

Бактрим

Форма выпуска

Сироп и таблетки.

Состав

5 мл сиропа включает: триметоприма - 40 мг и сульфаметоксазола - 200 мг;

другие составляющие: целлюлоза дисперсна, метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидрокси-бензоат, сорбит 70%, полисорбат 80, корректант банановый 85509 Н, корректант ванильный 73690-36, вода очищенная.

1 таблетка содержит триметоприма (ТМП) 20, 80 мг, сульфаметоксазола (СМЗ) 100, 400 мг.

Упаковка

Флакон 50, 100 мл.

По 20 таб. в упаковке.

Фармакологическое действие

Фармакодинамика. Бактрим включает два активных вещества, которые имеют синергическое действие, блокируя два фермента, которые катализируют последовательные стадии биосинтеза фолиевой кислоты в микроорганизмах. Благодаря этому механизму, бактерицидное действие *in vitro* достигается обыкновенно уже при таких концентрациях, у которых отдельные компоненты обнаруживают только бактериостатический эффект. Кроме того, Бактрим часто бывает эффективным против возбудителей, стойких к одному из его компонентов. Риск развития полирезистентности сводиться к минимуму.

In vitro антибактериальное действие Бактрима охватывает широкий спектр грампозитивных и грамотрицательных патогенных и условно патогенных микроорганизмов.

Обычно чувствительны возбудители (чувствительны МИК < 80 мг /л):

кокки: *Branhamella catarrhalis*;

грамнегативные палочки: *Haemophilus influenzae* (β -лактамазо-позитивные, β -лактамаз-негативные), *Haemophilus parainfluenzae*, *E. coli*, *Citrobacter freundii*, другие *Citrobacter spp.*, *Klebsiella pneumoniae*, *Klebsiella oxytoca*, другие *Klebsiella spp.*, *Enterobacter cloacae*, *Enterobacter aerogenes*, *Hafnia alvei*, *Serratia marcescens*, *Serratia liquefaciens*, другие *Serratia spp.*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Morganella morganii*, *Shigella spp.*, *Yersinia enterocolitica*, другие *Yersinia spp.*, *Vibrio cholerae*, *Alcaligenes faecalis*, *Pseudomonas cepacia*, *Burkholderia (Pseudomonas) pseudomallei*.

На основании клинического опыта следующие возбудители также имеют быть отмеченные как чувствительны: *Brucella*, *Listeria monocytogenes*, *Nocardia asteroides*, *Pneumocystis carinii*, *Cyclospora cayatanensis*.

Частично чувствительны возбудители (МИК = 80 - 160 мг /л):

кокки: *Staphylococcus aureus* (метициллин-чувствительны и метициллин-резистентные), *Staphylococcus spp.* (коагулазо-негативные), *Streptococcus pneumoniae* (пенициллин-чувствительные и пенициллин-резистентные);

грамнегативные палочки: *Haemophilus ducrei*, *Providencia rettgeri*, другие *Providencia spp.*, *Salmonella typhi*, *Salmonella enteritidis*, *Stenotrophomonas maltophilia* (прежние *Xanthomonas maltophilia*), *Acinetobacter Iwoffii*, *Acinetobacter anitratus* (головн. *A. baumannii*), *Aeromonas hydrophilia*.



Mycoplasma spp., Mycobacterium tuberculosis, Pseudomonas aeruginosa и Treponema pallidum, как правило, стойкие к препарату.

При инфекциях, вызванных частично чувствительными микроорганизмами, рекомендуется провести пробу на чувствительность, чтобы исключить возможную резистентность возбудителя.

Чувствительность к Бактриму можно определить стандартными средствами, например, методом дисков или методом разведения, что рекомендовал Национальный комитет с клинических лабораторных стандартах (НККЛС).

Бактрим, показания к применению

Инфекции верхних и нижних дыхательных путей: острый и хронический бронхит, бронхоэктазы, пневмония (в том числе вызванная *Pneumocystis carinii*), фарингит, ангина (при инфекциях, вызванных б-гемолитическими стрептококками группы А, частота эрадикации не полностью достаточная), синусит, средний отит.

Инфекции почек и мочевыводящих путей: острый и хронический цистит, пиелонефрит, уретрит, простатит.

Инфекции желудочно-кишечного тракта, в том числе брюшной тиф и паратиф, включая случаи устойчивого носительства; бактериальная дизентерия, холера (у дополнение до возобновление жидкости и электролитов).

Инфекции кожи и мягких тканей: пиодермия, фурункулёз, абсцессы и инфицированные раны.

Другие бактериальные инфекции: острый и хронический остеомиелит, острый бруцеллез, септицемия, вызванная чувствительными возбудителями, нокардиоз, мицетома (кроме вызванной настоящими грибами), южноамериканский бластомекоз.

Противопоказания

Бактрим противопоказаний больным с выраженным поражением паренхиме печени. Он противопоказаний также больным с тяжелой почечной недостаточностью, если нет возможности периодически определить концентрации препарата в плазме.

Существует повышенный риск тяжелых побочных реакций у больных старческого возраста, а также у больных с усложняющими состояниями, например, нарушением функции почек и /или печени, или при одновременном приёме остальных препаратов (в этом случае степень риска зависит от величины дозы и продолжительности лечения). Существуют сообщения про летальные случаи, хотя и единичные, связанные с такими побочными реакциями, как дискразия крови, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайела) и молниеносный некроз печени.

Чтобы свести к минимуму опасность побочных реакций, длительность лечения Бактримом должна быть как можно более короткой, особенно у больных пожилого и старческого возраста. При поражении почек дозу следует скорректировать согласно с показаниями разделу "Дозировка в особенных случаях".

Если Бактрим назначают в течение длительного времени, следует регулярно определять число форменных элементов крови. При значительном снижении числа какого угодно форменного элемента крови прием Бактрима следует отменить.

Больным с тяжелыми гематологическими заболеваниями Бактрим можно назначать только как исключение. В отдельных случаях препарат назначали больным на лейкозы, что получали цитостатики, при этом каких-либо побочных действий на костный мозг или периферическую кровь не наблюдалось.

Вследствие возможности гемолизу Бактрим следует назначать больным с дефицитом глюкозо--фосфатдегидрогеназы только по абсолютными показаниями и в минимальных дозах.

При первых признаках кожных высыпаний или другой серьёзных побочного реакции лечения нужно немедленно прекратить.

Бактрим не следует назначать больным с повышенной чувствительностью к сульфонидам или триметоприма в анамнезе.

С соображений безопасности, Бактрим противопоказаний при беременности. Если наличие беременности исключить нельзя, необходимо сопоставить возможный риск от применения препарата с его ожидаемым терапевтическим эффектом.

Хотя триметоприм и сульфаметоксазол проникают в грудное молоко, прием Бактрима матерями-кормилицами практически не связан с риском для ребенка. Если Бактрим назначается беременным или матерям-кормилицам, им следует одновременно принимать фолиевую кислоту в дозе 5 мг в сутки.

Бактрим нельзя назначать недоношенным детям, а также новорожденным первых 6 недель жизни.

Применение при беременности и кормлении грудью

У животных очень большие дозы ко-тримоксазола вызывали пороки развития плода, типичные для недостаточности фолиевой кислоты.

По данным исследований у беременных женщин, литературных обзоров и отдельных сообщений о пороках развития, прием Бактрима, по-видимому, не сопряжен с достоверным риском тератогенности для человека. Поскольку как ТМП, так и СМЗ проникают через плацентарный барьер и, таким образом, могут повлиять на обмен фолиевой кислоты, при беременности Бактрим следует назначать только в том случае, если ожидаемая польза от его применения превосходит возможный риск для плода. Беременным женщинам, получающим Бактрим, рекомендуется назначать по 5-10 мг фолиевой кислоты в сутки. На поздних сроках беременности необходимо избегать применения Бактрима из-за возможного риска ядерной желтухи у новорожденных.

Как ТМП, так и СМЗ проникают в грудное молоко. Несмотря на то, что с грудным молоком к ребенку попадает малое количество Бактрима, рекомендуется сопоставить возможный риск для грудного ребенка (ядерная желтуха, гиперчувствительность) с ожидаемым терапевтическим эффектом для матери.

Способ применения и дозы

Бактрим лучше всего принимать после еды с достаточным количеством жидкости.

Взрослым и детям старше 12 лет: 2 табл. 2 раза в день; минимальная суточная доза и доза для длительной терапии (свыше 14 дней) — 1 табл. 2 раза; максимальная суточная доза — 3 табл. 2 раза.

Таблетки для детей и суспензия: детям 6 нед–5 мес — 1/2 ч.ложки (2,5 мл) 2 раза в день; 6 мес–5 лет — 1 ч.ложка (5 мл) 2 раза в день; 2-5 лет — 2 детские таблетки 2 раза в день, 6-12 лет — 2 ч.ложки (10 мл) 2 раза в день или 4 детские таблетки 2 раза в день.

Детям от 6 недель до 5 месяцев - по 0.5 мерной ложки сиропа два раза в сутки (утром и вечером), *от 6 месяцев до 5 лет* - по 1 мерной ложке сиропа (2 табл. для детей) два раза в сутки, *от 6 до 12 лет* - по 2 мерных ложки (1 таблетка) два раза в сутки. Этот режим дозирования примерно соответствует суточной дозе в 6 мг ТМП и 30 мг СМЗ на кг массы тела.

При тяжелых инфекциях дозы для детей можно увеличить на 50%.

Продолжительность лечения

При острых инфекциях Бактрим следует назначать на срок не менее 5 дней или до тех пор, пока симптомы у больного не будут отсутствовать в течение двух дней. Если через 7 дней терапии клинического улучшения не наступает, следует повторно оценить состояние больного для возможной коррекции лечения.

Побочные действия

Рекомендованные дозы Бактрима как правило, хорошо переносятся. Если побочные реакции и возникают, они, как правило, выражены слабо.

Описанные такие побочные явления (в порядке частоты возникновения):

желудочно-кишечные: тошнота (с рвоте или без), стоматит, диарея, единичные случаи гепатита, отдельные случаи псевдомембранозного энтероколита.

Кожные высыпания, которые обусловлены приёмом лекарств: они обыкновенно бывают легкими и быстро исчезают после отмены препарата. Как и во многих остальных препаратов, в единичных случаях прием Бактрима сопровождался развитием мультиформной эритемы, синдрома Стивенса-Джонсона и токсичным эпидермальным некролизом (синдромом Лайела).

Гематологические смены: большая часть изменений, что наблюдались, были слабо выраженными, бессимптомными и исчезали после отмены препарата. Чаще всего наблюдались лейкопения, нейтропения и тромбоцитопения. В крайне единичных случаях могут возникнуть агранулоцитоз, мегалобластная анемия, панцитопения или пурпура. Существуют сообщения про случаи панцитопении у пациентов, которые принимали комбинацию триметоприма с метотрексатом (см. "Взаимодействие с другими лекарственными

средствами").

Как и на другие препараты, у больных с повышенной чувствительностью могут возникнуть аллергические реакции.

Существуют сообщения про отдельные случаи лёгочных инфильтратов, подобных тем, что возникают при эозинофильном или аллергическом альвеолите. Они могут проявляться такими симптомами, как кашель или одышка. При внезапном появлении или усилении этой симптоматики нужно повторно обследовать больного и рассмотреть вопрос про приостановку лечения Бактримом.

Описанные единичные случаи возникновения асептического менингита или менингеальноподобной симптоматики.

Особые указания

У больных пожилого и старческого возраста, а также у больных с имеющимся дефицитом фолиевой кислоты или почечной недостаточностью при лечении Бактримом могут возникнуть гематологические смены, что указывают на брак фолиевой кислоты. Они исчезают после назначения фолиевой кислоты.

Больным, которые длительно лечатся Бактримом, необходимо регулярно делать общий анализ мочи и контролировать функцию почек.

Во время лечения нужно обеспечить достаточное поступление жидкости в организм.

Влияние на результаты лабораторных анализов.

Бактрим, а именно триметоприм, который входит в его состав, может повлиять на результаты выяснения концентрации метотрексата в сыворотке, проведенного методом конкурентного связывания с белками с применением бактериальной дигидрофолатредуктазы как лиганду. Однако, при определении метотрексата радиоиммунным методом интерференции не возникает.

Триметоприм и сульфаметоксазол могут также влиять на результаты реакции Яффе (выяснения креатинина за реакцией с пикриновой кислотой в щелочной среде), при этом в диапазоне нормальных значений результаты завышаются приблизительно на 10%.

Лекарственное взаимодействие

У больных пожилого и старческого возраста, что принимали в то же время некоторые диуретики (в основном, тиазиды), наблюдалась повышена частота тромбоцитопении.

Сообщалось, что у больных, которые принимают антикоагулянт варфарин, Бактрим может вызывать увеличение протромбинового времени. Про возможность таких взаимодействий следует помнить при назначении Бактрима больным, что уже получают антикоагулянты. В этих случаях необходимо еще раз определить время сворачивания крови.

Бактрим может угнетать печеночный метаболизм фенитоина. После назначения Бактрима в обыкновенных клинических дозах наблюдалось увеличение периода полувыведения фенитоина на 39% и снижение скорости его метаболического клиренса на 27%. При одновременном назначении обоих препаратов важно следить за излишней действием фенитоина.

Сульфонамиды могут также вытеснять метотрексат с связей с белками плазмы, увеличивая, таким образом, концентрации свободного метотрексата.

Существуют сообщения про случаи панцитопении у пациентов, которые принимали комбинацию триметоприма с метотрексатом (см. "Побочное действие"). Триметоприм имеет незначительное родство с чоловічою дегидрофолатною редуктазою однако может повысить токсичность метотрексата и повлечь развитие гематологической побочного взаимодействий с метотрексатом, особенно в присутствии остальных факторов риска - таких как старческий возраст, гипоальбуминемия, ухудшено функция почек, сниженный резерв костного мозга. Такое побочное действие препарата может проявиться особенно тогда, когда метотрексат дается в большой дозе. Рекомендуется лечить таких пациентов фолиевой кислотой или фолиномом кальция, чтобы избежать влияния на гемопоэз.

Бактрим может влиять на потребность в сахаропонижающих препаратах.

Отдельные сообщения позволяют допускать, что при одновременном назначении Бактрима больным, которые получают пириметамин для профилактики малярии в дозах более 25 мг в неделю, в них может

развиться мегалобластная анемия.

У больных после трансплантации почки, что в то же время получали триметоприм и сульфаметоксазол и циклоспорин, наблюдалось обратное ухудшение почечной функции.

Передозировка

Симптомы острой передозировки: тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, интеллектуальные и зрительные нарушения, в тяжелых случаях – кристаллурия, гематурия и анурия.

Симптомы хронического передозировка: торможение кроветворение (тромбоцитопения, лейкопения), а также другие патологические смены картины крови вследствие недостаточности фолиевой кислоты.

Лечение (в зависимости от симптоматики): усиление почечной экскреции путём форсированного диуреза (подщелачивание мочи способствует выведению), гемодиализ (перитонеальный диализ неэффективный). Необходимо контролировать картину крови и электролиты. При выраженных патологических сменах картины крови или желтухи назначают специфическое лечение. Для устранения действия триметоприма на кроветворение можно назначить фолинат кальция в дозе 3 - 6 мг в/м в течение 5 - 7 дней.

Условия хранения

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

Срок годности

5 лет.