Ко-тримоксазол



Код АТХ:

- J01EE01

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:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки	**1 таб.**
сульфаметоксазол	100 мг
триметоприм	20 мг

20 шт. - банки (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки безъячейковые контурные (100) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — антибактериальное широкого спектра.

Нарушает синтез фолата (препятствует акцепции ПАБК), ингибирует дигидрофолатредуктазу и образование

фолиниевой кислоты, уменьшает синтез пуринов, пиримидинов, аминокислот, белка в микробных клетках..

Фармакодинамика

Комбинированное противомикробное средство широкого спектра действия.

Сульфаметоксазол оказывает бактериостатическое действие, которое связано с ингибированием процесса утилизации ПАБК и нарушением синтеза дигидрофолиевой кислоты в бактериальных клетках.

Триметоприм ингибирует фермент, который участвует в метаболизме фолиевой кислоты, превращая дигидрофолат в тетрагидрофолат. Таким образом, блокируется 2 последовательные стадии биосинтеза пуринов и, следовательно, нуклеиновых кислот, которые необходимы для роста и размножения бактерий. Высокие концентрации создаются в тканях легких, почек, предстательной железы, в спинномозговой жидкости, желчи, костях.

Комбинация сульфометоксазол+триметоприм *проявляет активность в отношении грамположительных бактерий:* Staphylococcus spp. (в т.ч. штаммы, продуцирующие пенициллиназу), Streptococcus spp. (в т.ч. Streptococcus pneumoniae), Corynebacterium diphtheriae; *грамотрицательных бактерий:* Neisseria gonorrhoeae, Escherichia coli, Shigella spp., Salmonella spp., Proteus spp., Enterobacter spp., Klebsiella spp., Yersinia spp., Vibrio cholerae, Haemophilus influenzae; *анаэробных неспорообразующих бактерий* - Bacteroides spp; также *проявляет активность также в отношении* Chlamydia spp.

К данной комбинации *устойчивы* Pseudomonas aeruginosa, Treponema spp., Mycoplasma spp., Mycobacterium tuberculosis, а также вирусы и грибы.

Фармакокинетика

При пероральном приеме абсорбция - 90%. T_{Cmax} - 1-4 ч, терапевтический уровень концентрации сохраняется 7 ч после однократного приема. Хорошо распределяется в организме. Проникает через ГЭБ, плацентарный барьер и в грудное молоко. В легких и моче создает концентрации, превышающие содержание в плазме. В меньшей степени накапливается в бронхиальном секрете, влагалищных выделениях, секрете и ткани предстательной железы, жидкости среднего уха (при его воспалении), спинномозговой жидкости, желчи, костях, слюне, водянистой влаге глаза, грудном молоке, интерстициальной жидкости. Связь с белками плазмы - 66% у сульфаметоксазола, у триметоприма - 45%.

В большей степени метаболизируется сульфаметоксазол с образованием ацетилированных производных. Метаболиты не обладают противомикробной активностью.

Выводится почками в виде метаболитов (80% в течение 72 ч) и в неизмененном виде (20% сульфаметоксазола, 50% триметоприма); незначительное количество - через кишечник. $T_{1/2}$ сульфаметоксазола - 9-11 ч, триметоприма - 10-12 ч, у детей - существенно меньше и зависит от возраста: до 1 года - 7-8 ч, 1-10 лет - 5-6 ч. У пожилых и пациентов с нарушением функции почек $T_{1/2}$ увеличивается.

Показания к применению:

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными микроорганизмами, в т.ч.: инфекции мочевыводящих путей (уретрит, цистит, пиелит, пиелонефрит), инфекции половых органов (простатит, эпидидимит, гонорея, мягкий шанкр, венерическая лимфогранулема, паховая гранулема); инфекции дыхательных путей (острый и хронический бронхит, бронхоэктатическая болезнь, крупозная пневмония, бронхопневмония, пневмоцистная пневмония); инфекции ЛОР-органов (средний отит, синусит, ларингит, ангина); скарлатина; инфекции ЖКТ (брюшной тиф, паратиф, сальмонеллоносительство, холера, дизентерия, холецистит, холангит, гастроэнтериты, вызванные энтеротоксичными штаммами Escherichia coli); инфекции кожи и мягких тканей (акне, фурункулез, пиодермия, раневые инфекции); остеомиелит (острый и хронический) и другие остеоартикулярные инфекции; бруцеллез (острый), южноамериканский бластомикоз, малярия (Plasmodium falciparum), токсоплазмоз (в составе комплексной терапии).

Относится к болезням:

- Акне
- Ангина
- Бронхит
- Бронхопневмония
- Бронхоэктатическая болезнь
- Брюшной тиф
- Гастрит
- Гастроэнтерит
- Гонорея
- Дизентерия
- Инфекции
- Инфекции ЖКТ

- Инфекции мочевыводящих путей
- Инфекции половых органов
- Ларингит
- Лимфома
- Малярия
- Остеомиелит
- Отит
- Пиелит
- Пиелонефрит
- Пневмония
- Простатит
- Сальмонеллез
- Синусит
- Скарлатина
- Токсоплазмоз
- Уретрит
- Фурункул
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Цистит
- Энтерит
- Эпидидимит

Противопоказания:

Поражение паренхимы печени; выраженные нарушения функции почек при отсутствии возможности контроля концентрации сульфаметоксазола и триметоприма в плазме крови; почечная недостаточность тяжелой степени (КК<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; беременность; период лактации (грудного вскармливания); детский возраст до 2 месяцев или до 6 недель (рожденных от матерей с ВИЧ-инфекцией) - для суспензии и в/в инфузии; детский возраст до 2 лет - для таблеток; одновременное применение с дофетилидом; повышенная чувствительность к сульфаниламидам и триметоприму.

С осторожностью

Дефицит фолиевой кислоты в организме, бронхиальная астма, заболевания щитовидной железы.

Способ применения и дозы:

Устанавливается индивидуально. Дозы приведены из расчета на сульфаметоксазол. Внутрь для взрослых и детей старше 12 лет средняя доза составляет 0.4-2 г каждые 12 ч (2 раза/сут), курс лечения - 5-14 дней. Внутрь для детей в возрасте 2-5 мес - по 100 мг 2 раза/сут; от 6 мес до 5 лет - по 200 мг 2 раза/сут; от 6 до 12 лет - по 400 мг 2 раза/сут.

При необходимости применяют в/в капельно по 0.8-1.6 г каждые 12 ч (2 раза/сут) в течение 5 дней. Детям в возрасте от 6 недель дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от массы тела и клинической ситуации.

После парентеральной терапии в случае необходимости переходят на прием внутрь.

Максимальная суточная доза для взрослых при приеме внутрь составляет 3.6 г.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, глоссит, псевдомембранозный колит, холестатический гепатит.

Аллергические реакции: кожная сыпь, отек Квинке, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, мегалобластная анемия.

Со стороны мочевыделительной системы: кристаллурия, гематурия, интерстициальный нефрит.

Местные реакции: флебит (при в/в введении).

Прочие: пурпура, нарушение функции щитовидной железы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении данной комбинации эффект антикоагулянтов непрямого действия значительно усиливается из-за замедления инактивации последних, а также их высвобождения из связи с белками плазмы.

При одновременном применении с некоторыми производными сульфонилмочевины возможно усиление гипогликемического действия.

Одновременное применение данной комбинации и метотрексата может приводить к повышению токсичности последнего (в частности, к появлению панцитопении) из-за его высвобождения из связи с белками плазмы.

Под влиянием бутадиона, индометацина, напроксена, салицилатов и некоторых других НПВС возможно усиление действия данной комбинации с развитием нежелательных эффектов, поскольку происходит высвобождение активных веществ из связи с белками крови и повышение их концентрации.

Одновременный прием диуретиков и данной комбинации повышает вероятность развития тромбоцитопении, вызываемой последним, особенно у пациентов пожилого возраста.

В случае одновременного назначения хлоридина с данной комбинацией противомикробное действие усиливается, поскольку хлоридин тормозит образование тетрагидрофолиевой кислоты, необходимой для синтеза нуклеиновых кислот и белков. В свою очередь сульфаниламиды тормозят образование дигидрофолиевой кислоты, являющейся предшественником тетрагидрофолиевой кислоты. Это сочетание широко используется при лечении токсоплазмоза.

Абсорбция сульфаметоксазола и триметоприма при их совместном приеме с колестирамином уменьшается в результате образования нерастворимых комплексов, что приводит к снижению их концентрации в крови.

Снижает интенсивность печеночного метаболизма фенитоина (удлиняет его $T_{1/2}$ на 39%), усиливая его эффект и токсическое действие.

При одновременном применении данной комбинации с пириметамином в дозах, превышающих 25 мг/нед., увеличивается риск развития мегалобластной анемии.

Может повысить сывороточные концентрации дигоксина, особенно у пожилых пациентов, необходим мониторинг концентраций дигоксина в сыворотке.

Эффективность трициклических антидепрессантов при приеме с данной комбинацией может быть снижена.

У пациентов, получающих данную комбинацию и циклоспорин после пересадки почки, может наблюдаться обратимое ухудшение функции почек, проявляющееся повышением уровня креатинина.

При одновременном применении с ингибиторами АПФ, особенно у пожилых пациентов, возможно развитие гиперкалиемии.

Триметоприм, ингибируя транспортную систему почек, увеличивает AUC дофетилида на 103% и C_{max} дофетилида на 93% . При увеличении концентрации дофетилид может вызывать желудочковые аритмии с удлинением интервала QT, включая аритмию типа "пируэт". Одновременное применение противопоказано.

Особые указания и меры предосторожности:

Детям следует назначать только те препараты сульфаметоксазола в комбинации с триметоприм, которые предназначены для применения в педиатрии.

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 длительных (свыше 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 должна проявляться при лечении пожилых больных или больных с подозрением на исходную нехватку фолатов. Назначение фолиевой кислоты целесообразно также при длительном лечении 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 в больших количествах 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 при тонзиллитах и фарингитах, вызванных бета-гемолитическим стрептококком группы А, из-за широко распространенной резистентности штаммов.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ko-trimoksazol