

Các thuốc ức chế mạnh CYP3A4: Ketoconazol khi dùng cùng với bedaquilin có thể làm tăng AUC của bedaquilin lên tới 22%. Ảnh hưởng đến hiệu lực điều trị của bedaquilin có thể rõ ràng hơn nếu điều trị kéo dài phối hợp bedaquilin với ketoconazol hoặc các thuốc ức chế CYP3A4 khác (ciprofloxacin, erythromycin, fluconazol, clarithromycin, ketoconazol, ritonavir), do đó tránh dùng phối hợp. Nếu cần thiết phải dùng bedaquilin cùng với các thuốc ức chế CYP3A4 thì cần phải theo dõi điện tâm đồ và transaminase thường xuyên.

Các thuốc chống lao isoniazid, pyrazinamid, ethambutol, kanamycin, ofloxacin, cycloserin không ảnh hưởng đến dược động học của bedaquilin khi dùng phối hợp trong phác đồ điều trị lao.

Các thuốc kháng virus lopinavir/ritonavir khi dùng phối hợp với bedaquilin có thể làm tăng AUC của bedaquilin lên gấp 2 lần. Các thuốc kháng virus loại ritonavir-boosted ức chế HIV protease cũng làm tăng AUC của bedaquilin. Efavirenz là thuốc cảm ứng CYP3A4 mức độ trung bình nên làm giảm AUC và tác dụng điều trị của bedaquilin. Nevirapin không ảnh hưởng đến dược động học của bedaquilin.

Các thuốc làm khoảng QT kéo dài: Ketoconazol, fluoroquinolon, các macrolid và clofazimin nếu dùng cùng bedaquilin làm tăng khoảng QT lớn hơn so với không sử dụng phối hợp.

Quá liều và xử trí

Chưa ghi nhận báo cáo về quá liều bedaquilin.

Xử trí: Cho đến nay chưa có kinh nghiệm điều trị quá liều. Các xét nghiệm cơ bản hỗ trợ đánh giá chức năng sống và theo dõi điện tâm đồ (khoảng QT) cần được tiến hành nếu có quá liều. Loại bỏ lượng bedaquilin chưa được hấp thu bằng rửa dạ dày hoặc dùng than hoạt. Do bedaquilin gắn với protein huyết tương tỷ lệ cao nên không loại bỏ được bedaquilin trong huyết tương bằng lọc máu.

Cập nhật lần cuối: 2020.

BENAZEPRIL

Tên chung quốc tế: Benazepril.

Mã ATC: C09AA07.

Loại thuốc: Thuốc ức chế men chuyển angiotensin.

Dạng thuốc và hàm lượng

Dạng đơn thành phần: Viên nén bao phim chứa 5 mg; 10 mg; 20 mg; 40 mg benazepril hydroclorid.

Dạng phối hợp:

Viên nang phối hợp benazepril với amlodipin (tỷ lệ benazepril/amlodipin là 10 mg/2,5 mg; 10 mg/5 mg; 20 mg/5 mg; 20 mg/10 mg; 40 mg/5 mg; 40 mg/10 mg).

Viên nén bao phim phối hợp benazepril với hydrochlorothiazid (tỷ lệ benazepril/hydrochlorothiazid là 5 mg/6,25 mg; 10 mg/12,5 mg; 20 mg/12,5 mg).

Dược lực học

Benazepril là dạng ethylester của benazeprilat chưa có tác dụng. Khi vào cơ thể benazepril bị thủy phân ở gan để tạo thành benazeprilat ức chế được men chuyển angiotensin, ức chế bradykininase và kininase II.

Benazepril có tác dụng giãn mạch, giảm sức cản ngoại vi, hạ huyết áp do ức chế chuyển angiotensin I thành angiotensin II, là chất co mạch mạnh, kích thích tổng hợp và bài tiết aldosteron và là yếu tố tăng sinh đối với tim (gây phì đại cơ tim).

Benazepril còn làm giảm thoái giáng bradykinin, một chất gây giãn mạch trực tiếp và có liên quan đến sự tạo thành prostaglandin. Đây có thể là lý do các thuốc ức chế men chuyển có tác dụng ngay cả

đối với những trường hợp có nồng độ renin thấp.

Thuốc ức chế men chuyển làm giảm tiền gánh và hậu gánh ở những bệnh nhân suy tim, làm giảm tái cấu trúc thất trái, một hậu quả thường thấy sau nhồi máu cơ tim, do đó hiệu quả trong điều trị suy tim sung huyết, kể cả suy tim sau nhồi máu.

Các thuốc ức chế men chuyển angiotensin còn làm giảm protein niệu trên những bệnh nhân có bệnh cầu thận.

Các thuốc ức chế men chuyển được dùng để điều trị tăng huyết áp, suy tim, cải thiện tỷ lệ sống sót do nhồi máu cơ tim, cũng như phòng các biến cố tim mạch trên bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ.

Thuốc cũng được dùng trong bệnh thận đái tháo đường và thường được dùng ở đường uống. Ở một số bệnh nhân có thể gặp tình trạng tụt huyết áp khi mới bắt đầu điều trị, vì thế liều đầu tiên nên được uống ở tư thế nằm. Nếu có thể, nên ngừng các liệu pháp lợi tiểu trước và sau khi dùng thuốc nếu cần thiết. Với những bệnh nhân suy tim đang dùng thuốc lợi tiểu quai, hiện tượng giảm huyết áp liều đầu nghiêm trọng thường xảy ra khi dùng phối hợp với một thuốc ức chế men chuyển angiotensin. Tuy nhiên, ngừng tạm thời thuốc lợi tiểu có thể gây phù phổi cấp trở lại. Chính vì vậy, điều trị bằng thuốc ức chế men chuyển trong những trường hợp này nên bắt đầu bằng liều thấp và cần được giám sát chặt chẽ.

Tác dụng điều trị tăng huyết áp: Thuốc làm giảm sức cản động mạch ngoại vi và không tác động lên cung lượng tim. Tưới máu ở thận được duy trì hoặc tăng lên và mức lọc cầu thận thường không thay đổi. Nếu gặp hạ áp nhanh ở bệnh nhân tăng huyết áp rất cao và kéo dài, mức lọc của cầu thận có thể giảm nhất thời, dẫn đến tăng nhất thời creatinin và urê trong huyết thanh. Ở bệnh nhân có kèm theo phì đại tâm thất trái, điều trị với thuốc ức chế men chuyển angiotensin trong vòng 2 - 3 tháng thì kích thước tim bệnh nhân có thể trở về bình thường.

Tác dụng trên bệnh nhân suy tim: Trong suy tim, thuốc ức chế men chuyển làm giảm áp lực đổ đầy (tiền gánh), giảm sức cản động mạch ngoại vi, làm tăng cung lượng và khả năng hoạt động của tim. Những tác dụng này đến nhanh sau khi bắt đầu điều trị. Lưu lượng máu ở thận có thể tăng tới 60%. Thuốc ức chế men chuyển có thể làm giảm bệnh cơ tim, vì angiotensin II là yếu tố tăng sinh chính của cơ tim.

Thuốc ức chế men chuyển angiotensin có tác dụng tốt ở người suy tim có bệnh cơ tim và rối loạn chức năng tâm thu thất trái. Trừ khi có chống chỉ định, thuốc ức chế men chuyển angiotensin có thể dùng cho tất cả những người có suy tâm thu thất trái (phân số tổng máu ≤ 35%). Sự ức chế men chuyển angiotensin ở những người này có thể ngăn ngừa hoặc làm chậm tiến triển suy tim, làm giảm tỷ lệ đột tử và nhồi máu cơ tim. Trong rối loạn chức năng tâm thu, thuốc ức chế men chuyển angiotensin có thể làm giảm sức cản của mạch ngoại vi (hậu gánh), huyết áp mao mạch phổi (tiền gánh), và sức cản của mạch máu phổi, và làm tăng cung lượng tim và tăng dung nạp với hoạt động thể lực. Thuốc cũng làm giảm giãn tâm thất và có chiều hướng phục hồi tim trở về hình dạng bình thường.

Tác dụng trên người có bệnh thận do đái tháo đường: Ở người đái tháo đường, thuốc ức chế men chuyển angiotensin làm giảm bài tiết protein trong nước tiểu và làm chậm sự tiến triển của bệnh. Thuốc có thể làm giảm tỷ lệ tử vong và ngăn chặn tiến triển suy tim ở người nhồi máu cơ tim, có huyết động ổn định.

Dược động học

Các esterase phân cắt phần ester của benazepril hydroclorid (tiền chất) ở gan tạo thành chất chuyển hóa có hoạt tính là benazeprilat. Benazepril được hấp thu nhanh, nhưng không hoàn toàn (37%) sau khi uống (không bị ảnh hưởng bởi thức ăn). Benazepril chuyển hóa gần như hoàn toàn, tạo thành benazeprilat và những chất liên hợp glucuronid của benazepril và benazeprilat, các chất chuyển

hóa này thải trừ cả trong nước tiểu và mật; nồng độ đỉnh của benazepril và benazeprilat trong huyết tương đạt trong khoảng tương ứng 0,5 - 1 giờ và 1 - 2 giờ. Sau khi dùng một liều đơn, thời gian tác dụng của benazepril kéo dài khoảng 24 giờ. Trừ ở phổi, benazeprilat không tích lũy ở mô. Bài tiết trong nước tiểu (thuốc mẹ): < 1%. Tỷ lệ gắn với protein huyết tương: 97%. Độ thanh thải: 0,3 - 0,4 ml/phút/kg. Thể tích phân bố: 0,12 lít/kg.

Chỉ định

Dùng một mình hoặc phối hợp với các thuốc khác (như thuốc lợi tiểu thiazid) để điều trị tăng huyết áp. Dùng kết hợp với thuốc lợi tiểu và digitalis để điều trị suy tim sung huyết.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với benazepril hoặc các thuốc ức chế men chuyển angiotensin khác.

Thận trọng

Cũng giống các thuốc ức chế men chuyển angiotensin khác, benazepril có thể gây giảm huyết áp, đặc biệt trên những bệnh nhân giảm thể tích tuần hoàn hoặc mất Na⁺ do dùng thuốc lợi tiểu lâu dài, chế độ ăn giảm muối, thẩm tách máu, tiêu chảy hoặc nôn. Giảm huyết áp có thể rõ trên những bệnh nhân suy tim sung huyết có thiếu niệu và/hoặc urê huyết cao, đôi khi dẫn đến suy thận cấp và tử vong. Do đó khi dùng benazepril cho bệnh nhân suy tim, cần theo dõi chặt chẽ trong vòng ít nhất 2 tuần đầu điều trị hoặc khi phối hợp với thuốc lợi niệu hoặc khi thay đổi liều của một trong hai thuốc này. Khi giảm huyết áp xuất hiện, cần đặt bệnh nhân ở tư thế nằm ngửa và truyền tĩnh mạch dung dịch natri clorid 0,9%. Vẫn tiếp tục dùng được benazepril khi thể tích máu và tuần hoàn được hồi phục. Trong phẫu thuật lớn, hoặc khi gây mê với thuốc gây mê hạ huyết áp, thuốc ức chế men chuyển angiotensin ngăn cản tạo angiotensin II sau giải phóng renin. Điều này gây hạ huyết áp mạnh, có thể hiệu chỉnh dễ dàng bằng tăng thể tích huyết tương.

Benazepril có thể gây vàng da và làm tăng rõ enzym gan, dẫn đến hoại tử gan cấp và tử vong. Do đó, cần dùng thận trọng trên những bệnh nhân có bệnh lý về gan.

Thuốc ức chế hệ Renin-Angiotensin-Aldosteron có thể gây suy giảm chức năng thận, thể hiện bằng sự tăng thoáng qua BUN và nồng độ creatinin huyết thanh, đặc biệt trên những bệnh nhân tăng huyết áp có kèm hẹp động mạch thận một bên hoặc hai bên, bệnh nhân đã có suy thận từ trước hoặc dùng cùng thuốc lợi tiểu. Tác dụng này mất đi khi ngừng dùng thuốc ức chế men chuyển và/hoặc thuốc lợi tiểu. Cần giám sát chặt chẽ chức năng thận trong thời gian đầu điều trị bằng thuốc ức chế men chuyển cũng như theo dõi định kỳ sau đó.

Ở bệnh nhân giảm chức năng thận đơn thuần hoặc kết hợp với bệnh mô liên kết, cần theo dõi số lượng bạch cầu trong 3 tháng đầu. Cần báo cho bệnh nhân phải đến khám bác sĩ ngay khi có nhiễm khuẩn, đau họng, sốt có thể do mất bạch cầu hạt. Nguy cơ này tăng lên khi có bệnh mô liên kết, sử dụng thuốc giảm miễn dịch, hoặc giảm chức năng thận.

Thời kỳ mang thai

Dùng thuốc ức chế men chuyển angiotensin trong ba tháng giữa và ba tháng cuối của thai kỳ gây tăng tỷ lệ tử vong và tỷ lệ mắc bệnh ở trẻ sơ sinh, dùng thuốc trong 3 tháng đầu làm tăng nguy cơ gây dị tật cho thai. Đã có trường hợp bị ít nước ối, hạ huyết áp và thiếu niệu hoặc vô niệu ở trẻ sơ sinh. Do đó, không dùng thuốc ức chế men chuyển angiotensin trong thời kỳ mang thai.

Thời kỳ cho con bú

Benazepril và benazeprilat phân bố trong sữa mẹ. Trẻ nhỏ bú sữa nhận được dưới 0,1% liều dùng của mẹ tính theo mg/kg benazepril

và benazeprilat. Có thể dùng benazepril trong thời kỳ cho con bú.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

ADR của benazepril thường nhẹ và nhất thời không có mối liên quan giữa ADR và tuổi, thời gian điều trị hoặc tổng liều trong phạm vi 2 - 80 mg. Khi dùng benazepril, cần lưu ý là một thuốc ức chế men chuyển khác, captopril, đã gây mất bạch cầu hạt, đặc biệt ở bệnh nhân giảm chức năng thận hoặc tổn thương mạch máu trong bệnh tạo keo như lupus ban đỏ lan tỏa hoặc bệnh xơ cứng bì. Không có đủ tư liệu để chứng minh benazepril không có ADR này.

Thường gặp

Hô hấp: ho nhất thời.

TKTW: nhức đầu, chóng mặt, mệt mỏi, ngủ gà.

Tiêu hóa: buồn nôn.

Ít gặp

Tim mạch: hạ huyết áp, nhịp tim nhanh, phù mạch.

TKTW: lo âu, mất ngủ, tình trạng kích động.

Da: ban, hội chứng Stevens-Johnson, ban đỏ đa dạng, mẫn cảm với ánh sáng.

Nội tiết và chuyển hóa: tăng kali huyết.

Huyết học: mất bạch cầu, giảm tiểu cầu.

Tiêu hóa: táo bón, viêm dạ dày, nôn, đại tiện máu đen.

Gan: vàng da.

Sinh dục - tiết niệu: liệt dương, nhiễm khuẩn đường niệu.

Thần kinh - cơ xương: tăng trương lực, dị cảm, đau khớp, viêm khớp, đau cơ, yếu cơ.

Hô hấp: viêm phế quản, khó thở, viêm xoang, hen.

Khác: ra mồ hôi.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Ban, mày đay thường mất đi khi giảm liều hoặc ngừng thuốc hoặc dùng thuốc kháng histamin. Ho và vàng da thường mất đi trong vài ngày sau khi ngừng benazepril.

Khi có phù mạch kèm theo sưng ở mắt, niêm mạc miệng, môi và các chi, ngừng thuốc và không cần các biện pháp điều trị khác, mặc dù thuốc kháng histamin có thể làm giảm các triệu chứng này. Có thể điều trị phù mạch ở lưỡi, thanh môn hoặc thanh quản như sau: Ngừng thuốc ức chế men chuyển angiotensin và cho bệnh nhân vào viện; tiêm dưới da hoặc tiêm trương hợp phải tiêm tĩnh mạch adrenalin; tiêm tĩnh mạch diphenhydramin hydroclorid; dùng hydrocortison đường tĩnh mạch.

Liều lượng và cách dùng

Tăng huyết áp

Người lớn:

Khởi đầu: Uống 10 mg, ngày một lần.

Duy trì: Uống 20 - 40 mg, ngày một lần hoặc chia thành 2 lần.

Có thể tăng lên 80 mg/ngày nếu thấy cần thiết. Không vượt quá 80 mg/ngày.

Đối với trẻ từ 6 tuổi trở lên: Liều khởi đầu cho điều trị tăng huyết áp là 0,2 mg/kg/ngày (có thể tới 10 mg/ngày). Liều duy trì 0,6 mg/kg/ngày.

Chưa có đủ bằng chứng về tính an toàn và liều khuyến cáo cho trẻ dưới 6 tuổi hoặc trẻ có độ thanh thải creatinin dưới 30 ml/phút.

Ghi chú: Dùng liều khởi đầu 5 mg cho người suy thận (độ thanh thải creatinin dưới 30 ml/phút/1,73 m²) hoặc người đang sử dụng thuốc lợi tiểu. Tốt nhất là nên ngừng thuốc lợi tiểu 2 - 3 ngày trước khi bắt đầu dùng benazepril và sau đó cho dùng lại nếu thấy cần thiết để đề phòng hạ huyết áp quá mức. Liều duy trì không quá 40 mg/ngày cho người suy thận.

Suy tim sung huyết

Dùng liều khởi đầu 2,5 mg, ngày một lần, sau đó điều chỉnh liều tùy theo đáp ứng của bệnh nhân tới tối đa 20 mg một ngày.

Tương tác thuốc

Thuốc chống đái tháo đường: Dùng đồng thời benazepril với insulin hoặc các thuốc chống đái tháo đường đường uống khác có thể gây giảm glucose huyết.

Thuốc lợi tiểu: Dùng benazepril cùng với thuốc lợi tiểu, có thể gây giảm huyết áp quá mức, nhất là khi mới bắt đầu điều trị bằng benazepril. Nên ngừng thuốc lợi tiểu 2 - 3 ngày trước khi bắt đầu dùng benazepril và sau đó cho dùng lại nếu thấy cần thiết.

Thuốc gây hạ huyết áp: Dùng đồng thời với thuốc ức chế men chuyển angiotensin có thể gây tác dụng hạ huyết áp cộng hợp; thuốc điều trị tăng huyết áp gây giải phóng renin hoặc ảnh hưởng đến hoạt động giao cảm có tác dụng cộng hợp lớn nhất.

Thuốc chống viêm không steroid: Các thuốc chống viêm không steroid (như naproxen, phenylbutazon, acid mefenamic, indomethacin, diclofenac, ibuprofen...) có thể làm giảm tác dụng hạ áp của thuốc ức chế men chuyển angiotensin do ức chế tổng hợp prostaglandin ở thận và/hoặc gây giữ natri và dịch.

Thuốc đồng (chủ) vận giao cảm: Dùng đồng thời, gây giảm tác dụng chống tăng huyết áp của thuốc ức chế men chuyển angiotensin.

Thuốc làm tăng nồng độ kali huyết: Thuốc lợi tiểu giữ kali, các thuốc bổ sung kali hoặc các thuốc làm tăng nồng độ kali huyết khác khi dùng cùng với benazepril có thể tăng nguy cơ tăng kali huyết.

Lithi: Thuốc ức chế men chuyển có thể làm tăng nồng độ lithi trong máu và gây ngộ độc lithi khi dùng kèm.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Giảm huyết áp nhẹ, nhịp tim chậm; tăng kali huyết, suy thận có thể xảy ra ngay cả với liều điều trị, đặc biệt ở người có hẹp động mạch thận.

Xử trí: Tăng thể tích huyết tương bằng truyền dịch tĩnh mạch và đặt bệnh nhân ở tư thế Trendelenburg để hiệu chỉnh sự hạ huyết áp. Có thể loại trừ lượng nhỏ benazeprilat bằng thẩm tách máu. Sau đó tiến hành điều trị triệu chứng và hỗ trợ.

Cập nhật lần cuối: 2017.

**BENZATHIN PENICILIN G
(Benzathin benzylpenicilin)**

Tên chung quốc tế: Benzathine benzylpenicillin.

Mã ATC: J01CE08.

Loại thuốc: Kháng sinh nhóm beta-lactam.

Dạng thuốc và hàm lượng

Bột pha tiêm: 300 000 đơn vị, 600 000 đơn vị, 1 200 000 đơn vị và 2 400 000 đơn vị penicilin G.

Dược lực học

Benzathin penicilin G có tác dụng kháng khuẩn tương tự benzylpenicilin (xem thêm trong chuyên luận Benzylpenicilin). Benzathin penicilin G là muối benzathin tetrahydrat của benzylpenicilin, được tạo thành từ phản ứng của một phân tử dibenzylethylendiamin diacetat và hai phân tử benzylpenicilin natri. Do benzathin benzylpenicilin có độ hòa tan thấp, sau khi tiêm bắp, thuốc được dự trữ tại mô cơ, sau đó, hấp thu và thủy phân từ từ giải phóng ra benzylpenicilin. Vì vậy, thuốc có tác dụng kéo dài hơn so với benzylpenicilin. Tuy nhiên, nồng độ benzylpenicilin trong máu đạt được tương đối thấp so với khi tiêm bắp một liều tương đương các dạng muối benzylpenicilin khác như procain, natri hoặc kali. Do đó, benzathin penicilin G chỉ giới hạn sử dụng trong điều trị nhiễm khuẩn nhẹ đến trung bình và dự phòng nhiễm khuẩn gây ra bởi các vi khuẩn nhạy cảm, hoặc trong giai đoạn duy trì sau khi tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch benzylpenicilin. Để điều trị các

trường hợp nhiễm khuẩn nặng cần duy trì nồng độ benzylpenicilin ở mức cao, cần khởi đầu điều trị bằng benzylpenicilin natri hoặc kali đường tiêm.

Dược động học

Sau khi tiêm bắp liều đơn benzathin penicilin G, nồng độ tối đa của penicilin G trong huyết thanh đạt được sau 13 - 24 giờ và thường vẫn phát hiện được trong 1 - 4 tuần sau khi tiêm, tùy thuộc vào liều thuốc đã sử dụng. Nồng độ penicilin G trong huyết thanh sau 1, 14 và 32 ngày tiêm bắp liều đơn benzathin penicilin G 1 200 000 đơn vị lần lượt là 0,15; 0,03 và 0,003 đơn vị/ml. Trong trường hợp tiêm bắp benzathin penicilin G liều 1 200 000 đơn vị cho người lớn, 4 tuần một lần, nồng độ penicilin G trung bình trong huyết thanh tại ngày thứ 21 sau khi tiêm đạt được ít nhất là 0,02 microgam/ml. Tuy nhiên, đến ngày thứ 28, thuốc chỉ phát hiện được trong huyết thanh của 44% số bệnh nhân và nồng độ trên 0,02 microgam/ml chỉ đạt được ở 36% số mẫu. Ở trẻ từ 1,8 đến 10,7 tuổi, sau khi tiêm bắp liều đơn benzathin penicilin G 600 000 đơn vị (với trẻ có cân nặng dưới 27 kg) hoặc 1 200 000 đơn vị (với trẻ có cân nặng trên 27 kg), nồng độ tối đa của penicilin G trong huyết thanh đạt được sau 24 giờ và dao động trong khoảng 0,11 - 0,2 microgam/ml. Ở trẻ sơ sinh, sau khi tiêm bắp một liều đơn benzathin penicilin G 50 000 đơn vị/kg, nồng độ tối đa trong huyết thanh của penicilin G đạt được sau 24 giờ và dao động trong khoảng 0,38 - 2,1 mg/ml.

Sau khi tiêm bắp benzathin penicilin G, penicilin G được phân bố rộng khắp cơ thể, với nồng độ rất khác nhau ở các cơ quan. Nồng độ đạt được cao nhất ở thận, thấp hơn ở gan, da và ruột. Thuốc phân bố vào dịch tự do trong ổ bụng, hoạt dịch, dịch màng phổi, dịch màng trong tim, dịch tiết xoang hàm, amidan và nước bọt. Thuốc đạt nồng độ rất thấp trong dịch não tủy, kể cả khi màng não bị viêm. Penicilin G qua được nhau thai và được bài tiết vào sữa. Tỷ lệ penicilin G liên kết với protein huyết thanh khoảng 60%.

Do penicilin G được hấp thu chậm sau khi tiêm bắp benzathin penicilin G, thời gian thải trừ của penicilin G kéo dài sau khi dùng thuốc. Sau 12 tuần tiêm bắp một liều đơn benzathin penicilin G 1 200 000 đơn vị, vẫn phát hiện thấy penicilin G trong nước tiểu. Độ thanh thải qua thận của penicilin G bị giảm ở trẻ sơ sinh, trẻ nhỏ và ở bệnh nhân có suy thận. Ở người cao tuổi, thông số này cũng có thể bị giảm do khả năng bài tiết qua ống thận giảm.

Chỉ định

Benzathin penicilin G được chỉ định điều trị nhiễm khuẩn do những vi khuẩn nhạy cảm cao với penicilin G ở nồng độ thấp và kéo dài, do đặc trưng của dạng thuốc này dẫn đến nồng độ benzylpenicilin đạt được trong máu tương đối thấp:

Điều trị nhiễm khuẩn đường hô hấp trên mức độ nhẹ đến trung bình do liên cầu khuẩn *Streptococci*.

Điều trị các bệnh truyền nhiễm lây qua đường tình dục: giang mai, ghê cóc, bejel (bệnh do *Treponema pallidum* có phản ứng huyết thanh tương tự giang mai), pinta (bệnh da đốm màu do *Treponema carateum* rất nhạy cảm với penicilin).

Dự phòng tái phát sốt thấp khớp và/hoặc mùa giạt. Benzathin penicilin G cũng được dùng để dự phòng thêm cho các bệnh thấp tim, viêm cầu thận cấp.

Chống chỉ định

Có tiền sử quá mẫn với bất kỳ kháng sinh penicilin nào.

Thận trọng

Benzathin penicilin G chỉ được sử dụng qua đường tiêm bắp. Nếu tiêm tĩnh mạch, thuốc có thể gây ngưng hô hấp - tuần hoàn và tử vong. Tiêm thuốc vào động mạch, tiêm vào hoặc tiêm gần các dây thần kinh ngoại vi lớn có thể gây hủy hoại thần kinh mạch nặng,