

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

BENZACILLIN®

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ BENZACILLIN®

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Активно вещество в един флакон от 9 ml Benzacillin, прах за инжекционна суспензия е Benzylpenicillin Benzathine 450 mg еквивалентно на:

Benzylpenicillin 600 000 UI;

Активно вещество в един флакон от 9 ml Benzacillin, прах за инжекционна суспензия е Benzylpenicillin Benzathine 900mg еквивалентно на:

Benzylpenicillin 1 200 000 UI.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Прах за инжекционна суспензия

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ПОКАЗАНИЯ

За профилактика и лечение на инфекции, причинени от чувствителни спрямо BENZACILLIN® микроорганизми:

- профилактика на рецидивите на ставния ревматизъм;
- лечение на сифилис.

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА УПОТРЕБА

Продуктът се назначава по лекарско предписание!

За профилактика на рецидивите на ставния ревматизъм:

- при възрастни се прилага през 15 дни по 2 400 000 UI интрамускулно;
- при деца се прилага през 15 дни по 600 000UI до 1 200 000 UI интрамускулно.

При лечение на сифилис - през 8 дена по 2 400 000 UI интрамускулно.

Инжектира се дълбоко интрамускулно, бавно с постоянна скорост поради високата концентрация на суспензията.

При деца продуктът се инжектира в средно-външната страна на бедрото, а при възрастни в горния външен квадрант на глутеусите. При повторна апликация мястото на инжектиране се променя.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Свръхчувствителност към пеницилини или други бета-лактамини антибиотици (цефалоспорини) поради възможност за кръстосана алергия

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба №	11-6647/ 11-6646/13-01.03
629/19.11.2002	<i>[Signature]</i>



4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗА УПОТРЕБА

Преди започване на всеки нов курс на лечение е задължително да се направи проба за свръхчувствителност към бензилпеницилин.

При липса на алергична анамнеза скарификационната проба се извършва с разреждане 100 000 IU/ml.

При анамнестични данни за алергия се извършва епикутанна проба със същото разреждане и ако тя е отрицателна се прави скарификационна проба. Пробите се извършват с разтвор на бензилпеницилин, престоял 5-7 дена и се отчитат след 30 мин. При развитие на алергична реакция се прилага подходящо лечение (0.1mg, 0.3mg, 0.5mg адреналин подкожно, кортикостероиди -инфузионно, антихистаминов продукт, при бронхоспазъм - новфилин, бета адреномиметици, кислород, при необходимост и интубация).

Продуктът се прилага с повишено внимание при пациенти с доказана алергия към цефалоспорини, гризеофулвин, пенициламин (кръстосана алергия).

Инжектира се само дълбоко интрамускулно! Не се въвежда интравенозно и интратекално!

Поради слаба разтворимост при попадане на Benzacillin във вена е възможно развитието на синдрома на Hoigne, а в артерия - на Nicolau.

При Hoigne - синдром се наблюдава обща тежка реакция, кашлица, стенокардни пристъпи, халюцинации, обърканост, страх, парестезии, но циркулаторен клапс не настъпва. Обяснението на синдрома е в инжектиране на микроемболи от продукта в капилярите на мозъка и белия дроб.

Nicolau - синдром настъпва в резултат на артериална емболия, проявяваща се с исхемия дистално от мястото на инжектиране, ливидно оцветяване на кожата, хематурия, мелена, парализа, некрози. За избягване на описаните нежелани реакции е необходимо да се избере правилно мястото на инжектиране, да се аспирира след въвеждане на иглата и болният задължително да се наблюдава в продължение на 15-20 мин.

При лечение на болни от сифилис е възможно да възникне реакция на Jarisch-Herxheimer поради освобождаване на големи количества ендотоксини (температура, изпотяване, главоболие, колапс).

Продължителната употреба на Benzacillin може да предизвика развитието на суперинфекция с Pseudomonas и Candida. При наличие на продължителни колики и диария е вероятно развитието на псевдомембранозен колит. Приложението на Benzacillin се прекратява и се назначава подходящо лечение.

При лечение на придружаващи инфекциозни вирусни заболявания особено инфекциозна мононуклеоза и при лимфолевкоза съществува риск от екзантем.

При пациенти с бъбречна недостатъчност дозирането се извършва според стойностите на креатинина.

Продължителната употреба на продукта и високите дози налагат периодична оценка на бъбречната, чернодробната функция и на хемопоезата.

Benzacillin не се назначава самостоятелно при лечение на тежки, остри инфекции и при бактериемия.



Benzacillin може да промени някои лабораторни тестове, при които се използват бактерии (фенилкетонурия), да предизвика преходно повишение на някои протеини в серума, фалшиво да позитивира реакцията за захар в урината (при използване на редуccionни методи) и директния тест на Coombs.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Едновременната употреба на Benzacillin с Probenecid, Indomethacin, Phenylbutazon, Salycilate, Sulfipyrazon засилват действието му.

Продуктът намалява действието на оралните контрацептиви.

Benzacillin потенцира действието на антикоагуланти и тромбоцитни антиагреганти.

Benzacillin засилва ефекта на лекарства, потискащи атриовентрикуларната и камерна проводимост (калциевите антагонисти и бета блокери).

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

По време на бременност и кърмене се прилага при строга преценка на ползата и риска, направена от лекуващия лекар!

Въпреки че няма данни за тератогенно действие на продукта, Benzacillin преминава през плацентата и е възможно да причини сенсibiliзация на плода през втората половина на бременността.

Продуктът се екскретира в кърмата в ниски концентрации. Възможна е поява на обриви и диария като израз на сенсibiliзация на кърмачето, както и развитието на гъбички по лигавиците.

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Benzacillin не оказва влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

- *Местни реакции* - болка в мястото на инжектиране и развитие на инфилтрат;
- *Алергични реакции* - уртикария, бронхоспазъм, едем на Quinke, рядко анафилактичен шок;
- *Кожни обриви* - макулопапулозни;
- *Имунологични реакции* - предизвикват рядко преходно повишаване на серумните трансминази; анемия, левкопения, обратима тромбопения; остър интерстициален нефрит; серумна болест; лекарствена треска;
- *Гастро-интестинален тракт* - сухота в устата, метеоризъм, колит, гадене, повръщане; кандидози;
- *Нервна система* - миоклонии, гърчове при много високи дози; възможна е промяна в обонянието.
- *Други* - суперинфекции с резистентни бактерии или гъбички при продължителна употреба.



4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

Предозирането може да предизвика нервномускулна свръхвъзбудимост, достигаща до гърчове. Назначава се незабавно подходящо лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

АТС код J01C E08

Benzacillin е антибиотик от бета-лактамите пеницилини от група G с пролонгирано действие за интрамускулно приложение. Действа бактерицидно върху размножаващи се микроорганизми чрез потискане биосинтезата на мукопептиди в клетъчната стена. Блокира ензима транспептидаза, инхибира ендопептидазата и глюкозидазата. Продуктът атакува бактериални структури и молекули, които нямат аналози в човешкия организъм. Това обяснява ниската му токсичност и възможността да се провежда лечение с постоянно увеличаващи се през годините дози.

Според чувствителността си към Benzacillin, бактериите се делят на четири големи групи:

- **много чувствителни до средно чувствителни:**

Streptococcus pyogenes (причинител на ревматизма, скарлатината, червения вятър и повечето ангини); *Treponema pallidum* (причинител на сифилис) са напълно чувствителни. Чувствителни са и повечето щамове *Streptococcus viridans* (причиняващ ендокардити), анаеробните стрептококи, *Pasteurella multocida* (причинява инфекции при ухапване), *Borrelia* (Лаймска болест), *Actinomyces israeli* (причинява актиномикоза). Много чувствителни са и *Neisseria meningitidis*. Висока е чувствителността на продукта и към повечето грам-отрицателни анаероби - *Prevotella melaninogenica* и *Fusobacterium*. Чувствителни са причинителите на дифтерията и *H. ducrei*.

- **с променлива чувствителност:**

Listeria, *Clostridium*, *Bacillus anthracis*, *Campylobacter*. При всички тези причинители етиотропно лечение се назначава след антибиограма. Голям проблем за лечението представляват т.н. пеницилин-резистентни пневмококи. Освен резистентност към пеницилини тези щамове демонстрират резистентност и към други антибиотици.

- **слабо чувствителни щамове:**

Enterococcus faecalis, *Brucella*, *Haemophilus influenzae*, *Bordetella pertusis*;

- **резистентни към пеницилин:**

ентеробактерии, *E. faecium*, *Salmonella*, *Nocardia*, анаеробите от групата *Bacteroides fragilis*, *Vibrio cholerae*, микобактериите.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Приложен интрамускулно Benzacillin се освобождава бавно от мястото на приложение и се хидролизира до бензилпеницилин като лечебните концентрации на антибиотика се поддържат до 4 седмици.



Максималните плазмени концентрации се постигат от 12 часа до 24 часа след инжектирането.

В сравнение с еквивалентни дози бензилпеницилин - калиева (натриева) сол плазмените концентрации са по - ниски, но се задържат по- дълго. 40% до 60% от продукта се свързват с плазмените протеини. Плазмените концентрации на Benzacillin са по - ниски от тези, които се достигат след прилагане на еквивалентна доза Benzylpenicillin, поради което Benzacillin не се използва самостоятелно за лечение на тежки инфекции.

Benzacillin се разпределя добре в телесните течности и по- слабо в тъканите. Почти не прониква в ликвора освен при възпалени менинги. Премахва през плацентата и се екскретира в кърмата. Отделя се непроменен през бъбреците чрез гломерулна филтрация и тубулна секреция. Поради бавната резорбция продуктът се открива в урината до 10 - 12 седмици след приложението му.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Като представител на пеницилините Benzacillin е слабо токсичен. Поради бавната резорбция от мястото на инжектиране се създават ниски плазмени концентрации на бензилпеницилин. Не е установена кумулация на продукта в организма.

LD₅₀ при интравенозно прилагане на бензилпеницилин на мишки е 3 000 mg/kg.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА

Lecitin

6.2. ФИЗИКО-ХИМИЧНИ НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Поради възможни взаимодействия на Benzacillin *in vitro* не е желателно смесването на продукта с други лекарства в една спринцовка.

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

4 (четири) години от датата на производство.

6.4. СПЕЦИАЛНИ УСЛОВИЯ НА СЪХРАНЕНИЕ

Съхранява се в сухи складови помещения, защитени от пряка слънчева светлина, при температура под 25° С.

Съхранява се на място, недостъпно за деца!

6.5. ДАННИ ЗА ОПАКОВКАТА

Benzacillin 600 000 UI прах за инжекционна суспенсия в безцветни стъклени флакони от 9 ml. По 10 бр. и по 100 бр. стъклени флакони, поставени в картонени кутии.

Benzacillin 1 200 000 UI прах за инжекционна суспенсия в безцветни стъклени



флакони от 9 ml. По 10 бр. и по 100 бр. стъклени флакони, поставени в картонени кутии.

6.6. ПРЕПОРЪКИ ПРИ УПОТРЕБА

Лекарственият продукт не се използва след изтичане срока на годност, указан на опаковката!

Да се инжектира само дълбоко мускулно! Да не се въвежда интравенозно или интратекално!

Да се използва непосредствено след приготвяне на суспенсията!

Приготвяне на суспенсията

Суспенсията се приготвя непосредствено преди употреба. Към съдържанието на флакона се добавя 2ml/600 000 UI стерилна двойно дестилирана вода за инжекции или изотоничен разтвор на натриев хлорид, разклаща се до получаване на хомогенна суспенсия, която бързо се изтегля в спринцовка и се инжектира дълбоко мускулно бавно, с постоянна скорост на въвеждане поради високата концентрация на суспенсията.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Балканфарма - Разград АД"

гр. Разград 7200 бул. "Априлско въстание" № 68

тел 084 23461, факс: 084 34272

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ.28 ОТ ЗЛАХМ

9600369/30.12.1996г - Benzacillin 600 000 UI

9600370/30.12.1996г - Benzacillin 1 200 000 UI

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ (ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО)

Протокол №

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Септември 2001 год

