

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
СУЛЬФАДИМЕТОКСИН
(SULFADIMETHOXINE)

Склад:
діюча речовина: сульфадиметоксин;
1 таблетка містить 500 мг сульфадиметоксину у перерахуванні на 100 % суху речовину;
допоміжні речовини: кремнію діоксид колоїдний безводний, крохмаль картопляний, желатин, кальцію стеарат.

Лікарська форма.
Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Протимікробні засоби для системного застосування.
Код АТС J01E D01.

Клінічні характеристики.

Показання.
Інфекційно-запальні захворювання, спричинені чутливими до сульфадиметоксину мікроорганізмами: пневмонія, бронхіт, ангіна, отит, гайморит, запальні захворювання жовчовивідних та сечовивідних шляхів, дизентерія, гонорея, бешкетне запалення, піодермія, трахома, ранові інфекції, резистентні форми малярії (у поєднанні з протималарійними препаратами).

Протипоказання.

Наявність в анамнезі токсико-алергічних реакцій на сульфаніаміди (агранулоцитоз, гемолітична анемія, медикаментозна пропасниця, тяжкий дерматит, гепатит) або інші прояви підвищеної чутливості до сульфадиметоксину або до будь-якого компонента препарату, до інших сульфаніамідів або їх похідних;
пригнічення кістково-мозкового кровообігу;
ніркова та/або печінкова недостатність;
гостра порфірія;
декомпенсована хронічна серцева недостатність;
азотемія;
дефіцит 1 глюкозо-6-фосфатдегідрогенази (можливий гемоліз);
період вагітності або годування груддю;
діти віком до 3 років.

Спосіб застосування та дози.

Сульфадиметоксин приймають після їди 1 раз на добу з інтервалом між прийомами препарату 24 години. Тривалість курсу лікування залежить від тяжкості захворювання та становить 7–14 днів (після нормалізації температури – 2-3 дні).
Дорослим Сульфадиметоксин призначають у перший день лікування у дозі 1 г
(2 таблетки), у наступні дні - по 500 мг (1 таблетка) на добу. При з'явленні побічних ефектів

закорювання доза може бути збільшена до 2 г на добу в перший день лікування, у наступні дні – до 1 г.
Дітям віком від 3 до 12 років препарат у перший день призначають у дозі 25 мг/кг, у наступні дні – по 12,5 мг/кг на добу; дітям віком від 12 років початкова та підтримуюча дози становлять 1 г (2 таблетки) і 500 мг (1 таблетка) відповідно.

Побічні реакції.

Можливі такі побічні реакції, як при застосуванні інших сульфаніламідів.

Трива системи:

біль у ділянці живота, диспептичні явища, у тому числі нудота, блювання, метеоризм, діарея, аворексія, стоматит, панкреатит, шлунково-кишкова кровотеча, псевдомембранозний коліт.

Нервова система:

головний біль, неврологічні реакції, включаючи аспетичний менингіт, апатію, незначну внутрішньочерепну гіпертензію, судоми, запаморочення, сонливість, відчуття втоми, безсоння, депресія, периферичні або оптичні невралії, психоз.

Імуна система:

алергічні реакції: свербіж, шкірні висипання (включаючи кропив'яку), медикаментозна гарячка, фотосенсибілізація, ексфолиативний дерматит, токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла), вузликова еритема, синдром Стивенса-Джонсона, сироваткоподібний синдром, анафілактичні реакції, періорбітальний набряк, ангіоневротичний набряк. Крім того, повідомлялося про випадки розвитку алергічного мочажарту, вузликового периаерітару, системного червоного вовчка.

Гепатобіліярна система:

підвищення рівня печінкових трансаміназ, гепатомегалія, зрідка жовтяниця, гепатит, можливий гепатонекроз.

Кров та лімфатична система:

дуже рідко - агранулоцитоз, апластична анемія, тромбоцитопенія, лейкопенія, созинофілія, гіпопротромбемія, гемолітична анемія при дефіциті глюкозо-6-фосфатдегідрогенази, пурпура, метемоглобінемія.

Сечовидільна система:

кристалурія (можливо, з ноперексовим болем, гематурією, олігурією, анурією), зменшити ризик якої можливо при застосуванні препарату з достатньою кількістю рідини, лікується піддуженням сечі; можливі нефротоксичні реакції: інтерстиціальний нефрит, тубулярний некроз, ниркова недостатність.

Ендокринна система:

гіпотиреоз, гіпогілакемія.

Респіраторна система:

кашель, біль у горлі; задняка, легесені інфільтрати, фіброзуючий альвеоліт.

Інше: тахікардія, артерійт, васкуліт, сіаломедит, болі в суглобах, м'язовий біль.

При появі побічних реакцій слід негайно припинити прийом препарату.

Передозування.

Симптоми: аворексія, спастичні болі в животі, нудота, блювання, запаморочення, головний біль, сонливість, втрата свідомості. Можливі гіпертермія, гематурія, кристалурія. Патологічні зміни крові (лейкопенія, агранулоцитоз, гемолітична анемія) і жовтяниця є пізнішими проявами передозування. Можливий розвиток метемоглобінемії.

Лікування: негайнеприпинення прийому препарату, промивання шлунка, повільний послідовний режим лиття розчинів, вживаютьжовтій сечу; при зниженні діурезу та нормальній функції нирок – внутрішньовенне введення розчину. У подальшому – лікування симптоматичне.

При підтвердженні метемоглобінемії показано внутрішньовенне введення 1% метиленового синього.

Перитонеальний діаліз не ефективний, гемодіаліз лише помірно ефективний у лікуванні передозування сульфаніламідів.

Застосування у період вагітності або содування дитини.

Сульфадиметоксин не рекомендується застосовувати у період вагітності (ризик розвитку жовтяниці та білірубінової енцефалопатії у новонароджених, особливо у недоношенців).

При необхідності прийому препарату на період лікування годування груддю слід припинити (сульфадиметоксин проникає у грудне молоко, тому існує ризик розвитку білірубінової енцефалопатії у новонароджених, а також гемолітичної анемії у дітей з дефіцитом глюкозо-6-фосфатдегідрогенази).

Діти.

Препарат застосовують дітям віком від 3 років.

Особливості застосування.

Клінічні ознаки, такі як висип, біль у горлі, підвищення температури, біль у суглобах, більість, пурпура або жовтяниця можуть бути рівними ознаками серйозної реакції при застосуванні сульфаніламідів, включаючи сульфадиметоксин.

Кашель, задняка і легесені інфільтрати є проявами реакції гіперчутливості дихальних шляхів та бувають зрештовою на фоні лікування сульфаніламідями.

Прийом сульфаніламідів, включаючи сульфадиметоксин, необхідно припинити при появі *перших* ознак на шкірі або *привуль-жовт* ознаках негативної реакції. У рідкісних випадках після появи висипу на шкірі можуть розвинутися серйозні реакції, такі яксиндром Стивенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз, гепатонекроз і серйозні зміни з боку системи крові.

Летальні випадки, зумовлені застосуванням сульфаніламідів, спостерігалися вкрай рідко, виникали внаслідок серйозних побічних реакцій, включаючи синдром Стивенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз, фульмінантний гепатонекроз, агранулоцитоз, апластичну анемію та інших патологічних станів з боку системи крові.

Ризик виникнення псевдомембранозного коліту, який може варіювати від легких форм до таких, що загрожують життю, існує при застосуванні практично всіх антибактеріальних засобів, у тому числі і сульфаніламідів (у результаті надмірного ростуClostridium difficile). Тому важливо розглядати можливість цього ускладнення у пацієнтів з діареєю для вирішення подальшої тактики лікування.

Сульфадиметоксин слід призначати з обережністю пацієнтам з порушеннями функцій нирок, печінки, хронічною серцевою недостатністю, з тяжкою формою алергічних захворювань або бронхіальною астмою, із захворюваннями системи крові.

З обережністю слід застосовувати сульфаніламідям, у тому числі сульфадиметоксин, у пацієнтів з нирковим діабетом, оскільки сульфаніламідями можуть вплинути на рівень цукру в крові.

При лікуванні препаратом необхідно проводити систематичний контроль стану функцій

нирок і картини периферичної крові, рівень глюкози в крові.

Оскільки сульфаніаміди є бактеріостатичними, а не бактеріцидними препаратами, необхідний повноцінний курс терапії для запобігання рецидиву інфекції і розвитку стійких форм мікроорганізмів.

Пацієнтам необхідно споживати достатньо рідини для запобігання кристалурії і розвитку уролітіазу.

Слід уникати призначення препарату пацієнтам старше 65 років у зв'язку з підвищенням ризику розвитку тяжких побічних ефектів.

Рекомендується уникати вживання прямих сонячних променів і штучного ультрафіолетового опромінення з огляду на можливість розвитку фотосенсибілізації при застосуванні сульфаніламідів.

Під час лікування препаратом необхідно дотримуватися режиму дозування, застосовувати рекомендовану дозу з інтервалом в 24 години, не пропускати прийому. У випадку пропуску дози не подвоювати наступну дозу.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Діюю не буде з'ясована індивідуальна реакція пацієнта на препарат, слід утримуватись від керування автотранспортом або іншими механізмами, враховуючи, що під час лікування сульфадиметоксином можливі такі побічні реакції з боку нервової системи як запаморочення, судоми, апатія, сонливість, депресія, психоз.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Нестероїди протизапальні засоби, похідні сульфонілсечовини, антигормонотичні засоби, антагоністи вітаміну К – при одночасному застосуванні підсилюється дія цих препаратів. Фолиєва кислота, бактеріцидні антибіотики (у тому числі пеніциліни, цефалоспори́ни) – зникається ефективність сульфадиметоксину.

При застосуванні сульфадиметоксину разом з ПАСК та барбітуратами посилюється активність сульфадиметоксину; з метотрексатом, фенітоїном та дифеніном – токсичність сульфадиметоксину.

Похідні ніразолону, індометацин і саліцилати – посилюють активність і токсичність препарату.

При одночасному застосуванні препарату з еритромицином, лізоцицином, тетрациклином – взаємно посилюється антибактеріальна активність, розширюється спектр дії; з рифампіцином, стрептоміцином, мономіцином, канамицином, гентаміцином, похідними оксикіноліну (нітросолозіном) – антибактеріальна дія препаратів не змінюється; з кислотою палладієвою (оксипалладієм) – спостерігається антагонізм; з хлорофанолом, нітрофураном – зниження суларного ефекту.

Бактеріцидні антибіотики, пероральні контрацептиви – при одночасному застосуванні зникається дія цих препаратів.

Препарат не призначають одночасно з гексаметиленгетраміном (уротропіном), з антидіабетичними препаратами (похідними сульфонілсечовини), з дифеніном, неоцимаріном та іншими непраями антикоагулянтами.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Сульфадиметоксин – сульфаніламідний препарат тривалої дії. Механізм дії зумовлений конкурентним антагонізмом з парааминобензойною кислотою (ПАБК) та конкурентним пригніченням бактеріального ферменту дигідротероасинтетази, що відповідає за будовування ПАБК у дигідрофолієву кислоту, безпосереднього попередника фолатів кислоти. Це блокує синтез дигідрофолієвої кислоти і зменшує кількість метаболічно активної тетрагідрофолієвої кислоти, кофактора синтезу пурини, тимідину та ДНК.

Чутливими бактеріями є ті, які синтежують фолиєву кислоту.

Ефективний відносно грампозитивних та грамотригативних мікроорганізмів: пневмококів, стафілококів, стрептококів, кишкової палички, палички Фрідлєндера, збудників дизентерії, менш активний щодо протей.

Активний щодо збудника трахоми.

Сульфадиметоксин не діє на пативні бактерії, стійких до сульфаніламідів.

Фармакокінетика. При прийомі внутрішньо всмогтується відносно повільно і вгазначається в крові протягом 120 годин. При одноразовому прийомі 1 г максимальна концентрація спостерігається через 8-12 годин, підтримуючі дози 0,5-1 г забезпечують необхідний терапевтичний рівень препарату в крові протягом курсу лікування.

З білками плазми крові зв'язується на 90-98 %.

При повторних введеннях накопичується в крові.

Добре проникає у плевральну рідину, вміст в якій становить 60-90 % від концентрації в крові, проте, на відміну від інших сульфаніламідів тривалої дії, проникає крів гематоенцефалічний бар'єр у незначній кількості.

Елімінується печінкою, у високих концентраціях спостерігається в жовчі.

Сульфадиметоксин належить до групи сульфаніламідів тривалої дії, період його напіввиведення – 41 година.

Препарат дуже повільно виводиться з організму за рахунок високого рівня реабсорбції у канальцях нефрону і значного ступеня зв'язування з білками плазми крові. Вагетилізованій формі не реабсорбується у нирках і виводиться з організму (через 96 годин – до 83,3 %). У сечі міститься в основному (75-90 %) у вигляді глюкуроніду, який добре розчиняється у кислому середовищі і не випадіє в осад.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

Таблетки білого або білого з кремоватим відтінком кольору, круглої форми з плоскою поверхнею, фасками та рискою з однієї сторони.

Термін придатності.

5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у контурній безцарунковій упаковці. По 10 таблеток у blisterі.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ «Агрофарм»

Місцезнаходження.

Україна, 08200, Київська обл., м. Ірпін, вул. Центральна, 113-А.