

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Сульфадиметоксин

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Сульфадиметоксин

Международное непатентованное или группировочное наименование:
сульфадиметоксин

Лекарственная форма: таблетки.

Состав на одну таблетку

Действующее вещество: сульфадиметоксин – 500,0 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая – 42,0 мг, кросповидон (тип В) – 26,5 мг, повидон К 25 (поливинилпирролидон среднемoleкулярный К 25) – 25,5 мг, кальция стеарат – 6,0 мг.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с кремоватым оттенком цвета с фаской и риской.

Фармакотерапевтическая группа: противомикробное средство, сульфаниламид

Код АТХ: J01ED01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Противомикробное бактериостатическое средство. Механизм действия обусловлен конкурентным антагонизмом с парааминобензойной кислотой, угнетением дигидроптероатсинтетазы, нарушением синтеза тетрагидрофолиевой кислоты, необходимой для синтеза пуринов и пиримидинов. Активен в отношении

грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов: *Staphylococcus spp.*, *Streptococcus spp.*, в том числе *Streptococcus pneumoniae*, палочки Фридендера, *Escherichia coli*, *Shigella spp.*, *Chlamydia trachomatis*.

Фармакокинетика

При приеме внутрь всасывается относительно медленно, обнаруживается в крови через 30 мин. При однократном приеме (в дозе 1 - 2 г), время достижения максимальной концентрации в крови (T_{Cmax}) – 8 – 12 ч.

Терапевтическая концентрация у взрослых отмечается при приеме 1-2 г в 1 день и 0,5-1 г - в последующие дни. Связь с белками крови - 90-99%.

Препарат накапливается в крови, прежде всего за счет высокой степени связывания с протеинами крови (90-99%). Хорошо распределяется по органам и системам. Но в отличие от иных представителей сульфаниламидов длительного действия, плохо проникает через гемато-энцефалический барьер (ГЭБ) и его концентрация в ликворе низкая. Однако при воспалении менингеальных оболочек проницаемость ГЭБ резко возрастает.

Хорошо проникает в плевральную жидкость (60-90% от концентрации в крови), в билиарную систему, где его концентрации в 1,5-4 раза выше, чем в крови.

Преимущественный метаболизм осуществляется по пути микросомального глюкуронирования, связанного с цитохромом P450 и НАДФН-зависимого.

Прочная связь с белками плазмы крови и высокая реабсорбция в канальцах почек (93-97,5%), способствует медленному выведению препарата из организма.

В крови содержится 5-15% ацетилированных метаболитов, в моче - 10-25% ацетильных производных и 75-90% - глюкуронида сульфадиметоксина; последний хорошо растворим и не провоцирует развитие кристаллурии. Ацетильное производное не реабсорбируется и полностью выводится почками. Через 24 часа выводится 20-44% принятой дозы, через 48 ч - до 56%, через 96 ч - до 83,3%.

Показания для применения

Заболевания, вызванные чувствительной микрофлорой: ангина, отит, гайморит, бронхит, пневмония, дизентерия, пиодермия, рожистое воспаление, трахома; раневые инфекции; гонорея; заболевания мочевыводящих и желчных путей; малярия (в составе комплексной терапии).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к сульфадиметоксину или другим компонентам препарата; угнетение костномозгового кроветворения; почечная/печеночная недостаточность,

хроническая сердечная недостаточность, врожденный дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; порфирия; азотемия; беременность и период грудного вскармливания, детский возраст до 12 лет (для данной лекарственной формы и дозировки).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь, 1 раз в сутки.

Взрослым, в 1-ый день – 1 - 2 г, затем - по 0,5-1 г/сут.

Для детей от 12 до 18 лет: начальная и поддерживающая дозы равны соответственно – 1 г и 0,5 г.

После нормализации температуры, препарат в поддерживающих дозах применяют еще 2 - 3 дня. Курс лечения, в зависимости от тяжести болезни, составляет 7 – 14 дней.

Побочное действие

Аллергические реакции, головная боль, диспепсия, лейкопения, агранулоцитоз, холестатический гепатит.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Действие сульфадиметоксина усиливается при комбинированном приеме с производными диаминопиримидина (триметоприм, тетраоксоприм, пириметамин).

Снижает эффективность бактерицидных антибиотиков, действующих только на делящиеся микроорганизмы (в том числе пенициллины, цефалоспорины).

Фенитоин увеличивает риск развития токсических реакций.

Метотрексат и другие антагонисты фолиевой кислоты увеличивают риск развития дефицита фолиевой кислоты.

Прокаин, бензокаин и тетракаин снижают антибактериальную активность.

ПАСК и барбитураты усиливают противомикробное действие.

Салицилаты повышают активность и токсичность сульфадиметоксина.

Метоксален способствует развитию фотосенсибилизации.

Негормональные противовоспалительные препараты, тиацетазон, хлорамфеникол усиливают токсическое действие на кровь (лейкопения, агранулоцитоз). Усиливает действие антикоагулянтов непрямого действия, фенитоина, сульфаниламидов с гипогликемическим действием.

Производные пиразолона, индометацин и салицилаты увеличивают свободную фракцию препарата в крови.

Снижает эффективность пероральных контрацептивов. Усиливает метаболизм циклоспорина.

Особые указания

Во время терапии рекомендуется обильное питье, регулярный контроль показателей крови и мочи.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиями другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, 500 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Допускается контурные ячейковые упаковки помещать в ящик из гофрированного картона по 500 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя/организация, принимающая претензии потребителей

ОАО "Фармстандарт-Лексредства",
305022, Россия, г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18,
тел./факс: (4712) 34-03-13,
www.pharmstd.ru

Представитель

ОАО "Фармстандарт-Лексредства"

Е.В. Толстова