

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

Retarpen® 2.4.

стр. 1 от 7

1. Търговско име на лекарствения продукт:

Retarpen® 2.4

/Benzathine benzylpenicillin/

2. Количествен и качествен състав:

1 флакон съдържа 2.400.000 IU Benzathine Benzylpenicillin.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към

разрешение за употреба № 11-13483/22.06.06г.

698/06.06.06 *M. M. M.*

За помощните вещества вж. 6.1.

3. Лекарствена форма:

Retarpen® е прах за инжекционен разтвор.

4. Клинични данни:

4.1. Показания:

Retarpen® е депо-препарат на penicillin G, предназначен за дълбока мускулна инжекция. Retarpen® е показан за лечение и профилактика на инфекции, причинени от микроорганизми с висока чувствителност към penicillin.

Retarpen® е подходящ за монотерапия на:

- остър тонзилит
- скарлатина
- еризипел (хроничен), еризипелоид
- инфектирани рани, ухапвания
- сифилис (единична доза е достатъчна при първичен сифилис)
- други трепонемни инфекции (фрамбезия, беджел, пинта)

Retarpen® се използва самостоятелно за превенция на:

- ревматизъм (хорея, ревматично сърдечно заболяване)
- постстрептококов гломерулонефрит
- скарлатина (при контактни)
- еризипел
- сифилис (при контактни)

4.2. Дозировка и начин на приложение:

Лечение на сифилис:

- 1) Конгенитален сифилис при новородени и кърмачета (без неврологични симптоми)- половин доза Retarpen® 2.4, инжектирана на две места.
- 2) Първичен, вторичен, латентен сифилис
 - а) първичен:
1 доза Retarpen® 2.4, инжектирана на две места.
 - б) вторичен:
2 дози Retarpen® 2.4, инжектирани на две места.
Лечението трябва да се повтори, ако има рецидив или ако лабораторните тестове са трайно позитивни.
 - в) късен (третичен, серопозитивен):
1-2 дози Retarpen® 2.4 седмично за 3 до 5 седмици.

Лечение на фрамбезия:

Възрастни и деца над 12 години: ½ до 1 доза от Retarpen® 2.4



На лицата, които са в контакт и тези с латентни инфекции се назначават редуцирани наполовина дозировки.

Лечение на пинта:

Деца: ½ доза от Retarpen® 2.4.

Възрастни: 1 доза от Retarpen® 2.4.

Други инфекции:

Деца под 12 години: ½ доза Retarpen® 2.4 на интервали от 2 до 4 седмици.

Възрастни: ½ или 1 доза Retarpen® 2.4 веднъж седмично.

Дозировка при профилактика

Профилактика на рецидивиращи ревматизъм, ревматичен ендокардит, хореа, постстрептококов гломерулонефрит и еризипел:

Деца под 12 години: ½ доза Retarpen® 2.4 на интервали от 4 седмици.

Възрастни: ½ до 1 доза Retarpen® 2.4 на интервали от 4 седмици.

Профилактика на скарлатина при контактни:

Деца под 12 години: ½ доза Retarpen® 2.4 на седмица.

Възрастни: 1 доза Retarpen® 2.4.

За превенция на усложнения, пациенти със стрептококови инфекции трябва да бъдат лекувани най-малко 10 дни. Това може да се постигне с ½ доза Retarpen® 2.4 при деца над 12 години и с 1 доза Retarpen® 2.4 при възрастни.

Дозировка при пациенти с бъбречна недостатъчност

При тези пациенти дозирането се определя в зависимост от стойностите на креатининовия клирънс.

Начин на приложение:

Дълбока мускулна инжекция.

4.3. Противопоказания:

- Установена свръхчувствителност към продукти от групата на пеницилините или някое от помощните вещества на лекарствения продукт. При пациенти с известна свръхчувствителност към цефалоспорини трябва да се има предвид възможност за кръстосана алергия.
- При заболявания като тежка пневмония, емпием, сепсис, перикардит, менингит, перитонит или артрит, изискващи високи серумни нива на пеницилин, лечението трябва да започне с бързодействаща водоразтворима сол на бензилпеницилин.
- Ако не може да бъде изключена неврологична симптоматика при пациенти с конгенитален сифилис, трябва да се приложат дозови форми на пеницилин, достигащи по-високи концентрации в цереброспиналната течност.
- Пациенти с алергична диатеза или бронхиална астма се нуждаят от специално внимание.



4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба:

- Пациентите трябва да бъдат информирани за възможността от поява на алергични реакции и инструктирани да ги съобщават. Особено внимание се изисква при пациенти с алергична диатеза или бронхиална астма. Пациентите трябва да бъдат наблюдавани 30 минути след прилагането на продукта и лекарят да има готовност за адреналинова инжекция. Ако се прояви алергична реакция, прилагането на Retarpen® 2.4 трябва да бъде спряно и да се започне обичайното лечение с адреналин, антихистамини и кортикостероиди.
- За да се потисне и отслаби Jarisch-Herxheimer реакцията (вж. нежелани лекарствени реакции), при прилагане на първата антибиотична доза може да се приложи едновременно prednisolon 50 mg или еквивалентен стероид. При пациенти с кардиоваскуларен или менинговаскуларен сифилис, Jarisch- Herxheimer реакцията може да бъде предотвратена чрез prednisolon 50 mg дневно или еквивалентен стероид за период от 1-2 седмици.
- При диабетици трябва да се има предвид забавянето на абсорбцията от мускулното депо.
- При продължително лечение трябва да се мониторира кръвните показатели и бъбречната функция. Възможно е развитие на резистентни микроорганизми при продължително лечение с Retarpen® 2.4. Пациенти, развили вторични инфекции трябва да бъдат лекувани с подходящи средства.
- При пациенти, лекувани за венерически болести, за които се подозира наличие на съпътстващ сифилис трябва да бъде направена микроскопия в тъмно зрително поле преди започване на лечение и да се получат серологични тестове за най-малко 4 месеца. При пациенти с конгенитален сифилис преди лечението трябва да се изследва цереброспиналната течност.
- Продължителна и тежка диария трябва да подсказва за антибиотик-асоцииран псевдомембранозен колит (водниста диария с кръв и мукоза; тъпа, дифузна до коликообразна коремна болка; фебрилитет и рядко тенезми). Тъй като това състояние може да бъде животозастрашаващо, прилагането на Retarpen® 2.4 трябва да се спре незабавно и да се замести със специфично лечение (напр. перорално vancomycin 250 mg q.i.d.). Антиперисталтични продукти са противопоказани.
- За да бъде избегнато засягане на седалищния нерв, бебета и малки деца не трябва да се инжектират в горния външен квадрант на глутеуса, освен при специални случаи, напр. при обширни изгаряния.
- Retarpen® не трябва да се прилага подкожно, интравенозно или интратекално, или инфузиран в телесните кухини. Невнимателното подкожно приложение може да причини болезнено втвърдяване на мястото на прилагане. Болката се облекчава чрез налагане на торбички с лед. Невнимателното вътресъдово инжектиране може да причини синдром на Hoigné (симптоми на шок с чувство за неизбежност, обърканост, халюцинации, понякога цианоза, тахикардия и двигателни аномалии, без циркулаторен колапс). Тези явления се дължат на микроемболия от инжектирането на суспензията и отшумяват спонтанно в рамките на 1 час. При по-тежки случаи пациентите трябва да приемат инжекционно седативи. При деца невнимателното интраартериално



приложение може да предизвика тежки усложнения като съдова оклузия, тромбоза и гангрена. Те са предшествани от избледняване на кожата около мястото на инжектиране. Ако се инжектира под високо налягане, инжектираната течност може да попадне в потока на големите илиачни артерии, аортата или спиналните артерии.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия.

Тъй като пеницилините са активни само срещу пролифериращи микроорганизми, Retarpen® не трябва да се комбинира с бактериостатични антибиотици. Комбинации с други антибиотици трябва да се използват само когато се очаква ефектът да бъде синергичен или поне адитивен. При комбиниране антибиотиците се прилагат в стандартни дозировки, освен при доказан синергичен ефект. Когато противовъзпалителни, антиревматични, антипиретични продукти (особено indomethacin, phenylbutazone и салицилати във високи дози) или пробенецид са използвани в комбинация с Retarpen®, трябва да се има предвид възможно конкурентно инхибиране на елиминирането.

Както останалите антибиотици, Retarpen® може да намали ефикасността на пероралните контрацептиви.

За да се изключат нежелани химични взаимодействия, прилагането на Retarpen® с други вещества в една спринцовка трябва да се избягва.

4.6. Бременност и кърмене.

Досега няма данни за ембриотоксичен, тератогенен или мутагенен ефект на benzathine benzylpenicillin при прилагането му по време на бременност. Трябва да се има предвид, че benzathine benzylpenicillin може да бъде открит в майчиното мляко.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини:

Досега няма съобщени такива.

4.8. Нежелани лекарствени реакции:

Реакции на свръхчувствителност

Алергичните реакции не са чести. Възможните алергични реакции включват уртикария, ангионевротичен оток, еритема мултиформе, ексфолиативен дерматит, фебрилитет, ставна болка или анафилактичен шок с колапс и анафилактоидни реакции (астма, пурпура, гастроинтестинални симптоми).

Гастроинтестинални нежелани реакции

Рядко са наблюдавани стоматити и глосити. При пациенти, развили диария по време на лечението, трябва да се има предвид вероятност за псевдомембранозен колит (вж. Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба).

Хематологични нежелани реакции

Позитивиране на директния тест на Coombs, хемолитична анемия, левкопения, тромбоцитопения и агранулоцитоза са съобщавани, но изключително рядко.

Други нежелани реакции

Невропатия, нефропатия.



Пациенти, лекувани за сифилис могат да развият вторично Jarisch-Herxheimer реакция в резултат на бактериолиза.

При бебета могат да се проявят локални реакции.

Въпреки че са изключително редки, натрупване на повидон в ретикуло-ендотелната система или локално при инжектиране, и грануломи, наподобяващи тумори не могат да бъдат изключени.

4.9. Предозиране:

Симптоми на интоксикация

Симптомите на предозиране в голяма степен припокриват профила на нежеланите реакции. Възможни са гастроинтестинални оплаквания и нарушения на водно-електролитния баланс.

Лечение на предозиране

Няма специфичен антидот при предозиране. Лечението се състои в хемодиализа, стомашна промивка или симптоматични мерки, като се поддържа водно-електролитния баланс.

5. Фармакологични данни:

5.1. Фармакодинамични свойства

Retarpen® е депо-препарат на penicillin G. В нормални концентрации penicillin е бактерициден за чувствителни пролифериращи микроорганизми, потискайки биосинтезата на клетъчната им стена.

Спектърът на действие на Retarpen® включва микроорганизми, високочувствителни към пеницилин, напр. стрептококи групи А, С, G, H, L и M, *Streptococcus pneumoniae*, пеницилиназа непродуциращи стафилококи и *Neisseriae*; чувствителни са също *Erycipelothrix rhusiopathiae*, *listeriae*, *corynebacteria*, *Bacillus anthracis*, *actinomycetes*, *streptobacilli*, *Pasteurella multocida*, *Spirillum minus*; *Leptospira*, *Treponema*, *Borrelia* и други спирохети както и голям брой анаеробни агенти като *peptococci*, *peptostreptococci*, *fusobacteria*, *clostridia* и т.н. При ентерококите (група D стрептококи) само някои показват чувствителност.

5.2. Фармакокинетични свойства

Интрамускулната абсорбция на Retarpen® към кръвния ток е много бавна. Това е най-бавно действащия депо-препарат на пеницилин. За много от показанията, инжектиране на интервали от 1-2 седмици е достатъчно, за да се редуцира локалната реакция от инжекцията.

Около 55% от приложената доза се свързва с плазмените протеини. Бензилпеницилин дифундира веднага към повечето телесни течности и тъкани. По-голяма част от лекарството се елиминира в активна форма чрез бъбречните механизми. Жлъчното елиминиране засяга само малка фракция от дозата. При новородени и пациенти в напреднала възраст елиминирането е забавено.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Penicillin G е практически нетоксичен.

Остра токсичност:

За токсични дози при бели мишки след интравенозно, перорално, интрамускулно и интраабдоминално приложение са определени 3,090-6.000



mg/kg телесно тегло, <2.000 mg, <2.000 mg, <2.000 mg, съответно и при плъхове <2.500 mg p.o., <2.000 mg i.m. и <2.000 mg i.p.

Субхронична токсичност:

След интрамускулно прилагане на 100 mg натриева сол на penicillin G/kg телесно тегло при кучета и 30 mg/kg телесно тегло при зайци за 5 седмици не са забелязани признаци на токсичност.

Тератогенност

100 mg penicillin G/kg/ден прилагани на бременни зайци не са довели до аборт или тератогенни ефекти.

6. Фармацевтични данни:

6.1. Списък на помощните вещества:

Simethicone

Mannitol

Povidone 17,9.500 Dalton 50 mg

Sodium Citrate Buffer, pH 7

6.2. Физико-химични несъвместимости:

Открити са несъвместимости на бензилпеницилин с алкохол, глицерол, гликол, захари, киселини, амини, аминокридин хидрохлорид, ефедрин, прокаин, тежки метали, каучукови запушалки на инфузионните банки, тиамин хидрохлорид, цинков оксид, оксиданти, окислена целулоза, йодиди, тиоли, тиомерзал, хлорокрезол и резорцин.

6.3. Срок на годност:

48 месеца.

6.4. Специални условия на съхранение:

Да се съхранява при температура до 25 ° C, защитен от светлина.

6.5. Данни за опаковката:

Retarpen® 2.4 флакон: единична опаковка от 1 флакон (+ разтворител), болнични опаковки.

6.6. Специални инструкции за употреба :

За интрамускулна инжекция разтворете съдържанието на флакона в най-малко 5 ml вода за инжекции.

Разклатете енергично за 20 секунди и приложете веднага като използвате игла с размер най-малко 0.9 mm. Изтегляйте не повече от една доза. Използвайте само прясно приготвени суспензии. Преди инжектиране на дозата аспирирайте, за да е сигурно, че иглата не е попаднала в кръвоносен съд. При многократно прилагане променяйте мястото на инжектиране.

Прилагайте чрез дълбока интрамускулна инжекция в горния външен квадрант на глутеуса или венстрикулоглутеалната област по Hochstetter, При деца се предпочита прилагане средностранично на бедрото (musculus quadriceps femoris). Използвайте само делтовидния мускул за инжекции, ако е добре развит; пазете радиалния нерв.



КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

Retarpen® 2.4.

стр. 7 от 7

Максималния поносим обем в мястото на инжектиране е 5 ml. Затова не трябва да се прилагат повече от 5 ml .

Не прилагайте повече от 50 mg повидон (еквивалентни на 1 доза Retarpen® 2.4) на едно място за инжектиране. При необходимост инжектирайте по-високата единична доза (напр. 2 дози Retarpen® 2.4) на две различни места.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба:

Sandoz GmbH
Biochemiestrasse 10, A-6250 Kundl
Austria

8. Регистрационен номер в Регистъра:

20000350

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт:

08.06.2000

10. Дата на актуализация на текста:

Март 2002

