьшается экскреция последнего и увеличивается риск его токсичности.

Пенициллины могут искажать диагностические тесты, например, определение глюкозы в моче с помощью медного купороса, прямой антиглобулиновый тест (тест Кумбса), некоторые тесты для определения сывороточных белков или белка в моче. Пенициллины также могут искажать результаты тестов, в которых используются бактерии, например, тест Гатри на фенилкетонурию, в котором используются микроорганизмы *Bacillus subtilis*.

Особенности применения.

Перед началом лечения Бициллином®-3 следует проверить пациента на переносимость препарата, и сделать пробу на переносимость местных анестетиков. Необходимо выяснить, не отмечались ли реакции на препараты группы (β -лактамных и/или новокаина) при их предыдущем применении. Пациентам, склонным к аллергическим реакциям, препарат назначать с осторожностью. При появлении признаков аллергических реакций Бициллин®-3 следует отменить и назначить соответствующую терапию.

С целью предотвращения возникновения побочных реакций следует соблюдать только внутримышечное введение препарата.

У больных с известной гиперчувствительностью к цефалоспорином следует принимать во внимание возможность перекрестной аллергии.

Тяжелые и иногда летальные случаи гиперчувствительности (анафилактическая реакция) наблюдались у больных, которые находились на пенициллиновой терапии. Такие реакции возникают чаще у пациентов с известными тяжелыми аллергическими реакциями в анамнезе. Для лечения симптомов анафилактической реакции может быть необходимым: немедленное введение адреналина, стероидов (внутривенно) и неотложная терапия дыхательной недостаточности.

С особой осторожностью следует применять препарат пациентам с сенной горячкой, крапивницей и другими аллергическими заболеваниями.

Нейтропения была широко распространена у пациентов, получавших высокие дозы β -лактамов и заболеваемость была отмечена у пациентов, получавших лечение в течение 10 дней и более. Мониторинг лейкоцитов рекомендуется проводить на протяжении длительного времени при лечении высокими дозами.

Препарат не рекомендуется применять для лечения больных с острым лимфобластозом или инфекционным мононуклеозом в связи с повышенным риском эритематозных высыпаний на коже. Следует иметь в виду, что у больных с сахарным диабетом может быть сниженное всасывание действующего вещества из внутримышечного депо.

При тяжелых расстройствах функции почек большие дозы пенициллина вследствие нейротоксического действия могут вызвать церебральные нарушения, судороги, кому.

Следует придерживаться осторожности при применении препарата пациентам с тяжелой кардиопатией, гиповолемией, эпилепсией, нарушением функции почек или печени. Печеночный, почечный и гематологический статус должны контролироваться в ходе длительной терапии высокими дозами.

Длительное применение препарата может приводить к развитию колонизации стойких микроорганизмов или дрожжей. Возможно возникновение суперинфекции, что требует тщательного наблюдения за такими пациентами.

При возникновении тяжелой диареи, характерной для псевдомембранозного колита (в большинстве случаев вызванного *Clostridium difficile*), рекомендуется остановить применение препарата и принять соответствующие меры. Применение средств, которые угнетают перистальтику, противопоказано. При лечении венерических заболеваний с подозрением на сифилис перед началом терапии и на протяжении 4 месяцев после ее завершения необходимо провести серологическое исследование.

Для подавления или облегчения реакции Яриша-Герксгеймера при первом применении препарата рекомендуется вводить 50 мг преднизолона или его эквивалент.

У больных на сифилис в стадии, проявляющейся поражением сердечно-сосудистой системы, кровеносных сосудов и мозговых оболочек, реакции Яриша-Герксгеймера можно избежать путем применения преднизолона по 50 мг в сутки или эквивалентного стероида на протяжении 1-2 недель. Свежеприготовленные растворы для инъекций или инфузий необходимо использовать немедленно. Даже при хранении в холодильнике водные растворы натриевой соли бензилпенициллина распадаются с образованием продуктов распада и метаболитов.

Следует избегать контакта кожи с пенициллинами, поскольку может возникнуть сенсибилизация.

Применение в период беременности и кормления грудью.

Противопоказано.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Рекомендуется воздерживаться от деятельности, которая требует скорости психомоторных реакций (управление транспортом, работа с потенциально опасными механизмами), включая возможные нежелательные реакции со стороны нервной системы (головокружение, головная боль, шум в ушах).

Способ применения и дозы.

Препарат назначать только взрослым!

Перед введением необходимо собрать у пациента анамнез переносимости препарата и местного анестетика и провести предварительную внутрикожную пробу на переносимость препарата и пробу на переносимость анестетика!

Бициллин®-3 вводить только внутримышечно! Внутривенное введение препарата запрещено!

Препарат взрослым в дозе 600000 ЕД вводить 1 раз в 6 дней. Обычно длительность лечения составляет от 3 до 12 месяцев в зависимости от тяжести заболевания.

Правила приготовления и введения суспензии. Суспензию готовить асептически, непосредственно перед применением. Во флакон добавить 5-6 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или стерильной воды для инъекций, или 0,25-0,5 % раствора новокаина, перемешать до образования равномерной суспензии и вводить глубоко внутримышечно в верхний внешний квадрант ягодичной мышцы (2 инъекции делать в разные ягодичи).

Перед введением суспензии Бициллина®-3 необходимо убедиться, что игла не попала в кровеносный сосуд. Если появляется кровь, иглу необходимо вытянуть и инъекцию провести в другое место.

Дети.

Эффективность и безопасность применения лекарственного средства детям не исследовали.

Передозировка.

Возможно токсическое действие на центральную нервную систему, а именно: рефлекторное возбуждение, головная боль, тошнота, рвота, судороги, миалгия, артралгия, симптомы менингизма, кома. В таких случаях введение препарата следует прекратить.

Лечение: симптоматическое, которое включает гемодиализ, перитонеальный диализ, особое внимание следует уделить восстановлению водно-электролитного баланса.

Побочные реакции.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая кожные высыпания, зуд, лихорадку, озноб, артралгию, отеки, крапивницу, мультиформную экссудативную эритему, эксфолиативный дерматит, контактный дерматит; анафилактические или анафлактоидные реакции, включая бронхиальную астму, тромбоцитопеническую пурпуру, симптомы со стороны желудочно-кишечного тракта, ангионевротический отек Квинке, анафилактический шок, который может иметь летальный исход в случае несвоевременного и некачественного оказания медицинской помощи; сывороточная болезнь, возможны реакции в месте введения.

Со стороны органов дыхания: бронхоспазм, ларингоспазм.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, шум в ушах.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, стоматит, глоссит, окраска языка в черный цвет, диарея, псевдомембранозный колит, гепатит, застой желчи.

Со стороны мочеполовой системы: интерстициальный нефрит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: колебания артериального давления, нарушение насосной функции миокарда, тахикардия.

Со стороны крови и лимфатической системы: эозинофилия, положительные результаты теста Кумбса, гемолитическая анемия, лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Местные реакции: возможны реакции в месте введения, включая боль.

Другие: у ослабленных больных, новорожденных, лиц пожилого возраста при длительном лечении может возникнуть суперинфекция, вызванная устойчивой к препарату микрофлорой (дрожжеподобные грибы, грамотрицательные микроорганизмы). У пациентов, которые проходят курс лечения по поводу сифилиса, может также возникать реакция Яриша-Герксгеймера вторично к бактериолизу, для которой характерны следующие

симптомы: повышение температуры тела, озноб, миалгия, головная боль, обострение кожных симптомов, тахикардия, вазодилатация с изменением артериального давления. Реакция может быть опасной при сердечно-сосудистом сифилисе или состояниях, при которых существует серьезный риск повышенного локального повреждения, например, атрофия зрительного нерва.

Срок годности. 4 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость. Не следует смешивать суспензию Бициллина®-3 с другими инъекционными растворами.

Не рекомендуется применять в качестве растворителя раствор Рингера или другие натрийсодержащие растворы, которые содержат глюкозу.

Препарат несовместим с ионами металлов и симпатомиметическими аминами.

Упаковка.

По 600000 ЕД во флаконах.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель/заявитель. ПАО «Киевмедпрепарат».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

Дата последнего пересмотра.