

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

DEBECYLINA, 1 200 000 j.m., proszek do sporządzania zawiesiny do wstrzykiwań

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna fiolka zawiera 1 200 000 j.m. benzylopenicyliny benzatynowej lecytynowanej (*Benzathini benzylpenicillinum*).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Proszek do sporządzania zawiesiny do wstrzykiwań.
Biały lub prawie biały proszek.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Benzylopenicylina benzatynowa jest wskazana w leczeniu niżej wymienionych zakażeń wywołanych przez wrażliwe na nią drobnoustroje, gdy konieczne jest niezbyt wysokie, ale długo utrzymujące się stężenie antybiotyku we krwi.

Dorośli

- zakażenia górnych dróg oddechowych wywołane przez wrażliwe paciorkowce;
- choroby weneryczne - kiła;
- zapobieganie nawrotom ostrych rzutów gorączki reumatycznej, zapaleniu wsierdza, kłębuszkowemu zapaleniu nerek.

Dzieci

- wyłącznie w zapobieganiu chorobie reumatycznej i zapaleniu wsierdza.

Uwaga! Przed rozpoczęciem leczenia benzylopenicyliną benzatynową należy przeprowadzić badanie lekowrażliwości wyizolowanego drobnoustroju, wywołującego zakażenie. Leczenie może być wdrożone przed uzyskaniem wyniku lekowrażliwości drobnoustroju. Po uzyskaniu wyniku antybiogramu może być konieczna odpowiednia zmiana leku.

Podjętą decyzję o leczeniu należy uwzględnić oficjalne wytyczne dotyczące stosowania leków przeciwbakteryjnych.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Wielkość dawki zależy od ciężkości zakażenia, wrażliwości drobnoustroju wywołującego zakażenie, stanu pacjenta, wieku i masy ciała.

Benzylopenicylinę benzatynową należy podawać tylko domięśniowo.

Dawkowanie

Dorośli

Lek podaje się zwykle w dawkach od 1 200 000 j.m. do 2 400 000 j.m. jednorazowo lub w dawkach podawanych co 1 do 4 tygodni.

Nie należy przekraczać dobowej dawki 2 400 000 j.m.

Dzieci

W zapobieganiu nawrotom gorączki reumatycznej i zapaleniu wsierdza wywołanym przez paciorkowce zwykle podaje się:

dzieci od 2 do 3 lat – 600 000 j.m., co 8 do 14 dni;

dzieci od 4 do 18 lat – 1 200 000 j.m., co 14 do 21 dni.

Uwaga! W przypadku ostrych lub ciężkich zakażeń, gdy konieczne jest uzyskanie wysokich stężeń leku we krwi, zaleca się podawanie domięśniowo lub dożylnie benzylopenicyliny potasowej lub sodowej.

Czas leczenia

Czas leczenia zależy od ciężkości i rodzaju zakażenia.

Sposób podawania

Lek podaje się głęboko domięśniowo, w górny zewnętrzny kwadrant pośladka.

Wstrzyknięcia benzylopenicyliny benzatynowej należy wykonywać z dużą ostrożnością, by uniknąć wkłucia igły w żyłę lub wstrzyknięcia dotętniczego oraz nie uszkodzić nerwów obwodowych lub naczyń krwionośnych.

Zawieszinę należy podawać bezpośrednio po przygotowaniu.

Sposób sporządzenia zawiesziny podano w punkcie 6.6.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na penicyliny lub inne antybiotyki beta-laktamowe lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Nie wstrzykiwać w okolicę nerwu lub naczynia krwionośnego.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Uwaga! W przypadku ostrych lub ciężkich zakażeń, gdy konieczne jest uzyskanie wysokich stężeń leku we krwi, zaleca się podawanie domięśniowo lub dożylnie benzylopenicyliny potasowej lub sodowej.

U pacjentów leczonych penicyliną mogą wystąpić ciężkie reakcje nadwrażliwości, zwłaszcza u pacjentów uczulonych na wiele alergenów. Należy upewnić się, czy pacjent uczulony jest na penicylinę, cefalosporyny lub inne leki oraz zebrać wywiad, czy u pacjenta występowały w przeszłości reakcje alergiczne, niezależnie od ich przyczyn. Brak danych z wywiadu co do nadwrażliwości na antybiotyki β -laktamowe nie jest dowodem, że taka nadwrażliwość u pacjenta nie występuje.

Jeżeli podanie benzylopenicyliny jest niezbędne, pacjent w wywiadzie zgłasza występowanie w przeszłości reakcji alergicznych (niezależnie od czynnika wywołującego), a preparat do diagnostyki nadwrażliwości na ten lek jest dostępny, należy wykonać próbę zgodnie z instrukcją stosowania preparatu. Nie zaleca się wykonywania próby z użyciem penicyliny, ponieważ podanie zbyt wysokiej dawki może prowadzić do wstrząsu, a nawet śmierci pacjenta.

W razie wystąpienia wstrząsu anafilaktycznego lub obrzęku naczynioruchowego w pierwszej kolejności należy podać epinefrynę, następnie lek przeciwhistaminowy, a jako ostatni - kortykosteroid. Należy również monitorować podstawowe czynności życiowe (oddech, tętno, ciśnienie tętnicze krwi).

Lek należy stosować ostrożnie u pacjentów z niewydolnością nerek.

Podczas długotrwałego leczenia penicyliną, zwłaszcza jeśli stosuje się duże dawki – wskazane jest okresowe kontrolowanie czynności nerek oraz układu krwiotwórczego.

Podawanie antybiotyków może być przyczyną nadmiernego rozwoju niewrażliwych bakterii lub grzybów. W przypadku pojawienia się nowych zakażeń bakteryjnych lub zakażeń grzybiczych podczas leczenia penicyliną, lek należy natychmiast odstawić i wdrożyć odpowiednie leczenie.

Antybiotyki o szerokim zakresie działania przeciwbakteryjnego (np. penicyliny, cefalosporyny, makrolidy) mogą niekiedy wywoływać rzekomobłoniaste zapalenie jelit. Zaburzenia prawidłowej flory bakteryjnej w jelitach umożliwiają namnożenie się pałeczki *Clostridium difficile*, której toksyny wywołują objawy kliniczne rzekomobłoniastego zapalenia jelit. Dlatego pacjenci, u których biegunka wystąpiła podczas stosowania antybiotyku lub wkrótce po jego odstawieniu nie powinni sami jej leczyć, lecz zwrócić się do lekarza. W przypadku stwierdzenia rzekomobłoniastego zapalenia jelit konieczne jest niezwłoczne przerwanie podawania leku i zastosowanie odpowiedniego leczenia. W lżejszych przypadkach wystarcza zwykle odstawienie leku, w cięższych podaje się doustnie metronidazol lub wankomycynę. Przeciwwskazane jest podawanie leków hamujących perystaltykę jelit lub innych działających zapierająco.

Benzylopenicylinę benzatynową należy podawać z dużą ostrożnością, by uniknąć podania leku bezpośrednio do tętnicy lub w jej bezpośrednie sąsiedztwo lub w okolicę nerwów. Wstrzyknięcie takie grozi poprzecznym zapaleniem nerwu z trwałym niedowładem lub martwicą tkanek miękkich, odcinków kończyn dystalnych do miejsca wstrzyknięcia, co niekiedy może prowadzić do amputacji.

Reakcja Jarisch-Herxheimera - reakcja ta występuje na skutek bakteriolizy i objawia się gorączką, uczuciem ogólnego rozbicia oraz bólem głowy. Najczęściej występuje podczas leczenia wczesnej kiły. Pojawienie się powyżej opisanych objawów w leczeniu wczesnej kiły nie stanowi zagrożenia. U pacjentów w późnym stadium choroby ze zmianami narządowymi reakcja Jarisch-Herxheimera występuje bardzo rzadko, ale pojawienie się jej w tym stadium może spowodować zaostrzenie choroby i w konsekwencji przyczynić się do ciężkich powikłań.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Probenecyd zwiększa stężenie oraz przedłuża okres półtrwania leku w surowicy krwi.

Podawanie penicyliny z lekami o działaniu bakteriostatycznym (erytromycyna, tetracykliny) może zmniejszać bakteriobójcze działanie penicylin.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Benzylopenicylinę benzatynową można podawać w ciąży jedynie w przypadku zdecydowanej konieczności.

Karmienie piersią

Benzylopenicylina w niewielkich ilościach przenika do mleka matki, dlatego podczas jej podawania kobietom w okresie karmienia piersią należy zachować ostrożność.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Brak danych dotyczących wpływu leku na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu. Należy jednak pamiętać, że u niektórych pacjentów mogą wystąpić działania niepożądane osłabiające zdolność prowadzenia pojazdów, np. zaburzenia widzenia, senność, splątanie, omamy.

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane po podaniu benzylopenicyliny benzatynowej występują z częstością nieznaną (nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zakażenia i zarażenia pasożytnicze

Zakażenia drożdżakami z rodzaju *Candida*.

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Neutropenia, eozynofilia, trombocytopenia, niedokrwistość hemolityczna, limfadenopatia.

Zaburzenia układu immunologicznego

Niekiedy dreszcze, gorączka, bóle mięśni; ostre reakcje alergiczne, w tym wstrząs anafilaktyczny, objawy choroby posurowiczej, obrzęk naczynioruchowy, występują rzadko i dotyczą z reguły pacjentów uczulonych na wiele alergenów lub u których występuje astma oskrzelowa, nieżyt naczynioruchowy błony śluzowej nosa, pokrzywka.

Reakcja Jarisch-Herxheimera (patrz punkt 4.4).

W razie wystąpienia którejkolwiek z powyżej przedstawionych reakcji należy natychmiast odstawić produkt i zastosować odpowiednie leczenie (patrz punkt 4.4).

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Pokrzywka, świąd, rumień, uogólnione zapalenie skóry (w razie wystąpienia którejkolwiek z tych reakcji należy natychmiast odstawić produkt i zastosować odpowiednie leczenie); obfite poty.

Zaburzenia układu nerwowego

Ból głowy, pobudzenie, drżenie, senność, splątanie, zaburzenia snu, poprzeczne zapalenie rdzenia, śpiączka, omamy, uczucie lęku przed śmiercią (zespół Hoignè), neuropatia.

Zaburzenia oka

Nieostre widzenie, ślepotą.

Zaburzenia serca

Zaburzenia rytmu serca, zatrzymanie pracy serca.

Zaburzenia naczyniowe

Spadek ciśnienia krwi.

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Zaburzenia oddychania aż do bezdechu, hipoksja.

Zaburzenia żołądka i jelit

Nudności, wymioty, rzekomobłoniaste zapalenie jelit (patrz punkt 4.4).

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Przemijające zwiększenie aktywności fosfatazy alkalicznej i aminotransferaz.

Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej

Bóle stawowe, zaostrzenie zapalenia stawów, zapalenie okostnej, mioliza, rabdomioliza.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Pęcherz neurogeny, krwimocz, nefropatia, niewydolność nerek, bolesny wzwód, impotencja, zwiększenie stężenia mocznika i kreatyniny w surowicy.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Ból, zaczerwienienie, podrażnienie w miejscu wstrzyknięcia; po wielokrotnych podaniach w ten sam mięsień może pojawić się zwłóknienie oraz atrofia.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C; 02-222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

e-mail: ndl@urpl.gov.pl

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Przedawkowanie penicyliny może doprowadzić do podrażnienia ośrodkowego układu nerwowego i wystąpienia drgawek. W przypadku przedawkowania lek należy natychmiast odstawić i zastosować leczenie objawowe oraz monitorować podstawowe czynności życiowe (oddech, tętno, ciśnienie krwi). Benzylopenicylina może być usunięta z organizmu podczas hemodializy.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwbakteryjne do stosowania ogólnego, penicyliny wrażliwe na β -laktamazy.

Kod ATC: J01CE08

Benzylopenicylina benzatynowa jest antybiotykiem z grupy β -laktamów. Jest to pochodna penicyliny benzylowej o przedłużonym działaniu.

Bakteriobójczy mechanizm działania penicyliny polega na hamowaniu biosyntezy ściany komórkowej młodych, namnażających się komórek bakterii. W wyniku blokowania aktywności transpeptydazy penicylina hamuje tworzenie wiązań pomiędzy pentapeptydami mukopolisacharydu ściany komórkowej bakterii. W dalszym etapie, na skutek aktywacji hydrolaz komórkowych dochodzi do lizy komórki bakteryjnej.

Benzylopenicylina benzatynowa jest wrażliwa na działanie β -laktamazy.

Zakres działania przeciwbakteryjnego penicyliny benzatynowej *in vitro* obejmuje:

paciorkowce (z wyjątkiem *Enterococcus*), w tym *Streptococcus pneumoniae*, gronkowce (*Staphylococcus* spp., tylko szczepy β -laktamazo-ujemne), *Neisseria gonorrhoeae* (tylko szczepy β -laktamazo-ujemne), *Neisseria meningitidis*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium* spp., *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes*, *Leptospira* spp., *Treponema pallidum* (bardzo duża wrażliwość na bakteriobójcze działanie benzylopenicyliny).

Oporność na działanie benzylopenicyliny wykazują gronkowce wytwarzające penicylinazę (90-95% wszystkich szczepów).

Benzylopenicylina nie wnika do wnętrza komórki, a zatem nie działa na drobnoustroje wewnątrzkomórkowe.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Benzylopenicylina benzatynowa po podaniu domięśniowym wchłania się powoli i bardzo wolno ulega hydrolizie w surowicy krwi do benzylopenicyliny. Maksymalne stężenie penicyliny w surowicy występuje po upływie 24 godzin. Stężenie leku we krwi jest mniejsze, niż po podaniu odpowiadającej dawki benzylopenicyliny, ale utrzymuje się do 4 tygodni.

Zastosowanie lecytyny jako substancji pomocniczej w preparatach benzylopenicyliny benzatynowej polepsza zawieszanie preparatu w roztworze do wstrzykiwań, nie wpływając przy tym na właściwości farmakokinetyczne i farmakologiczne benzylopenicyliny.

Z białkami osocza wiąże się w około 60%.

Wydalana jest głównie przez nerki w mechanizmie wydzielenia kanalikowego.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Brak informacji o przeprowadzeniu długoterminowych badań na zwierzętach dotyczących mutagennych i kancerogennych właściwości benzylopenicyliny.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Nie zawiera.

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Benzylopenicylina wykazuje niezgodność po zmieszaniu z: aminoglikozydami, amfoterycyną B, cefalotyną, metronidazolem, wankomycyną, fenytoiną i aminofiliną.

Benzylopenicyliny nie należy mieszać w jednej strzykawce z innymi lekami.

6.3 Okres ważności

Przed otwarciem fiolki

3 lata

Po otwarciu fiolki i przygotowaniu zawiesiny

Zawiesinę benzylopenicyliny benzatynowej należy zużyć natychmiast po sporządzeniu.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C. Chronić od światła.

Informacje dotyczące sporządzonej zawiesiny - patrz punkt 6.3.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Fiolka z bezbarwnego szkła o pojemności 20 ml, zamknięta korkiem gumowym i kapslem aluminiowym w tekturowym pudełku.

Wielkość opakowania: 1 fiolka

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

Zawiesinę benzylopenicyliny benzatynowej do wstrzykiwań domięśniowych należy przygotować tuż przed podaniem dodając do fiolki zawierającej 1 200 000 j.m. około 8 ml wody do wstrzykiwań lub 0,9% roztworu chlorku sodu.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Tarchomińskie Zakłady Farmaceutyczne „Polfa” Spółka Akcyjna
ul. A. Fleminga 2
03-176 Warszawa

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr R/3107

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 23 czerwca 1996 r.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 11 kwietnia 2014 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO