

БІЦИЛІН® 3
(порошок для суспензії для ін'єкцій)
листівка-вкладка

Опис

Порошок білого або білого із злегка жовтуватим відтінком кольору.

Склад

1 флакон препарату містить діючі речовини:

бензатину бензилпеніцилін стерильний (Біциліну-1) – 200 000 ОД,
бензилпеніциліну натрієву сіль стерильну – 200 000 ОД,
бензилпеніциліну новокаїнову сіль стерильну – 200 000 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 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 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. dugreyi*.

Ентеробактерії, бруцели, мікобактерії, найпростіші, віруси, гриби і рикетсії не чутливі до дії бензилпеніциліну. 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 пеніцилінів 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®-3 – це антимікробний препарат пролонгованої дії.

Різні солі бензилпеніциліну мають неоднакову розчинність, в результаті чого дія бензилпеніциліну настає швидко (за рахунок натрієвої солі) та підтримується подовжено (за рахунок інших солей бензилпеніциліну). Розчинність бензилпеніциліну натрієвої солі становить 25 мг/мл води, його новокаїнової солі – 4-4,5 мг/мл, а бензатин бензилпеніциліну – 0,2-0,3 мг/мл. Прокаїнова сіль і бензатин бензилпеніцилін повільно гідролізуються до бензилпеніциліну, але їх рівні переважають мінімальну інгібуючу концентрацію для мікроорганізмів.

При введенні у рекомендованих дозах новокаїнова сіль бензилпеніциліну адсорбується протягом 12 год. і утримується в терапевтичних концентраціях в крові не менше 20-24 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.

Бензилпеніцилін натрієва сіль у крові в терапевтичних концентраціях виявляється вже через 15-20 хвилин з моменту введення препарату та утримується у терапевтичних межах протягом 3-6 год., тоді як комплекс солей пеніциліну – 3-7 діб.

При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація бензилпеніциліну в крові спостерігається вже через 30-60 хвилин.

Концентрація бензилпеніциліну в крові залежить від введеної дози, а тривалість перебування в крові подовжується.

Залежно від дози препарату бензилпеніциліну в організмі утримується протягом 7-10 діб.

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) препарату бензилпеніцилін у високих дозах виявляють у печінці, нирках і легенях, але він погано проникає у міокард, мозок, кістки, синавіальну та спинномозкову рідину.

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

В уражених тканинах концентрація бензилпеніциліну збільшується у декілька разів. Найбільша концентрація бензилпеніциліну відмічається в фазу гострого перебігу процесу. По мірі згасання симптомів запалення або переходу його в хронічний перебіг вміст бензилпеніциліну в хворому організмі зменшується.

Із організму бензилпеніцилін 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. У незначних кількостях екскретується з слиною та молоком.

При порушенні функції нирок бензилпеніцилін може тривало циркулювати в організмі.

Швидкість виділення залежить від виду тварин і від стану тварини (прискорюється при підвищеній температурі тіла).

Застосування

Лікування собак, хворих на крупозну пневмонію, катарально-гнійний ендометрит, гнійний риніт, піодермія, гнійні рани, уроцистит, гнійний баланопостит, гнійний кон'юнктивіт, гострий бронхіт, гнійний пододерматит, що спричинені мікроорганізмами, чутливими до складових препарату.

Дозування

Суспензію препарату готують стерильно безпосередньо перед введенням, для чого у флакон додають 5-6 мл ізотонічного розчину натрію хлориду або стерильної води для ін'єкцій, або 0,25-0,5 % розчину новокаїну, перемішують до отримання рівномірної суміші.

Препарат вводять внутрішньом'язово один раз на 5-6 діб у наступних дозах (із розрахунку на 1 кг маси тіла):

| Вид тварин | Разова лікувальна доза (тис. ОД на кг маси тіла тварини) | |
|------------|--|----------|
| | Дорослі тварини | Молодняк |
| Собаки | 40 | 60 |

Протипоказання

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

Не застосовувати препарат мурчакам та хом'якам, 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 до анафілактичного шоку, які зустрічаються у 0,01 % випадків.

Токсичність препарату низька як для людини, так і для тварин (за виключенням мурчаків, хом'яків, екзотичних тварин). Бензилпеніцилін є найбільш малотоксичним із усіх антибіотиків резорбтивної дії.

При внутрішньом'язових ін'єкціях місцево препарат може викликати помірно подразнення. Побічні дії швидко зникають після припинення дачі препарату.

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

Особливі застереження при використанні

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.

По причині того, що пеніциліни екскретуються переважно нирками в незміненому вигляді, при нирковій недостатності необхідно коректувати режим дозування.

При застійній серцевій недостатності великі дози бензилпеніциліну натрієвої солі можуть викликати появу та посилення набряків, зниження артеріального тиску.

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 в них кандидозу та діареї.

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.

Потрібно уникати застосування пеніцилінів у сполученні 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).

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 β -лактамним кільцем та аміногрупою аміноглікозида |
| Солі важких та лужноземельних металів (у розчині) | Утворення важкорозчинних солей |
| Стрептоміцин | Пригнічення скорочувальної здатності серця |
| Левоміцетин, тетрациклін, олеандоміцин, 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 антибіотика в крові |
| Фуросемід | Збільшення концентрації пеніциліну в органах, тканинах та біологічних рідинах за рахунок пригнічення активного транспорту антибіотика в епітелії ниркових каналців |

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

Скляні флакони, герметично закупорені пробками гумовими і обтиснуті ковпачками алюмінієвими по 600 000 ОД.

Зберігання

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

Термін придатності – 4 роки. Застосувати 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.