# Бисептол 480



## Код АТХ:

- J01EE01

## Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- 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:

***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 фолневой кислоты путем конкурентного антагонизма с парааминобензойной кислотой, а также триметолрим-ингибитор бактериальной редуктазы дигидрофолиевой кислоты. Сочетание обоих препаратов дает еннергический 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 энтеротоксогенные 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, Bordclella 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.aerugenosa), 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 aerugenosa, Mycobacterium tuberculosis, Troponema spp., Leptospira spp., вирусы.

Угнетает жизнедеятельность кишечной палочки, приводит к уменьшению синтеза тиамина, рибофлавина, никотиновой кислоты и дрругих 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, влагалищных выделениях, секрете и тканях предстательной железы, жидкости среднего уха, спиномозговой 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 неизмененном 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 дыхательный 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, $B_{12}$-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, нарушение 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, холестаз, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит, псевдомембранозный энтероколит, тошнота, рвота, диарея, некроз печени.

*Со стороны ЦНС:* головные боли и головокружения. В отдельный 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:* тромбофлебит (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 егоТ1/2 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 следуем принимать через 1 ч после или за 4-6 ч до приема котримоксазола.

Снижает надежность пероральной контрацепции (угнетает кишечную микрофлору и уменьшает кишечно-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 тонзилитах, 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 креатинита 15-30 мл/мин)** назначают 50% средней терапевтической дозы.

***При нарушениях функции печени***

Противопоказан:

— 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°С. Срок годности - 5 лет

## Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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