

Состав

100 мл суспензии содержат активные вещества триметоприм 0,8 г, сульфаметоксазол 4,0 г вспомогательные вещества макрогола глицерилгидроксистеарат, магния алюмосиликат, натрия кармеллоза, кислоты лимонной моногидрат, натрия гидрофосфата додекагидрат, метилпарагидроксибензоат, пропил-парагидроксибензоат, мальтитол, натрия сахаринат, ароматизатор земляничный, пропиленгликоль, вода очищенная.

Описание

Внешнего вида препарата, таблеток суспензия белого или светло-кремового цвета с земляничным запахом. Фармокологическая группа препарата Противомикробные препараты для системного использования. Сульфаниламиды в комбинации с триметопримом и его производными.

Код АТС

J01EE01

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

После приема внутрь в терапевтической дозе активные вещества быстро и почти полностью (90%) всасываются в верхнем отрезке тонкого кишечника и уже спустя 60 мин. достигают терапевтической концентрации в крови и тканях, которая сохраняется в течение 12 час. Максимальные концентрации активных веществ в плазме крови достигаются через 1-4 часа. Связь с белками плазмы составляет 66% у сульфаметоксазола и 45% у триметоприма. Препарат хорошо распределяется в организме. Препарат проникает в молоко матери и через плацентарный барьер. Сульфаметоксазол и триметоприм метаболизируются в печени. Период полувыведения колеблется от 10 до 12 часов.

Фармакодинамика

Бисептол - химиотерапевтическое комбинированное лекарственное средство, содержащее сульфаметоксазол и производное диаминипиридина - триметоприм в соотношении 5:1. Сульфаметоксазол нарушает утилизацию парааминобензойной кислоты, и следовательно, синтез дигидрофолиевой кислоты. Триметоприм ингибирует фермент, который участвует в превращении дигидрофолата в активный тетрагидрофолат. Комбинация обоих компонентов позволила получить бактерицидное действие. Бисептол активен в отношении грамположительных бактерий стрептококков (*Streptococcus pneumoniae*, *S. agalactiae*, *S. viridans*), стафилококков (*Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*), *Listeria monocytogenes*, *Nocardia asteroides* и грамотрицательных, в том числе большинства палочек *Enterobacteriaceae* (виды *Salmonella*, *Shigella*, *Klebsiella*, *Proteus mirabilis*, *Enterobacter*, часть штаммов *Escherichia coli*), часть штаммов *H. influenzae*, *Legionella* spp., *Yersinia enterocolitica*, *Brucella* spp., *Neisseria meningitidis*, *Neisseria gonorrhoeae*, а также *Pneumocystis carinii*. К препарату устойчивы палочки (*Mycobacteriaceae*), вирусы, большинство анаэробных бактерий и грибов.

Показания к применению

респираторные инфекции – обострение хронического бронхита, лечение и профилактика (первичная и вторичная) пневмонии, вызванной, *Pneumocystis carinii* у взрослых и детей - синусит, острый средний отит - инфекции желудочно-кишечного тракта брюшной тиф и паратиф, бактериальная дизентерия (шигеллез), диарея, холера. - острые и хронические инфекции мочевыделительной системы и предстательной железы (уретрит, цистит, простатит) - мягкий шанкр - бруцеллез, остеомиелит, нокардиоз, актиномикоз,

токсоплазмоз и южноамериканский бластомикоз (возможно сочетание с другими антибиотиками).

Способы применения

Препарат принимают внутрь во время или сразу после еды с большим количеством жидкости. Перед употреблением взболтать до получения однородной суспензии. 5 мл суспензии содержит 200 мг сульфаметоксазола и 40 мг триметоприма. К упаковке прилагается мерный колпачок со шкалой. У детей обычно применяется 6 мг триметоприма и 30 мг сульфаметоксазола на 1 кг массы тела в сутки. При тяжелых инфекциях дозы можно увеличить на 50%. Дети возраст до 3 месяцев (6-8 кг) от 3 месяцев до 3 лет (9-15 кг) от 4 года жизни до 6 лет (16-22 кг) от 7 лет жизни до 12 лет (23-42 кг) 2,5 мл каждые 12 часов 2,5-5 мл каждые 12 часов 5-10 мл каждые 12 часов 10 мл каждые 12 часов Взрослые и дети старше 12 лет – обычно 20 мл, каждые 12 часов. Максимальная доза (для применения в особо тяжелых случаях) – 30 мл суспензии каждые 12 часов. При острых инфекциях Бисептол следует принимать не менее 5 дней или до тех пор, пока симптомы у больного не будут отсутствовать в течение 2 дней. Если через 7 дней лечения клинического улучшения не наступает, следует повторно оценить состояние больного для возможной коррекции лечения. При инфекциях вызванных *Pneumocystis carinii* – 120 мг/кг/сутки, каждые 6 часов в течение 14-21 дней. Курс лечения при инфекции мочевыводящих путей и остром отите – 10 дней, шигеллезах – 5 дней. Больные с нарушением функции почек. При клиренсе креатинина > 30 мл/мин назначают обычную дозу, при клиренсе креатинина от 15 до 30 мл/мин – половину обычной дозы, а при снижении клиренса креатинина до <15 мл/мин применять Бисептол не рекомендуется.

Побочные действия

Обычно препарат хорошо переносится. Частота не известна - тошнота, рвота, отсутствие аппетита, диарея, боли в животе, гастрит, стоматит, глоссит - лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения - повышение температуры, дрожь - сыпь, крапивница, значительно реже полиморфная эритема, зуд - псевдомембранозный энтероколит - кандидоз - реакции гиперчувствительности, которые проявляются в виде повышения температуры тела, ангионевротического отека, анафилактических реакций -легочные инфильтраты по типу эозинофильного, аллергического альвеолита с кашлем или одышкой - обратимая гиперкалиемия, гипогликемия, гипонатриемия - головная боль, головокружение, галлюцинации, нарушение сна, депрессия - нейропатия (в том числе, периферические невриты и парестезии) - повышение активности трансаминаз и концентрации билирубина, гепатит, холестаз, некроз печени - фотосенсибилизация - нарушение функции почек, интерстициальный нефрит, повышение азота мочевины крови, креатинина сыворотки, кристаллурия, повышение диуреза, особенно у больных с отеками сердечного происхождения В единичных случаях - агранулоцитоз, панцитопения, мегалобластическая анемия, гемолитическая, метгемоглобинемия - узелковый периартериит, аллергический миокардит - асептического менингита - пурпура Шенлейн-Геноха - рабдомиолиз - синдром Стивенса-Джонсона - синдром Лайелла - артралгия, миалгия.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к сульфониламидам, триметоприму и/или к другим компонентам препарата - одновременный прием с дофетилидом - выраженные нарушения функции печени или почек (клиренс креатинина ниже 15 мл/мин) - мегалобластная анемия, обусловленная дефицитом фолиевой кислоты - лечение стрептококковой ангины - беременность и период лактации - детский возраст до 3 месяцев.

Лекарственные взаимодействия

Бисептол, применяемый одновременно с диуретиками, особенно из группы тиазидов, повышает возможность проявления тромбоцитопении с кровоточивостью. Может удлинять протромбиновое время у пациентов, принимающих антикоагулянты (например варфарин). Усиливает действие антидиабетических средств, производных сульфонилмочевины. Тормозит метаболизм фенитоина в печени (повышает его период полураспада до 39%). Может также повышать концентрацию свободного метотрексата в плазме крови (повышает высвобождение метотрексата из его соединений с белками). Как и другие сульфаниламиды, Бисептол может потенцировать действие пероральных сахароснижающих препаратов из группы сульфонилмочевины. При одновременном назначении Бисептола больным, которые получают пириметамин для профилактики малярии в дозах более 25 мг в неделю, у них может развиваться мегалобластическая анемия. У больных, получающих Бисептол и циклоспорин после трансплантации почки, может наблюдаться обратимое ухудшение функции почек, проявляющееся повышением уровня креатинина. При одновременном приеме с Бисептолом необходимо снизить дозу индометацина. Возможно повышение сывороточной концентрации дигоксина, особенно у пожилых больных, при одновременном приеме с Бисептолом. При одновременном применении Бисептола и зидовудина возможен рост риска гематологических нарушений. В случае необходимости применения Бисептола и зидовудина следует контролировать картину крови. Эффективность трициклических антидепрессантов может уменьшаться при приеме с Бисептолом. Лабораторные исследования Бисептол может повлиять на результаты определения концентрации метотрексата в сыворотке методом конкурентного связывания с белками, когда в качестве лиганда применяется бактериальная дигидрофолатредуктаза. При определении метотрексата радиоиммунным методом искажений не возникает. Бисептол может нарушать реакцию определения креатинина с использованием щелочного пикриката Яффе (повышает уровень креатинина приблизительно на 10%).

Особые указания

У больных пожилого и старческого возраста, а также при сопутствующих заболеваниях печени и почек или одновременно приеме других лекарств существует более высокий риск развития тяжелых аллергических реакций, таких как синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла и острый некроз печени. Для уменьшения риска подобных реакций лечение Бисептолом должно быть как можно более краткосрочным, особенно у пожилых. При первом появлении кожной сыпи или любой другой тяжелой побочной реакции препарат следует отменить. Больным со склонностью к аллергическим реакциям и с бронхиальной астмой Бисептол следует назначать с осторожностью. При продолжительности курса терапии более 14 дней и/или повышении дозы препарата необходимо контролировать картину периферической крови; при появлении патологических изменений следует принять во внимание назначение фолиевой кислоты. У больных пожилого возраста, а также у больных с дефицитом фолиевой кислоты или почечной недостаточностью могут возникать гематологические изменения, характерные для недостатка фолиевой кислоты. При назначении Бисептола больным, которые уже получают антикоагулянты, следует помнить о возможном усилении противосвертывающего эффекта. В таких случаях необходимо повторно определить время свертывания крови. Препарат не следует назначать пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы. Больным, длительно получающим лечение Бисептолом (особенно при почечной недостаточности), необходимо регулярно делать общий анализ мочи и контролировать функцию почек. Во время лечения нужно обеспечить достаточное поступление жидкости в организм адекватный диурез для предотвращения кристаллурии. Из-за возможности гемолиза больным с дефицитом глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы Бисептол назначают только по абсолютным показаниям и в минимальных дозах.

Необходимо соблюдать осторожность у больных с порфирией или нарушением функции щитовидной железы. У больных, принимающих Бисептол в высоких дозах, нужно регулярно контролировать содержание калия в сыворотке. Большие дозы Бисептола, какие используются при лечении пневмоцистной пневмонии, могут привести к прогрессирующему, но обратимому повышению содержания калия в сыворотке у значительного числа больных. Гиперкалиемию может вызвать даже прием рекомендуемых доз Бисептола, если его назначают на фоне нарушений калиевого обмена, почечной недостаточности или одновременного приема препаратов, провоцирующих гиперкалиемию. При лечении большими дозами Бисептола следует учитывать возможность развития гипогликемии, обычно через несколько дней после начала лечения. Риск гипогликемии выше у больных с нарушениями функции почек, заболеваниями печени, недостаточным питанием. Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами следует ограничить выполнения работ, требующих высокой скорости психических и физических реакций и вождения автомобиля, в случае появления таких побочных действий, как головная боль, головокружение, сонливость и галлюцинации.

Передозировка

Симптомы острой передозировки тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, сонливость, потеря сознания, лихорадка, нарушения зрения, дезориентация, кристаллурия, гематурия и анурия. Симптомы хронической передозировки угнетение кроветворения (тромбоцитопения, лейкопения), а также другие патологические изменения картины крови вследствие недостаточности фолиновой кислоты. Лечение (в зависимости от симптоматики) предотвращение дальнейшего всасывания препарата (например, прием активированного угля), усиление почечной экскреции путем форсированного диуреза, гемодиализ (перитонеальный диализ неэффективен). Необходимо контролировать формулу крови и содержание электролитов. Для устранения гематотоксического эффекта можно назначать фолинат кальция в дозе 5-15 мг в день до восстановления нормального гематопоеза.

Форма выпуска

По 80 мл препарата помещают во флаконы из оранжевого стекла с белой полиэтиленовой крышкой. По 1 флакону вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном русском языках и мерным стаканчиком со шкалой упаковывают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок хранения

3 года. После первого вскрытия упаковки - 8 месяцев. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту