

БІЦИЛІН®-5
(порошок для суспензії для ін'єкцій)
листівка-вкладка

Опис

Порошок білого або білого зі злегка жовтуватим відтінком кольору

Склад

1 флакон препарату містить діючі речовини:

бензатину бензилпеніциліну стерильного (Біциліну-1) – 1 200 000 ОД,

бензилпеніциліну новокаїнової солі стерильної – 300 000 ОД.

Фармакологічні властивості

АТС vet класифікаційний код QJ01 – антибактеріальні ветеринарні препарати для системного застосування. QJ01 CE30 - Комбінації пеніцилінів.

Бензилпеніцилін є бактерицидним β-лактамним антибіотиком, що належить до групи пеніцилінів, які чутливі до дії β-лактамаз.

Бензилпеніцилін гальмує утворення мукопептидних зв'язків за рахунок інгібування транспептидази, порушує пізні етапи синтезу пептидоглікану клітинної оболонки, що приводить до лізису клітин, що діляться.

Бензилпеніцилін активний щодо грампозитивних бактерій, таких як *Streptococcus spp.*, *Staphylococcus spp.*, *Bacillus spp.* (з меншою мірою по відношенню до *Enterococcus spp.*), лістерій (*L. monocytogenes*), збудника бешихи свиней (*E. rhusiopathie*), більшості корінобактерій, більшості анаеробних бактерій (*Peptostreptococcus spp.*, *Clostridium spp.*), спірохет (*Treponema spp.*, *Borrelia spp.*, *Leptospira spp.*), актиноміцетів. З грамнегативних бактерій до **бензилпеніциліну** чутливі *Neisseria spp.*, *P. multocida*, *H. dugreii*.

Ентеробактерії, бруцели, мікобактерії, найпростіші, віруси, гриби і рикетсії не чутливі до дії препарату. Це зумовлено тим, що ці мікроорганізми здатні виробляти специфічний фермент пеніциліназу, яка руйнує β-лактамне кільце в молекулі пеніцилінів, внаслідок чого вони втрачають антимікробну дію.

Набута резистентність до бензилпеніциліну найбільш часто зустрічається серед стафілококів.

Для більшості чутливих мікроорганізмів терапевтичною концентрацією бензилпеніциліну **вважають** 0,1-0,2 ОД/мл. Мінімальна інгібуюча концентрація **бензилпеніциліну** для найбільш чутливих штамів становить 0,001-0,05 ОД/мл.

Біцилін®-5 – **це антимікробний препарат** пролонгованої дії. В організмі **створює** депо **бензилпеніциліну**.

Розчинність бензилпеніциліну новокаїнової солі – 4–4,5 мг/мл, а бензатину бензилпеніциліну – 0,2–0,3 мг/мл. Прокаїнова сіль і бензатин **бензилпеніциліну** повільно гідролізуються до бензилпеніциліну, **проте** їх рівні переважають мінімальну інгібуючу **концентрацію для** мікроорганізмів.

Бензилпеніцилін при внутрішньому з'язовому введенні **Біцилін®-5** повільно всмоктується і його концентрація підтримується в крові на терапевтичному рівні протягом тривалого часу.

При введенні у **рекомендованих** дозах новокаїнова сіль бензилпеніциліну адсорбується протягом 12 год. і утримується в терапевтичних концентраціях в крові не менше 12 годин. Через малу розчинність бензатин **бензилпеніциліну** в місці ін'єкції утворює депо **бензилпеніциліну, який** адсорбується протягом 120 год., завдяки чому після одноразового введення **бензилпеніцилін** у мінімальних інгібуючих концентраціях виявляють в крові протягом 1-2 тижнів.

Концентрація антибіотика в крові залежить від введеної дози.

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

Бензилпеніцилін зв'язується з білками крові на 50-60 %. Він утворює з білками крові легко дисоційовані комплекси. У процесі зв'язування пеніцилінів зайняті альбуміни. Інтенсивність утворення комплексів пеніцилінів 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, проте **бензилпеніцилін** погано проникає у міокард, мозок, кістки, синовіальну та спинномозкову рідину.

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

При розвитку в організмі тварин патологічних процесів, закономірність розподілу **бензилпеніциліну** змінюється: в уражених тканинах **концентрація бензилпеніциліну збільшується** у декілька разів. Найбільша концентрація відмічається в фазу гострого перебігу процесу. По мірі згасання симптомів запалення або переходу його в хронічний перебіг, вміст **бензилпеніциліну** у хворому організмі зменшується. **Період напіввиведення** ($T_{1/2}$) – декілька днів.

Із організму виводиться, головним чином, з сечею (60-90 %) та частково з жовчю (1-8 %). Деяка кількість (9-32 %) руйнується шлунковим соком і ферментом пеніциліназою, що продукується мікрофлорою кишечника.

В незначних кількостях екскретується з слиною та молоком.

При порушенні функції нирок може **тривалий час** циркулювати в організмі. Швидкість виведення залежить від виду тварин і від стану тварини (прискорюється при підвищеній температурі тіла).

Застосування

Лікування собак, хворих на ендометрит, піодермію, гнійний отит, поліартрит, гострий цистит, пододерматит, піометру, мастит, а також за інфекційних захворюваннях та інфекційно-запальних процесах, що спричинені мікроорганізмами, чутливими до складових препарату.

Дозування

Суспензію готують безпосередньо перед використанням. **Препарат** після додавання 9 мл ізотонічного розчину натрію хлориду або стерильної води для ін'єкцій, або 0,25-0,5 % розчину новокаїну необхідно перемішати до отримання рівномірної суміші.

Препарат вводять внутрішньом'язово 1 раз на 10-15 діб у дозі:

Вид тварин	Доза препарату (тис. ОД на кг маси тіла)	
	Дорослі тварини	Молодняк
Собаки	10	12

Протипоказання

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

Не застосовувати препарат мурчакам, хом'якам та екзотичним тваринам.

Не застосовувати внутрішньовенно.

Застереження

Побічна дія

Пеніциліни відносяться до малотоксичних сполук і при будь-якому способі клінічного застосування не викликають побічних реакцій.

Побічні дії пеніцилінів, в основному, проявляються алергічними реакціями: кропивниця, дерматити, фарингіти, навіть анафілактичний шок, які зустрічаються у 0,01 % випадків.

Токсичність препарату низька для тварин (за виключенням мурчаків, хом'яків, екзотичних тварин). Пеніцилін є найбільш малотоксичним препаратом із усіх антибіотиків резорбтивної дії.

При внутрішньом'язовому застосуванні препарат у місці ін'єкції може викликати помірне подразнення, болочість.

Побічні дії швидко зникають після припинення застосування препарату.

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

Особливі застереження при використанні

Препарат застосовують тільки внутрішньом'язово.

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, необхідна корекція режиму дозування пеніцилінів.

Пеніциліни екскретуються переважно нирками в **незміненому** вигляді, тому при нирковій недостатності необхідно коректувати режим дозування.

Препарат погано проникає крізь плацентарний бар'єр.

Застосування під час вагітності, лактації, несучості

Протипоказань немає.

Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії

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

Не застосовувати одночасно з сульфаніламидами, оскільки при цьому можливо 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).

Не застосовувати одночасно з індометацином, фенілбутазолом, саліцилатами.

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 препарат може викликати алергічні реакції. Симптоми швидко зникають, якщо припинити застосування 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 з трубки скляної, герметично закупорені пробками гумовими і обтиснуті ковпачками алюмінієвими по 1 500 000 ОД.

Зберігання

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

Термін придатності – 4 роки.

Використовувати свіжоприготовлену суспензію. Суспензія 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.