

Бисептол 480



Код АТХ:

- [J01EE01](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Сульфаметоксазол](#)
- [Триметоприм](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН МНН} [Википедия](#)^{МНН МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Концентрат для приготовления раствора для инфузий в виде прозрачной, бесцветной или светло-желтой жидкости с запахом спирта.

	1 мл	1 амп.
сульфаметоксазол	80 мг	400 мг
триметоприм	16 мг	80 мг

Вспомогательные вещества: пропиленгликоль, натрия гидроксид, этанол, бензиловый спирт, натрия метабисульфит, вода д/и.

5 мл - ампулы (10) - пачки.

5 мл - ампулы (5) - упаковки контурные пластиковые (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный антибактериальный препарата, содержащий сульфаметоксазол, обладающий средней длительностью действия, тормозящий синтез фолновой кислоты путем конкурентного антагонизма с парааминобензойной кислотой, а также триметоприм-ингибитор бактериальной редуктазы дигидрофолиевой кислоты. Сочетание обоих препаратов дает синергический эффект антибактериального действия в связи с чем бактериальная устойчивость проявляется реже, по сравнению с другими препаратами.

Бисептол обладает широким спектром антибактериального действия. Он *активен в отношении* : Streptococcus (Streptococcus pneumoniae), Neisseria meningitidis, Neisseria gonorrhoeae (включая энтеротоккогенные штаммы), Staphylococcus, Escherichia coli, Klebsiella, Enterobacter, Proteus mirabilis, Proteus spp., Haemophilus influenzae, Salmonella

spp. (включая *Salmonella typhi* и *Salmonella paratyphi*), *Vibrio cholerae*, *Bacillus anthracis*, *Listeria* spp., *Nocardia asteroides*, *Bordetella pertussis*, *Enterococcus faecalis*, *Pasteurella* spp., *Brucella* spp., *Mycobacterium* spp. (в т.ч. *Mycobacterium leprae*), *Citrobacter*, *Enterobacter* spp., *Legionella pneumonia*, *Providencia*, некоторые виды *Pseudomonas* (кроме *P.aeruginosa*), *Serratia marcescens*, *Yersinia* spp., *Morganella* spp., *Chlamydia* spp. (в т.ч. *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia psittaci*), *Shigella*, *Plasmodium* spp., *Toxoplasma gondii*, *Pneumocystis carini*, *Actinomyces israelii*, *Coccidioides immitis*, *Histoplasma capsulatum*, *Leishmania* spp.

Устойчивы к препарату: Corynebacterium spp., *Pseudomonas aeruginosa*, *Mycobacterium tuberculosis*, *Troponema* spp., *Leptospira* spp., вирусы.

Угнетает жизнедеятельность кишечной палочки, приводит к уменьшению синтеза тиамин, рибофлавина, никотиновой кислоты и других витаминов группы В в кишечнике. Продолжительность терапевтического эффекта составляет 7 ч.

Фармакокинетика

Препарат быстро проникает в ткани и биологические жидкости организма.

Хорошо распределяется. Проникает через ГЭБ, плацентарный барьер и в грудное молоко. В легких и моче создает концентрации превышающие содержание в плазме. В меньшей степени накапливаются в бронхиальном секрете, влажностных выделениях, секрете и тканях предстательной железы, жидкости среднего уха, спинномозговой жидкости, желчи, костях, слюне, водянистой влаге глаза, грудном молоке, интерстициальной жидкости. Распределение обоих препаратов разное: сульфаметоксазол распределяется исключительно во внеклеточном пространстве, а триметоприм - как внутри клеток, так и во внеклеточном пространстве. Связывание с белками плазмы - 66% у сульфаметоксазола, у триметоприма - 45%. Оба препарата метаболизируются в печени.

В большей степени метаболизируется сульфаметоксазол (с образованием ацетилированных производных), метаболиты не обладают противомикробной активностью.

Выводятся почками, как путем фильтрации, так и путем активной секреции канальцами, в виде метаболитов (80% в течение 72 ч) и в неизменном виде (20% сульфаметоксазола, 50% триметоприма), концентрация действующих веществ в моче значительно выше, чем в крови. Незначительное количество препарата выводится через кишечник. $T_{1/2}$ сульфаметоксазола - 9-11 ч, триметоприма - 10-12ч, у детей - существенно меньше и зависит от возраста: до первого года - 7-8ч, 1-10 лет - 5-6 ч. У пожилых и пациентов с нарушением функции почек $T_{1/2}$ увеличивается.

Показания к применению:

- острые и хронические инфекции мочеполовых органов: уретрит, пиелонефрит, цистит, пиелит, простатит, эпидидимит, гонорея, мягкий шанкр, венерическая лимфогранулема, паховая гранулема;
- инфекции дыхательных путей: бронхит (острый и хронический) бронхоэктатическая болезнь, крупозная пневмония, бронхопневмония, пневмоцистная пневмония, эмпиема плевры, абсцесс легкого;
- инфекции ЛОР-органов: средний отит, синусит, ларингит, ангина, скарлатина;
- инфекции ЖКТ: брюшной тиф, паратиф, сальмонеллоносительство, холера, дизентерия, холецистит, холангит, гастроэнтериты, вызванные энтеротоксичными штаммами *E.coli*;
- инфекции кожи и мягких тканей: акне, фурункулез, пиодермия, абсцесс и раневые инфекции, инфекции после хирургических вмешательств;
- сепсис, острый бруцеллез, токсоплазмоз, остеомиелит, остеоартикулярные инфекции, южноамериканский бластомикоз, малярия (*Plasmodium falciparum*), коклюш (в составе комплексной терапии).

Относится к болезням:

- [Абсцесс](#)
- [Акне](#)
- [Ангина](#)
- [Бронхит](#)
- [Бронхопневмония](#)
- [Бронхоэктатическая болезнь](#)
- [Брюшной тиф](#)
- [Гастрит](#)
- [Гастроэнтерит](#)
- [Гонорея](#)
- [Дизентерия](#)
- [Инфекции](#)
- [Коклюш](#)

- [Ларингит](#)
- [Лимфома](#)
- [Малярия](#)
- [Остеомиелит](#)
- [Отит](#)
- [Пиелит](#)
- [Пиелонефрит](#)
- [Плеврит](#)
- [Пневмония](#)
- [Простатит](#)
- [Сальмонеллез](#)
- [Сепсис](#)
- [Синусит](#)
- [Скарлатина](#)
- [Токсоплазмоз](#)
- [Уретрит](#)
- [Фурункул](#)
- [Холангит](#)
- [Холера](#)
- [Холецистит](#)
- [Цистит](#)
- [Эмпиема](#)
- [Эмпиема плевры](#)
- [Энтерит](#)
- [Эпидидимит](#)

Противопоказания:

— мегалобластная анемия на фоне дефицита фолиевой кислоты, апластическая анемия, В₁₂-дефицитная анемия, агранулоцитоз, лейкопения;

— дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;

— гипербилирубинемия у детей;

— печеночная и/или почечная недостаточности клиренс креатинина менее 15 мл/мин);

— возраст до 6 лет (только для в/м введения);

— беременность;

— период лактации;

— повышенная индивидуальная чувствительность к сульфаниламидам или триметоприму.

Не следует применять препарат у недоношенных, новорожденных и грудных детей до 2 месяца жизни.

С *осторожностью* применяется при дефиците фолиевой кислоты, бронхиальной астме, заболеваниях щитовидной железы, нарушении функции печени и почек.

Способ применения и дозы:

Препарат следует вводить в/в капельно, после разбавления (например, 5% раствором декстрозы, 0.9% раствором натрия хлорида, раствором Рингера или 0.45% раствором натрия хлорида с 2.5% раствором декстрозы). Раствор для инфузии необходимо приготовить сразу же перед введением, тщательно перемешав. После разведения, полученный раствор следует применять в течение 6 ч.

Не следует применять препарат в виде быстрой в/в инъекции.

Взрослым и детям старше 12 лет назначают по 960 мг (2 ампулы по 5 мл, разведенные в 250 мл раствора) через каждые 12 ч. В особо тяжелых случаях следует назначать по 1440 мг (3 ампулы) 2-3 раза/сут.

Детям в возрасте до 12 лет суточную дозу назначают из расчета 36 мг/кг массы тела в двух равных дозах.

Больным с почечной недостаточностью (при клиренсе креатинита 15-30 мл/мин) назначают 50% средней терапевтической дозы.

Побочное действие:

Бисептол обычно хорошо переносится больными. Однако могут отмечаться в следующие эффекты:

Со стороны ЖКТ: анорексия, гастрит, абдоминальные боли, глоссит, стоматит, холестаза, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит, псевдомембранозный энтероколит, тошнота, рвота, диарея, некроз печени.

Со стороны ЦНС: головные боли и головокружения. В отдельных случаях - асептический менингит, депрессия, апатия, тремор, периферические невриты.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм, легочные инфильтраты.

Со стороны органов кроветворения: редко - нейтропения, агранулоцитоз, мегалобластная анемия, лейкопения, тромбоцитопения, гипопротромбинемия.

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

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия.

Аллергические реакции: кожные высыпания и зуд, фотосенсибилизация, сыпь, полиморфная эритема, эксфолиативный дерматит, аллергический миокардит, повышение температуры тела, отек Квинке, покраснение склер.

Местные реакции: тромбоз флебит (в месте венопункции), болезненность в месте введения.

Прочие: гипогликемия

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, кишечная колика, головокружение, головная боль, сонливость, депрессия, обморок, спутанность сознания, нарушение зрения, лихорадка, гематурия, кристаллурия; при продолжительной передозировке - тромбоцитопения, лейкопения, мегалобластная анемия .желтуха.

Лечение: промывание желудка, подкисление мочи увеличивает выведение триметоприма, прием жидкости внутрь, в/м - 5-15 мг /сут, кальция фолината (устраняет действие триметоприма на костный мозг), при угнетении кроветворных функций костного мозга, вызванном триметопримом, для стимулирования эритропоэза применяют препараты фолиевой кислоты внутримышечно (3-6 мг/сут. Курс лечения - 5-7 дней), при необходимости - гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не следует назначать препарат во время беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Бисептол усиливает действие фенитоина, пероральных гипогликемических средств, производных варфарина(удлинение протромбинового времени, кровотечение).

У больных пожилого возраста в комбинации с мочегонными средствами (в частности, с тиазидными диуретиками), повышается риск развития тромбоцитопении.

Одновременное применение с циклоспорином уменьшает его концентрацию в крови.

Не следует вводить препарат внутривенно в комбинации с лекарственными препаратами и растворами, содержащими бикарбонаты.

Бисептол фармацевтически совместим со следующими препаратами: декстроза для в/в инфузий 5%, натрия хлорид для в/в инфузий 0.9%, смесь 0.18% натрия хлорида и 4% декстрозы для в/в инфузий, 6% декстран 70 для в/в инфузий в 5% декстрозе или в физиологическом растворе, 10% декстран 40 для в/в инфузий в 5% декстрозе или физиологическом растворе, растворе Рингера для инъекций.

Увеличивает антикоагулянтную активность непрямых коагулянтов, усиливает действие гипогликемических средств и метотрексата.

Снижает интенсивность печеночного метаболизма фенитоина (удлиняет егоT_{1/2} на 39%) и варфарина, усиливая их эффект.

Рифампицин сокращает T_{1/2} триметоприма.

Пириметамин в дозах, превышающих 25 мг/нед, увеличивает риск развития мегалобластной анемии.

Диуретики (чаще тиазиды) увеличивают риск развития тромбоцитопении.

Снижают эффект бензокаин, прокаин, прокаинамид и другие лекарственные средства, в результате гидролиза которых образуется ПАБК.

Между диуретиками (тиазиды, фуросемид и др.) и пероральными гипогликемическими препаратами (производные сульфонилмочевины) с одной стороны и противомикробными сульфаниламидами с другой- возможно развитие перекрестной аллергической реакции.

Фениноин, барбитураты, ПАСК усиливают проявления дефицита фолиевой кислоты.

Производные салициловой кислоты усиливают действие.

Аскорбиновая кислота, гексаметилентетрамин и другие лекарственные средства, закисляющие мочу, увеличивают риск развития кристаллурии.

Колестерамин снижает абсорбцию, поэтому его следует принимать через 1 ч после или за 4-6 ч до приема котримоксазола.

Снижает надежность пероральной контрацепции (угнетает кишечную микрофлору и уменьшает кишечную-печеночную циркуляцию гормональных соединений).

Особые указания и меры предосторожности:

У больных СПИД, леченных котримоксазолом, в связи с инфекцией *Pneumocystis carinii*, чаще отмечаются нежелательные эффекты: кожные высыпания, повышение температуры тела, лейкопения.

Желательно определять концентрацию сульфаметоксазола в плазме каждые 2-3 дня непосредственно перед очередным вливанием. Если концентрация сульфаметоксазола превышает 150 мкг/мл, лечение должно быть прервано до тех пор, пока она не снизится ниже 120 мкг/мл.

При длительном лечении следует систематически проводить исследования периферической крови, функциональное состояние печени и почек.

Пожилым пациентам рекомендуется дополнительное назначение фолиевой кислоты (3-6 мг/сут), что существенно не нарушает противомикробной активности препарата. Особая осторожность должна проявляться при лечении пожилых больных с подозрением на исходную нехватку фолатов.

Для профилактики кристаллурии рекомендуется поддерживать достаточный объем выделяемой мочи.

Вероятность токсических и аллергических осложнений сульфаниламидов значительно увеличивается при осложнении фильтрационной функции почек.

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

Следует избегать чрезмерного солнечного и ультрафиолетового облучения.

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат не оказывает влияние на способность к управлению транспортными средствами и обслуживанию движущихся механизмов.

При нарушениях функции почек

Противопоказан:

— почечная недостаточность клиренс креатинина менее 15 мл/мин.

Больным с почечной недостаточностью (при клиренсе креатинина 15-30 мл/мин) назначают 50% средней терапевтической дозы.

При нарушениях функции печени

Противопоказан:

Бисептол 480

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

— печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым пациентам рекомендуется дополнительное назначение фолиевой кислоты (3-6 мг/сут), что существенно не нарушает противомикробной активности препарата. Особая осторожность должна проявляться при лечении пожилых больных с подозрением на исходную нехватку фолатов.

Применение в детском возрасте

Не следует применять препарат у недоношенных, новорожденных и грудных детей до 2 месяца жизни.

Детям в возрасте до 12 лет суточную дозу назначают из расчета 36 мг/кг массы тела в двух равных дозах.

Условия хранения:

Список Б. В защищенном от света месте, при температуре не выше 30°C. Срок годности - 5 лет

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Biseptol_480