

Состав и форма выпуска

Порошок для приготовления суспензии для в/м введения белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

1 флакон содержит *активное вещество* бензатина бензилпенициллин 1.2 млн. ЕД.

Вспомогательные вещества: симетикон, маннит, повидон, буфер цитратный изотонический.

Фармакологическое действие

Антибиотик группы биосинтетических пенициллинов. В основе механизма противомикробного действия лежит нарушение синтеза пептидогликана - мукопептида клеточной оболочки, что приводит к ингибированию синтеза клеточной стенки микроорганизма, подавлению роста и размножения бактерий.

Активен в отношении грамположительных бактерий, грамотрицательных кокков, *Actinomyces spp.*, *Spirochaetaceae*.

Неактивен в отношении штаммов *Staphylococcus spp.*, продуцирующих пенициллиназу.

Оказывает пролонгированное действие.

Фармакокинетика

При в/м введении медленно всасывается из места инъекции, обеспечивая пролонгированное действие. Плохо проникает через ГЭБ. Метаболизируется путем гидролиза до бензилпенициллина. Вследствие длительной абсорбции, бензилпенициллин обнаруживается в моче в течение 12 недель после введения разовой дозы.

Показания к применению

Лечение инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами:

- сифилис (в качестве монотерапии);
- фрамбезия, пинта;
- острый тонзиллит, скарлатина.

Профилактика инфекционно-воспалительных заболеваний, вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами:

- повторные атаки после острой ревматической лихорадки;
- рецидивы рожи;
- раневая инфекция;
- инфекции при тонзиллэктомии или после экстракции зубов.

Режим дозирования

Препарат вводят глубоко в/м. Нельзя вводить в/в!

Для приготовления суспензии для в/м введения во флакон следует ввести 5 мл воды для инъекций в аспетических условиях. Перед применением тщательно перемешать, прокатывая флакон между ладонями рук, стараясь избегать образования обильной пены. Приготовленная суспензия может храниться в холодильнике не более 24 ч.

При *сифилисе* взрослым для превентивного лечения назначают по 2.4 млн.МЕ однократно; при *первичном сифилисе* препарат назначают в дозе 2.4 млн.МЕ 2 раза по 1 в/м инъекции с интервалом 7 дней; при *вторичном и раннем скрытом сифилисе* - в дозе 2.4 млн.МЕ 3 раза по 1 в/м инъекции с интервалом 7 дней.

Для *профилактической терапии* ребенка, *рожденного нелеченой матерью, больной сифилисом*, препарат назначают в дозе 5000 МЕ/кг массы тела по 1 в/м инъекции с интервалом 7 дней. Курс - 3 инъекции. Дозу следует разделить пополам и ввести в разные ягодички.

Для *профилактической терапии* ребенка в связи с недостаточным лечением матери или серорезистентностью - по 1 инъекции в/м с интервалом 7 дней. Курс - 2 инъекции.

Для *лечения фрамбезии и пинты (эндемических трепонематозов)* взрослым - по 2.4 млн.МЕ; детям назначают однократно по 1.2 млн.МЕ.

При *прочих инфекциях (острый тонзиллит, скарлатина, рожа, раневые инфекции в острой фазе)* взрослым назначают 1.2 млн.МЕ или 2.4 млн.МЕ 1 раз в неделю; детям до 12 лет - по 600 тыс.МЕ каждые 3 дня или 1.2 млн.МЕ каждые 2-4 недели в зависимости от тяжести инфекции.

Для *профилактики повторных атак после перенесенной острой ревматической лихорадки* взрослым и подросткам назначают по 2.4 млн.МЕ 1 раз в 3 недели;

детям с массой тела более 25 кг - 1.2 млн.МЕ 1 раз в 3 недели;

детям с массой тела менее 25 кг - по 600 тыс.МЕ 1 раз в 3 недели. Длительность профилактики устанавливают индивидуально.

При назначении препарата пациентам с нарушениями функции почек требуется коррекция режима дозирования в зависимости от величины клиренса креатинина. При КК от 10 до 50 мл/мин вводят 75% рекомендуемой суточной стандартной дозы; при КК менее 10 мл/мин - 25-50%.

Для *профилактики рецидивов рожи* взрослым при *сезонных рецидивах* назначают по 2.4

млн.МЕ 1 раз в 4 недели на протяжении 3-4 мес ежегодно; при *частых рецидивах* - 2.4 млн.МЕ 1 раз в 3-4 недели на протяжении 2-3 лет; детям - по 600 тыс.МЕ 1 раз в 2 недели или по 1.2 млн.МЕ каждые 3-4 недели.

Для профилактики инфекций после тонзиллэктомии или экстракции зубов взрослым - по 2.4 млн.МЕ; детям - по 600 тыс.МЕ. Препарат вводят каждые 7-14 дней до полного выздоровления.

Побочные действия

Аллергические реакции:

- крапивница, лихорадка, боли в суставах, ангионевротический отек, эксфолиативный дерматит, многоформная эритема, затруднение дыхания, анафилаксия.

При терапии сифилиса из-за высвобождения эндотоксинов может развиваться реакция Яриша-Герскгеймера.

Со стороны системы кроветворения:

- обратимые анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы:

- стоматит, глоссит, тошнота, рвота, диарея, кандидоз;
- редко - умеренное повышение активности печеночных трансаминаз в сыворотке крови;
- в отдельных случаях - псевдомембранозный колит.

Прочие:

- редко - острый интерстициальный нефрит;
- при длительном применении возможно развитие суперинфекции устойчивыми микроорганизмами и грибами.

Применение бета-лактамовых антибиотиков в высоких дозах может вызвать (особенно при почечной недостаточности) развитие энцефалопатии (нарушение сознания, двигательные расстройства, судороги).

У детей возможно развитие местных реакций на введение препарата.

Противопоказания к применению

- повышенная чувствительность к бета-лактамовым антибиотикам (пенициллам и цефалоспорином).

С осторожностью следует назначать при склонности к аллергическим реакциям, псевдомембранозном колите, почечной недостаточности.

Применение при беременности и кормлении грудью

Применение препарата при беременности возможно только в случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости назначения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Бензатина бензилпенициллин в небольших количествах проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком.

Применение при нарушениях функции почек

С осторожностью следует назначать при почечной недостаточности.

Особые указания

Нельзя вводить п/к, в/в, эндолюмбально, а также в полости тела.

При случайном внутрисосудистом введении могут отмечаться преходящее чувство тревоги и нарушение зрения (синдром Уанье). Для того, чтобы избежать такого введения, следует перед в/м введением провести аспирацию с целью выявления возможного попадания иглы в сосуд.

Если при лечении венерических заболеваний имеется подозрение на сифилис, то перед началом терапии и затем в течение 4 мес необходимо проведение микроскопических и серологических исследований.

В связи с возможностью развития грибковых заболеваний на фоне терапии препаратом следует назначать витамины группы В и витамин С, а при необходимости - нистатин и леворин.

При назначении препарата пациентам, соблюдающим диету с ограничением потребления поваренной соли, следует учитывать, что содержание натрия на 600 тыс.МЕ препарата составляет 5.5 мг или 0.24 ммоль.

При появлении любых аллергических реакций необходимо прекратить введение препарата и назначить соответствующее лечение. Могут наблюдаться тяжелые аллергические реакции (вплоть до развития анафилактического шока). При сборе анамнеза следует обращать внимание на переносимость проводимой ранее терапии пенициллинами. При указании в анамнезе на повышенную чувствительность к пенициллину препарат категорически противопоказан.

В 5-10% случаях отмечается перекрестная аллергическая реакция между пенициллинами и цефалоспорины. В связи с этим при указании в анамнезе на аллергические реакции на цефалоспорины противопоказано назначение пенициллинов.

Необходимо учитывать, что применение препарата в недостаточных дозах или слишком раннее прекращение терапии часто приводит к появлению резистентных штаммов возбудителей.

Передозировка

Данные по передозировке препарата Ретарпен не предоставлены.

Лекарственное взаимодействие

При одновременном применении бензатина бензилпенициллина с НПВС (индометацином, фенилбутазоном, салицилатами), аллопуринолом, пробенецидом следует иметь в виду возможность конкурентного ингибирования выведения препаратов из организма.

При одновременном применении с бактерицидными антибиотиками (цефалоспорины, циклосерин, ванкомицин, рифампицин, аминогликозиды) отмечается синергизм действия; с бактериостатическими - (макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины) - антагонизм.

Повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (подавляя кишечную микрофлору, снижает протромбиновый индекс); снижает эффективность пероральных контрацептивов, лекарственных средств, в процессе биотрансформации которых образуется пара-аминобензойная кислота, этинилэстрадиола (повышается вероятность возникновения прорывных кровотечений).

При одновременном применении с аллопуринолом повышается риск развития аллергических реакций (кожной сыпи).

Условия хранения препарата

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности препарата

4 года

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.