МИНЗДРАВ РОССИИ
030625
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Сульфадиметоксин

наименование лекарственного препарата

Таблетки, 500 мг

лекарственная форма, дозировка

АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»,
Российская Федерация
665462, Иркутская область, г. Усолье-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги

наименование юридического лица, адрес

Изменение № 1

Дата внесения Изменения «____»_030625_ 20___г.

Старая редакция	Новая редакция
1	2
Фармакологические свойства ***Фармакодинамика*** Противомикробное бактериостатическое средство, сульфаниламид длительного действия. 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., Streptococcus pneumonia,* палочки Фридлендера,	**Фармакологические свойства** ***Фармакодинамика*** Противомикробное бактериостатическое средство, сульфаниламид длительного действия. 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., Streptococcus pneumonia,* палочки Фридлендера,

Escherichia coli, Shigella spp., Chlamydia trachomatis. Сульфадиметоксин не действует на штампы бактерий, устойчивых к сульфаниламидам.	*Escherichia coli, Shigella spp., Chlamydia trachomatis.* Сульфадиметоксин не действует на штаммы бактерий, устойчивых к сульфаниламидам.
Фармакокинетика	***Фармакокинетика***
После приема внутрь через 30 мин обнаруживается в крови, время достижения максимальной концентрации в крови (TCmax) – 8-12 ч. Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ). Терапевтическая концентрация у взрослых отмечается при приеме 1-2 г в первый день и 0,5-1 г – в последующие дни. Препарат накапливается в крови, прежде всего за счет высокой степени связывания с протеинами крови (90-99 %). Хорошо распределяется по органам и системам. В отличие от других представителей сульфаниламидов длительного действия плохо проникает через гематоэнцефалический барьер 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 концентрация в 1,5-4 раза выше, чем в крови. В отличие от др. сульфаниламидов, метаболизм преимущественно осуществляется по пути микросомального глюкуронирования, никотинамидадениндинуклеотид-фосфат (НАДФ)-зависимого и связанного с цитохромом Р450.	После приема внутрь через 30 мин обнаруживается в крови, время достижения максимальной концентрации в крови (T_{Cmax}) – 8-12 ч. Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ). Терапевтическая концентрация у взрослых отмечается при приеме 1-2 г в первый день и 0,5-1 г – в последующие дни. Препарат накапливается в крови, прежде всего за счет высокой степени связывания с протеинами крови (90-99 %). Хорошо распределяется по органам и системам. В отличие от других представителей сульфаниламидов длительного действия плохо проникает через гематоэнцефалический барьер 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 концентрация в 1,5-4 раза выше, чем в крови. В отличие от др. сульфаниламидов, метаболизм преимущественно осуществляется по пути микросомального глюкуронирования, никотинамидадениндинуклеотидфосфат (НАДФ)-зависимого и связанного с цитохромом Р450.
Выводится медленно, прежде всего за счет удерживания в крови белками плазмы и за счет высокой степени реабсорбции в канальцах	Выводится медленно, прежде всего за счет удерживания в крови белками плазмы и за счет высокой степени реабсорбции в канальцах

почек (93-97,5 %). 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 ч выводится 20-44 % принятой дозы, через 48 ч – до 56 %, через 96 ч – до 83,3 %.	почек (93-97,5 %). 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 ч выводится 20-44 % принятой дозы, через 48 ч – до 56 %, через 96 ч – до 83,3 %.
С осторожностью Анемии со сниженным цветовым показателем, дефицит фолиевой кислоты, нарушения функции печени, нарушения функции почек	**С осторожностью** Анемии со сниженным цветовым показателем, дефицит фолиевой кислоты, нарушения функции печени, нарушения функции почек.
Побочное действие *Со стороны нервной системы:* головная боль, головокружение. *Со стороны дыхательной системы:* бронхоспазм. *Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, снижение аппетита, диарея, гастрит, боль в животе, холестаз, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатит, гепатонекроз. *Со стороны органов кроветворения:* лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, мегалобластная анемия, эозинофилия, панцитонемия. *Со стороны мочевыделительной системы:* полиурия, полидепсия, интерстициальный или тубулярный нефрит, кристаллурия, гематурия, повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия, токсическая нефропатия с олигурией и анурией.	**Побочное действие** *Со стороны нервной системы:* головная боль, головокружение. *Со стороны дыхательной системы:* бронхоспазм. *Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, снижение аппетита, диарея, гастрит, боль в животе, холестаз, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатит, гепатонекроз. *Со стороны органов кроветворения:* лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, мегалобластная анемия, эозинофилия, панцитонемия. *Со стороны мочевыделительной системы:* полиурия, полидепсия, интерстициальный или тубулярный нефрит, кристаллурия, гематурия, повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия, токсическая нефропатия с олигурией и анурией.

Кожные покровы: фотодерматоз *Со стороны опорно-двигательного аппарата:* артралгия, миалгия. *Аллергические реакции:* фотосенсибилизация, кожная сыпь, крапивница, экзантемы, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), эксфолиативный дерматит, повышение температуры тела, ангионевротический отек, гиперемия склер. Нарушение функции щитовидной железы.	*Кожные покровы:* фотодерматоз. *Со стороны опорно-двигательного аппарата:* артралгия, миалгия. *Аллергические реакции:* фотосенсибилизация, кожная сыпь, крапивница, экзантемы, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), эксфолиативный дерматит, повышение температуры тела, ангионевротический отек, гиперемия склер. Нарушение функции щитовидной железы.
Взаимодействие с другими лекарственными препаратами Снижает эффективность бактерицидных антибиотиков, действующих только на делящиеся микроорганизмами (в т.ч. пенициллины, цефалоспорины). Прокаин, бензокаин и тетракаин снижают антибактериальную активность. Пара-аминосалициловая кислота (ПАСК) и барбитураты усиливают противомикробное действие. Салицилаты повышают активность и токсичность. Метотрексат и фенитоин повышают токсичность сульфадиметоксина. Нестероидные противовоспалительные препараты, тиоацетазон, хлорамфеникол усиливают токсическое действие на кровь (лейкопения, агранулоцитоз). Усиливает действие антикоагулянтов непрямого действия, фенитоина, сульфаниламидов с гипогликемическим действием; производные пиразолона,	**Взаимодействие с другими лекарственными препаратами** Снижает эффективность бактерицидных антибиотиков, действующих только на делящиеся микроорганизмы (в т.ч. пенициллины, цефалоспорины). Прокаин, бензокаин и тетракаин снижают антибактериальную активность. Пара-аминосалициловая кислота (ПАСК) и барбитураты усиливают противомикробное действие. Салицилаты повышают активность и токсичность. Метотрексат и фенитоин повышают токсичность сульфадиметоксина. Нестероидные противовоспалительные препараты, тиоацетазон, 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. Миелотоксические ЛС усиливают проявления гематотоксичности препарата.	индометацин и салицилаты увеличивают свободную фракцию препарата в крови. Снижает эффективность пероральных контрацептивов. Усиливает метаболизм циклоспорина. Миелотоксические ЛС усиливают проявления гематотоксичности препарата.
Предприятие-производитель / Организация, принимающая претензии АО «Усолье-Сибирский химфармзавод», Россия, 665462, Иркутская область, г. Усолье-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги. Тел./факс: +7 (39543) 58910, +7 (39543) 58908.	**Предприятие-производитель / Организация, принимающая претензии** АО «Усолье-Сибирский химфармзавод», 665452, Россия, Иркутская обл., г.о. город Усолье-Сибирское, тер. Промышленный массив, ул. Индустриальная, зд.62. Тел.: +7 (395) 435-89-08.

Генеральный директор

АО «Усолье-Сибирский химфармзавод» С.В. Тюстин