

**БЕНЗИЛПЕНІЦИЛІН**  
**(порошок для розчину для ін'єкцій)**  
листівка-вкладка

**Опис**

Кристалічний порошок білого або майже білого кольору.

**Склад**

1 флакон містить діючу речовину:

бензилпеніциліну натрієвої солі стерильної – 1 000 000 ОД.

**Фармакологічні властивості**

АТС vet класифікаційний код QJ01 – антибактеріальні ветеринарні препарати для системного застосування. QJ01CE01 – Бензилпеніцилін.

**Бензилпеніцилін** є бактерицидним  $\beta$ -лактамним антибіотиком, що належить до групи пеніцилінів. **Бензилпеніцилін** перешкоджає утворенню мукопептидних зв'язків за рахунок інгібування транспептидази, порушує пізні етапи синтезу пептидоглікану клітинної оболонки, що призводить до лізису клітин, що діляться. **Бензилпеніцилін** активний по відношенню до грампозитивних бактерій, таких як *Streptococcus spp.*, *Staphylococcus spp.*, *Bacillus spp.* (меншою мірою по відношенню до *Enterococcus spp.*), лістерій (*L. monocytogenes*), ерізіпілотрикс (*E. rhusiopathie*), більшості коринебактерій, більшості анаеробних бактерій (*Peptostreptococcus spp.*, *Clostridium spp.*), спірохет (*Treponema spp.*, *Borrelia spp.*, *Leptospira spp.*), актиноміцетів.

Ентеробактерії, бруцели, мікобактерії, найпростіші, віруси, гриби і рикетсії не чутливі до дії **бензилпеніциліну** у зв'язку з тим, що ці мікроорганізми здатні виробляти специфічний фермент пеніцилазу, яка руйнує  $\beta$ -лактамне кільце в молекулі пеніцилінів, внаслідок чого вони втрачають антимикробну активність.

З грамнегативних бактерій до **бензилпеніциліну** чутливі *Neisseria spp.*, *P. multocida*, *H. dugreyi*.

Набута резистентність до пеніцилінів найбільш часто зустрічається серед стафілококів.

Бензилпеніцилін у значній мірі руйнується під впливом соляної кислоти шлункового соку, тому застосовується тільки парентерально. Для більшості чутливих мікроорганізмів за терапевтичну концентрацію бензилпеніциліну приймають 0,1-0,2 ОД/мл. Мінімальна інгібуюча концентрація **бензилпеніциліну** для найбільш чутливих мікроорганізмів становить 0,001-0,05 ОД/мл.

При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація бензилпеніциліну спостерігається через 30-60 хвилин. Терапевтичні концентрації **бензилпеніциліну** спостерігаються в організмі протягом 3-4 годин.

При внутрішньовенному та внутрішньоартеріальному введенні в перші хвилини спостерігаються в крові дуже високі концентрації **бензилпеніциліну** з швидким їх зниженням в наступні 30-45 хвилин.

При підшкірному введенні максимальна концентрація бензилпеніциліну в крові відмічається через 60 хвилин. Концентрація антибіотика в крові залежить від введеної дози.

Пеніциліни погано проникають крізь непошкоджені гістогематичні бар'єри (гематоенцефалічний, плацентарний, офтальмічний), передміхурову залозу.

Препарат зв'язується з білками крові на 59 %. Пеніциліни утворюють з білками крові легкодисоційовані комплекси. У процесі зв'язування **бензилпеніциліну** зайняті альбуміни. Інтенсивність утворення комплексів **бензилпеніциліну** з білками не залежить від концентрації антибіотика, поки вона не перевищує 200 мкг/мл сироватки.

Після всмоктування у кров терапевтичних концентрацій (0,1-0,2 ОД/мл) **бензилпеніцилін** у високих дозах виявляють у печінці, нирках і легенях, однак він погано проникає у міокард, мозок, кістки, синовіальну та спинномозкову рідину.

Існує зворотній зв'язок між інтенсивністю обміну речовин в організмі та кількісним вмістом пеніциліну в крові. Чим вищий рівень обміну речовин, тим нижча концентрація, і менший час вона тримається на терапевтичному рівні при введенні однакових доз.

Грунтуючись на цих принципах, дозу бензилпеніциліну змінюють прямо пропорційно рівню обміну речовин. В межах кожного виду тварин доза також змінюється: для молодих тварин доза вища, ніж для дорослих.

За прогресування патологічних процесів в організмі проникнення **бензилпеніциліну** через гістогематичні бар'єри зростає, внаслідок чого концентрація антибіотика в уражених органах досягає концентрації його в крові або навіть перевищує її. Зі збільшенням дози бензилпеніциліну його вміст у крові та в інших органах збільшується, посилюється і проникнення їх через фізіологічні бар'єри. Найбільша його концентрація відмічається в фазу гострого перебігу захворювання, а хронічного – перебіг вміст антибіотика в хворому організмі зменшується.

Із організму бензилпеніцилін швидко виводиться нирками у незміненому вигляді ( $T_{1/2}$  – 0,5 години, при порушенні функції печінки та нирок – до 16–30 годин).

Бензилпеніцилін із організму виводиться, головним чином, з сечею (60–90 %) та частково з жовчю (1–8 %). Деяка кількість (9–32 %) руйнується шлунковим соком і пеніциліназою (ферментом), що продукується мікрофлорою кишечника. В незначних кількостях бензилпеніцилін також екскретується зі слиною та молоком.

При порушенні функції нирок може тривало циркулювати в організмі.

Швидкість виділення бензилпеніциліну залежить від виду і від стану тварини – прискорюється при підвищеній температурі тіла.

### **Застосування**

Лікування собак, хворих на піодермію, баланопостит, гнійний отит, гнійний пододерматит, atopічний дерматит, гнійний риніт, цистит, уроцистит, кон'юнктивіт, ендометрит, при гнійних ранах, а також за інших інфекційних захворюваннях та інфекційно-запальних процесах, що спричинені мікроорганізмами, чутливими до бензилпеніциліну.

### **Дозування**

Розчин натрієвої солі бензилпеніциліну готують безпосередньо перед його застосуванням.

Вміст флакону розчиняють у 1-3 мл стерильної води для ін'єкцій або ізотонічного розчину натрію хлориду, або 0,5 % розчину новокаїну.

Препарат вводять внутрішньом'язово з інтервалом 4-6 годин у дозах.

<b>Разова лікувальна доза (тис. ОД на 1 кг маси тіла тварини)</b>	
<b>Дорослі тварини</b>	<b>Молодняк</b>
10	20

### **Протипоказання**

Підвищена чутливість до препаратів групи пеніциліну або новокаїну в разі використання його розчину в якості розчинника.

Не застосовувати мурчакам та хом'якам, екзотичним тваринам.

Не застосовувати тваринам із порушенням функції печінки та нирок, електrolітним дисбалансом.

### **Застереження**

#### *Побічна дія*

Пеніциліни мають низьку токсичність для собак – терапевтичний індекс більше 100, токсичний ефект відмічався тільки після введення надзвичайно високих доз, і являються високотоксичними для мурчаків, хом'яків, екзотичних тварин.

Побічні дії пеніцилінів в основному проявляються алергічними реакціями: кропивниця, дерматити, фарингіти, анафілактичний шок, які зустрічаються у 0,01 % випадків. Кількість пеніциліну, необхідна для сенсibiliзації суб'єкту на декілька порядків вища, ніж кількість, яка викликає алергічні реакції у раніше сенсibiliзованої тварини.

Побічні дії швидко зникають після припинення застосування препарату.

#### *Особливі застереження при використанні*

Реакція тварин різних видів на препарат дуже схожа. Найбільш чутливі молоді тварини; реакція втомлених тварин, особливо в спеку, сильніше виражена.

У новонароджених, внаслідок незрілої системи ниркової екскреції, можлива кумуляція пеніцилінів.

Для старих тварин, внаслідок вікових змін функції нирок, може бути необхідна корекція режиму дозування пеніцилінів.

Оскільки пеніциліни екскретуються переважно нирками в незміненому вигляді, при нирковій недостатності необхідно коректувати режим дозування.

Препарат погано проникає крізь плацентарний бар'єр.

Незважаючи на те, що пеніциліни не утворюють високих концентрацій у молоці, їх використання може призвести до сенсibiliзації новонароджених, розвитку у них кандидозу та діареї.

*Застосування під час вагітності, лактації, несучості*

Протипоказань немає.

*Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії*

Наявний синергізм при сполученні з аміноглікозидами, але їх не можна застосовувати в одному шприці, оскільки при цьому відмічається інактивація аміноглікозидів.

Потрібно уникати застосування пеніцилінів у сполученні з сульфаніламидами, оскільки при цьому можливе послаблення їх бактерицидного ефекту.

Ефект препарату послабляють засоби, які викликають бактеріостаз (тетрациклін).

Використовуються у комбінації з іншими антибіотиками (наприклад з макролідами при пневмонії, з хлорамфеніколом при менінгіті).

Ознаки, причини та механізми взаємодії засобів з бензилпеніциліну натрієвою та калієвою солями.

З якою сполукою взаємодіє	Ознаки, причини та механізми взаємодії
Лінкоміцин, окситетрациклін, гепарин (у розчині)	Утворення осаду
Левоміцетин, тетрациклін, хлортетрациклін, цефалоридин, цефалотин, барбітурати, гліцерин, глюкоза, еуфілін, аміназин, вітаміни групи В, аскорбінова кислота, етанол, окис цинку, кислоти, окислювачі (в розчині).	Інактивація антибіотика
Аміноглікозидні антибіотики (в розчині)	Взаємна інактивація та зниження антимікробної активності за рахунок утворення зв'язку між $\beta$ -лактамним кільцем та аміногрупою аміноглікозида
Солі важких та лужноземельних металів (у розчині)	Утворення важкорозчинних солей
Стрептоміцин	Пригнічення скорочувальної здатності серця
Левоміцетин, тетрациклін, еритроміцин	Зниження протимікробної активності
Неоміцин	Зменшення всмоктування пеніциліну; підвищення згортання крові
Дикумарин та інші похідні оксикумарину	Зменшення антикоагулятивного ефекту
Трипсин, хімотрипсин, гіалуронідаза	Збільшення вмісту пеніциліну в органах та тканинах
Кортизон, гідрокортизон (при багаторазовому введенні)	Зниження концентрації антибіотика в крові
Нікотинова кислота	Збільшення концентрації антибіотика в крові та пролонгація його дії
Еуфілін, кофеїн	Збільшення концентрації
Фуросемід	Збільшення концентрації пеніциліну в органах, тканинах та біологічних рідинах за рахунок пригнічення активного транспорту антибіотика в епітелії ниркових канальців

*Передозування (симптоми, невідкладні заходи, антидоти)*

Препарат малотоксичний.

Смертельні отруєння собак препаратом спостерігали при введенні їм внутрішньовенно доз, більших за лікувальну в 90-100 раз, а внутрішньом'язово – у 140-270 разів.

У великих дозах (особливо при довготривалому застосуванні) пеніциліни у деяких тварин (не більше 1 %) викликали побічні явища: зниження біоелектричної активності головного мозку, уповільнення відповідної реакції на світлові та звукові подразнення. При довготривалому застосуванні іноді препарат викликає алергічні реакції. Симптоми швидко зникають, якщо припинити дачу препарату.

Терапія ускладнень зводиться до призначення кальцію хлориду, кальцію глюконату, ефедрину, димедролу в терапевтичних дозах.

*Спеціальні застереження для осіб і обслуговуючого персоналу*

Дотримуватись правил роботи з ветеринарними препаратами.

#### **Форма випуску**

Флакони, герметично закупорені пробками гумовими і обтиснуті ковпачками алюмінієвими по 1 000 000 ОД. На флакони наклеюють етикетку-самоклейку.

#### **Зберігання**

Сухе темне, недоступне для дітей місце за температури від 15 °С до 25 °С.

Термін придатності – 4 роки.

Використовувати свіжоприготовлений розчин. Розчин не підлягає зберіганню.

#### **Для застосування у ветеринарній медицині!**

#### **Власник реєстраційного посвідчення:**

ПАТ «Київмедпрепарат»

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

#### **Виробник готового продукту:**

ПАТ «Київмедпрепарат»

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