

**ІНСТРУКЦІЯ**
**ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ  
ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ**
**ЗАТВЕРДЖЕНО**
*Наказ Міністерства охорони здоров'я України*
*01.09.2015 №554*
*Реєстраційне посвідчення*
*№UA/3883/01/02*
**ЗМІНИ ВНЕСЕНО**
*Наказ Міністерства охорони здоров'я України*
*09.03.2017 №247*
**Склад:**
*діюча речовина:*

1 флакон містить: біцилін-5, порошок 1500000 ОД (суміш бензатину бензилпеніциліну стерильного (біцилін-1) – 1200000 ОД, бензилпеніциліну новокаїнової солі стерильної – 300000 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.**
*Фармакокінетика.*

Препарат проявляє бактерицидну дію шляхом інгібування синтезу мукопептидів клітинної оболонки мікроорганізмів. Активний відносно грампозитивних мікроорганізмів: *Staphylococcus* spp. (крім тих, які продукують пеніциліназу), *Streptococcus* spp. (у т.ч. *Streptococcus pneumoniae*), *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*; грамнегативних: *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.*

Препарат проявляє пролонговану дію. При внутрішньом'язовому введенні утворюється депо препарату у м'язовій тканині. Високий рівень концентрації препарату утворюється вже у перші години після ін'єкції, терапевтична концентрація бензилпеніциліну зберігається у крові протягом 28 днів та більше у переважній більшості хворих (дітей та дорослих). З організму виводиться переважно нирками, незначна кількість препарату виділяється з мокротинням, потом, слиною, слізною рідиною, проникає у грудне молоко.

**Клінічні характеристики.**
**Показання.**

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

Застосування Біциліну®-5 особливо показано для цілорічної профілактики рецидивів ревматизму у дорослих і дітей.

**Противоказання.**

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 (в т.ч. цефалоспоринами, цикloserином, ванкоміцином, рифампіцином, аміноглікозидами) відзначається синергізм дії; з бактеріостатичними антибіотиками (в т.ч. макролідами, хлорамфеніолом, лінкозамідом, тетрациклом) – антагонізм.

Біцилін®-5 знижує ефективність пероральних контр-

**BICILLIN®-5  
БІЦИЛІН®-5**

ацептивів 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, НПЗЗ знижують канальцеву секрецію і підвищують концентрацію пеніциліну.

Слід мати на увазі можливість конкурентного інгібування процесу виведення з організму при одночасному застосуванні бензилпеніциліна 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 підвищується ризик розвитку його токсичної дії шляхом впливу на канальцеву секрецію нирок. Алопуринол підвищує ризик розвитку алергічних реакцій (шкірний висип). Уникати одночасного застосування з хлорамфеніолом, еритроміїном, тетрациклом, сульфаніламидами.

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

Пеніциліни можуть спотворювати діагностичні тести, наприклад, визначення глюкози в сечі за допомогою мідного купоросу, прямий антиглобуліновий 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 фенілкетонурию, в якому використовуються мікроорганізми *Bacillus subtilis*.

**Особливості застосування.**

Необхідно з'ясувати, чи не відзначалися 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®-5 слід відмінити і призначити відповідну терапію.

З метою запобігання виникнення побічних реакцій слід дотримуватися 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 пацієнтам 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 в холодильнику водні розчини натрієвої солі бензилпеніциліну розпадаються з утворенням продуктів розпаду та метаболітів.

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

*Застосування у період вагітності або годування груддю.*

Дані про застосування лікарського засобу Біциліну®-5 відсутні.

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

На даний момент повідомлень немає, але слід мати на увазі можливість виникнення побічних реакцій з боку центральної нервової та серцево-судинної системи.

### **Спосіб застосування та дози.**

*Перед введенням необхідно зібрати у пацієнта анамнез переносимості препарату та місцевого анестетика!*

***Біциліну®-5 вводить тільки внутрішньом'язово! Внутрішньовенне введення препарату заборонено!***

Дітям віком від 3 до 8 років Біциліну®-5 вводити одноразово у дозі 600000 ОД 1 раз у 3 тижні.

Дітям віком від 8 років – у дозі 1200000 ОД 1 раз у 4 тижні.

Дорослим вводити одноразово у дозі 1500000 ОД 1 раз у 4 тижні.

Частіше робити ін'єкції Біциліну®-5 протипоказано. Зазвичай тривалість лікування залежить від тяжкості захворювання та становить від 3 до 12 місяців.

***Правила приготування і введення суспензії.*** Суспензію Біциліну®-5 готувати асептично, безпосередньо перед застосуванням. У флакон з препаратом під тиском вводити 9 мл стерильної води для ін'єкцій або 0,9 % розчину натрію хлориду або 0,25-0,5 % розчину новокаїну. Вміст флакона перемішувати до утворення гомогенної суспензії. Суспензію вводити глибоко внутрішньом'язово у верхній зовнішній квадрант сідничного м'яза (2 ін'єкції робити у різні сідниці).

Перед введенням суспензії Біциліну®-5 необхідно переконатися, що голка не потрапила у кровоносну судину. Якщо з'являється кров, голку необхідно витягнути і ін'єкцію провести в інше місце.

### **Діти.**

Препарат призначати дітям віком від 3 років. При введенні Біциліну®-5 дітям протипоказане приготування суспензії Біциліну®-5 із застосуванням розчину новокаїну.

### **Передозування.**

Проявляється токсичною дією на центральну нервову систему: рефлекторне збудження, головний біль, нудота, блювання, судоми, міалгія, артралгія, симптоми менінгізму, кома. У таких випадках введення препарату слід припинити.

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

### **Побічні реакції.**

***З боку імунної системи:*** шкірний висип, свербіж, набряк, ексфолювативний дерматит, мультиформна ексудативна еритема, гарячка, артралгія, кропив'янка, контактний дерматит, анафілактичні або анафілактоїдні реакції, включаючи бронхіальну астму; тромбоцитопенічна пурпура, 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 і периферичної нервової системи:*** запаморочення, шум у вухах, головний біль.

***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:*** порушення насосної функції міокарда, коливання артеріального тиску, тахікардія.

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

***Місцеві реакції:*** можлива болісність у місці введення.

***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, міалгія, 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.*** В оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

***Несумісність.*** Не слід змішувати розчин Біциліну®-5 з іншими ін'єкційними розчинами.

***Упаковка.*** По 1500000 ОД у флаконах.

***Категорія відпуску.*** За рецептом.

***Виробник.*** ПАТ «Київмедпрепарат».

***Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.***

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

***Дата останнього перегляду.*** 09.03.2017 р.