Бисептол



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ко-тримоксазол Сульфаметоксазол
- Триметоприм

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[мнн] [мнн] Википедия[мнн] [мнн] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, плоские, с фаской и гравировкой "Bs".

	1 таб.
сульфаметоксазол	100 мг
триметоприм	20 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, тальк, магния стеарат, спирт поливиниловый, метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, пропиленгликоль.

20 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Таблетки белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, плоские, с фаской, риской и гравировкой "Bs".

	1 таб.
сульфаметоксазол	400 мг
триметоприм	80 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, тальк, магния стеарат, спирт поливиниловый, метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, пропиленгликоль.

20 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный антибактериальный препарат, содержит сульфаметоксазол и триметоприм.

Сульфаметоксазол, сходный по строению с ПАБК, нарушает синтез дигидрофолиевой кислоты в бактериальных клетках, препятствуя включению ПАБК в ее молекулу.

Триметоприм усиливает действие сульфаметоксазола, нарушая восстановление дигидрофолиевой кислоты в тетрагидрофолиевую - активную форму фолиевой кислоты, ответственную за белковый обмен и деление микробной клетки.

Является бактерицидным препаратом широкого спектра действия.

Активен в отношении грамположительных аэробных бактерий: Streptococcus spp., включая Streptococcus pneumoniae (гемолитические штаммы более чувствительны к пенициллину), Staphylococcus spp., Bacillus anthracis, Listeria monocytogenes, Nocardia asteroides, Enterococcus faecalis, Mycobacterium spp. (включая Mycobacterium leprae, исключая Mycobacterium tuberculosis); *грамотрицательных аэробных бактерий*: Neisseria meningitidis, Neisseria gonorrhoeae, Escherichia coli (включая энтеротоксогенные штаммы), Salmonella spp. (включая Salmonella typhi и Salmonella paratyphi); Vibrio cholerae, Haemophilus influenzae (включая ампициллиноустойчивые штаммы), Bordetella pertussis, Klebsiella spp., Proteus spp., Pasteurella spp., Francisella tularensis, Brucella spp., Citrobacter spp., Enterobacter spp., Legionella pneumopbila, Providencia, некоторые виды Pseudomonas (кроме Pseudomonas aeruginosa), Serratia marcescens, Shigella spp., Yersinia spp., Morganella spp., а также *в отношении* Chlamydia spp. (в т.ч. Chlamydia trachomatis, Chlamydia psittaci); *в отношении грамположительных анаэробов:* Actinomyces israelii; *в отношении простейших:* Plasmodium spp., Toxoplasma gondii; *патогенных грибов:* Coccidioides immitis, Histoplasma capsulatum, Pneumocystis carinii, Leishmania spp.

К препарату *устойчивы*: Corynebacterium spp., Pseudomonas aeruginosa, Mycobacterium tuberculosis, Treponema spp., Leptospira spp., вирусы.

Угнетает жизнедеятельность кишечной палочки, что приводит к уменьшению синтеза тиамина, рибофлавина, никотиновой кислоты и других витаминов группы В в кишечнике.

Продолжительность терапевтического действия составляет 7 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь активные вещества быстро и полностью абсорбируются из ЖКТ.

C_{max} в плазме крови достигается в течение 1-4 ч после приема внутрь.

Распределение

Триметоприм хорошо проникает в ткани и биологические среды организма: легкие, почки, простату, желчь, слюну, мокроту, спинномозговую жидкость. Связывание триметоприма с белками плазмы составляет 50%; сульфаметоксазола - 66%.

Выведение

$T_{1/2}$ триметоприма - 8.6-17 ч, сульфаметоксазола - 9-11 ч. Основной путь выведения - почки; при этом триметоприм выводится в неизмененном виде до 50%; сульфаметоксазол - 15-30% в активной форме.

Показания к применению:

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

— инфекции дыхательных путей (в т.ч. бронхит, пневмония, абсцесс легкого, эмпиема плевры);

— отит, синусит;

— инфекции мочеполовой системы (в т.ч. пиелонефрит, уретрит, сальпингит, простатит);

— гонорея;

— инфекции ЖКТ (в т.ч. брюшной тиф, паратиф, бактериальная дизентерия, холера, диарея);

— инфекции кожи и мягких тканей (в т.ч. фурункулез, пиодермия).

Относится к болезням:

- Абсцесс
- Бронхит
- Брюшной тиф
- Гонорея
- Диарея
- Дизентерия
- Инфекции
- Отит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Плеврит
- Пневмония
- Простатит
- Сальпингит
- Синусит
- Уретрит
- Фурункул
- Холера
- Эмпиема
- Эмпиема плевры

Противопоказания:

— установленные повреждения паренхимы печени;

— выраженные нарушения функции почек при отсутствии возможности контроля концентрации препарата в плазме крови;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 15 мл/мин);

— тяжелые заболевания крови (апластическая анемия, B_{12}-дефицитная анемия, агранулоцитоз, лейкопения, мегалобластная анемия, анемия, связанная с дефицитом фолиевой кислоты);

— гипербилирубинемия у детей;

— дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (риск развития гемолиза);

— беременность;

— лактация;

— детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к сульфаниламидам.

С *осторожностью* назначают препарат при дефиците фолиевой кислоты в организме, бронхиальной астме, заболеваниях щитовидной железы.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально. Препарат принимают после еды, запивая достаточным количеством жидкости.

Детям в возрасте от 3 до 5 лет препарат назначают по 240 мг (2 таб. по 120 мг) 2 раза/сут; **детям в возрасте от 6 до 12 лет** - по 480 мг (4 таб. по 120 мг или 1 таб. по 480 мг) 2 раза/сут.

При *пневмонии* препарат назначают из расчета 100 мг сульфаметоксазола на 1 кг массы тела/сут. Интервал между приемами - 6 ч, продолжительность приема - 14 дней.

При *гонорее* доза препарата составляет 2 г (в пересчете на сульфаметоксазол) 2 раза/сут с интервалом между приемами 12 ч.

Взрослым и детям старше 12 лет препарат назначают по 960 мг 2 раза/сут, при длительной терапии - по 480 мг 2 раза/сут.

Продолжительность курса лечения - от 5 до 14 дней. При *тяжелом течении заболевания и/или при хронических инфекциях* возможно увеличение разовой дозы на 30-50%.

При продолжительности курса терапии более 5 дней и/или повышении дозы препарата необходимо контролировать картину периферической крови; при появлении патологических изменений следует назначить фолиевую кислоту в

дозе 5-10 мг/сут.

У **пациентов с почечной недостаточностью при КК 15-30 мл/мин** стандартную дозу Бисептола следует уменьшить на 50%.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение; в отдельных случаях - асептический менингит, депрессия, апатия, тремор, периферические невриты.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм, удушье, кашель, легочные инфильтраты.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, снижение аппетита, диарея, гастрит, боль в животе, глоссит, стоматит, холестаз, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит, иногда с холестатической желтухой, гепатонекроз, псевдомембранозный энтероколит, панкреатит.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, мегалобластная анемия, апластическая и гемолитическая анемия, эозинофилия, гипопротромбинемия, метгемоглобинемия.

Со стороны мочевыделительной системы: полиурия, интерстициальный нефрит, нарушение функции почек, кристаллурия, гематурия, повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия, токсическая нефропатия с олигурией и анурией.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия.

Аллергические реакции: зуд, фотосенсибилизация, крапивница, лекарственная лихорадка, сыпь, многоформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), эксфолиативный дерматит, аллергический миокардит, повышение температуры тела, ангионевротический отек, гиперемия склер.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия, гиперкалиемия, гипонатриемия.

Препарат, как правило, хорошо переносится.

Передозировка:

Симптомы: отсутствие аппетита, кишечная колика, тошнота, рвота, головокружение, головная боль, сонливость, потеря сознания, возможны также лихорадка, гематурия, кристаллурия. Позднее могут развиться угнетение костного мозга и желтуха.

После острого отравления триметопримом возможны тошнота, рвота, головокружение, головная боль, депрессия, расстройство сознания, угнетение функции костного мозга.

Неизвестно, какая доза ко-тримоксазола может быть опасна для жизни.

Хроническое отравление: применение ко-тримоксазола в высоких дозах в течение продолжительного периода может привести к угнетению функции костного мозга, проявляющееся тромбоцитопенией, лейкопенией или мегалобластной анемией.

Лечение: отмена препарата и принятие мер, направленных на его удаление из ЖКТ (провести промывание желудка не позднее 2 ч после приема препарата или вызвать рвоту), обильное питье, если диурез является недостаточным, а функция почек сохранена. Ввести кальция фолинат (5-10 мг/сут). Кислая среда мочи ускоряет выведение триметоприма, но может также увеличить риск кристаллизации сульфонамида в почках.

Следует контролировать картину крови, состав электролитов в плазме и другие биохимические параметры. Гемодиализ умеренно эффективен, а перитонеальный диализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бисептол противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Бисептола с тиазидными диуретиками имеется риск развития тромбоцитопении и кровоточивости (комбинация не рекомендуется).

Ко-тримоксазол увеличивает антикоагулянтную активность непрямых антикоагулянтов, а также действие гипогликемических лекарственных средств и метотрексата.

Ко-тримоксазол снижает интенсивность печеночного метаболизма фенитоина (увеличивает его $T_{1/2}$ на 39%) и варфарина, усиливая их действие.

Рифампицин уменьшает $T_{1/2}$ триметоприма.

При одновременном применении пириметамин в дозах, превышающих 25 мг/нед., увеличивает риск развития мегалобластной анемии.

При одновременном применении диуретики (чаще тиазиды) увеличивают риск развития тромбоцитопении.

Бензокаин, прокаин, прокаинамид (как и другие лекарственные средства, в результате гидролиза которых образуется ПАБК) снижают эффективность Бисептола.

Между диуретиками (в т.ч. с тиазидами, фуросемидом) и пероральными гипогликемическими средствами (производными сульфонилмочевины) с одной стороны, и антибактериальными средствами группы сульфаниламидов - с другой стороны, возможно развитие перекрестной аллергической реакции.

Фенитоин, барбитураты, ПАСК усиливают проявления дефицита фолиевой кислоты при одновременном применении с Бисептолом.

Производные салициловой кислоты усиливают действие Бисептола.

Аскорбиновая кислота, гексаметилентетрамин (как и другие лекарственные средства, закисляющие мочу) увеличивают риск развития кристаллурии на фоне применения Бисептола.

Колестирамин снижает абсорбцию при одновременном приеме с другими препаратами, поэтому его следует принимать через 1 ч после или за 4-6 ч до приема ко-тримоксазола.

При одновременном применении с лекарственными средствами, угнетающими костномозговое кроветворение, повышается риск развития миелосупрессии.

В некоторых случаях Бисептол может увеличивать концентрацию дигоксина в плазме крови у пациентов пожилого возраста.

Бисептол может уменьшать эффективность трициклических антидепрессантов.

У пациентов после трансплантации почки, при одновременном применении ко-тримоксазола и циклоспорина, отмечается проходящее нарушение функции трансплантированной почки, проявляющееся повышением концентраций креатинина в сыворотке, что вероятно вызвано действием триметоприма.

Снижает эффективность пероральной контрацепции (угнетает кишечную микрофлору и уменьшает кишечно-печеночную циркуляцию гормональных средств).

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью назначают препарат при отягощенном аллергологическом анамнезе.

При длительных (более месяца) курсах лечения необходимы регулярные анализы крови, поскольку существует вероятность возникновения гематологических изменений (чаще всего асимптоматических). Эти изменения могут быть обратимы при назначении фолиевой кислоты (3-6 мг/сут), что существенно не нарушает противомикробной активности препарата. Особая осторожность необходима при лечении пациентов пожилого возраста или больных с подозрением на исходную нехватку фолатов. Назначение фолиевой кислоты целесообразно также при длительном лечении препаратом в высоких дозах.

Для профилактики кристаллурии рекомендуется поддерживать достаточный объем выделяемой мочи. Вероятность токсических и аллергических осложнений сульфаниламидов значительно увеличивается при снижении фильтрационной функции почек.

Нецелесообразно также на фоне лечения употреблять пищевые продукты, содержащие большое количество ПАБК, - зеленые части растений (цветная капуста, шпинат, бобовые), морковь, помидоры.

Следует избегать чрезмерного солнечного и УФ-облучения.

Риск побочных эффектов значительно выше у больных СПИД.

Не рекомендуется применять препарат при тонзиллитах и фарингитах, вызванных β-гемолитическим стрептококком группы А, из-за широко распространенной резистентности штаммов.

Триметоприм может изменить результаты определения уровня метотрексата в сыворотке, проводимого ферментативным методом, однако не влияет на результат при выборе радиоиммунологического метода.

Ко-тримоксазол может повышать на 10% результаты реакции Яффе с пикриновой кислотой для количественного определения креатинина.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при выраженных нарушениях функции почек (КК менее 15 мл/мин).

У **пациентов с почечной недостаточностью при КК 15-30 мл/мин** стандартную дозу Бисептола следует уменьшить на 50%.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при установленных повреждениях паренхимы печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Biseptol