

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Сультасин®

**Регистрационный номер:** P N003619/01

**Торговое наименование:** Сультасин®

**Международное непатентованное или группировочное наименование:**

Ампициллин + [Сульбактам]

**Лекарственная форма:** порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения

**Состав на 1 флакон:** **500 мг + 250 мг** **1000 мг + 500 мг**

*Действующие вещества:*

Ампициллин натрия	531,5 мг	1063,0 мг
(в пересчете на ампициллин)	500 мг	1000 мг
Сульбактам натрия	273,5 мг	547,0 мг
(в пересчете на сульбактам)	250 мг	500 мг

**Описание:** порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета. Гигроскопичен.

**Фармакотерапевтическая группа:** антибиотик-пенициллин полусинтетический+бета-лактамаз ингибитор

**Код АТХ:** J01CR01

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Ампициллин+сульбактам – комбинированный препарат с широким спектром антибактериального действия.

Антибактериальным компонентом препарата является ампициллин - антибиотик из группы полусинтетических пенициллинов, бактерицидное действие которого связано с угнетением синтеза белков клеточной стенки микроорганизмов. Сульбактам – необратимый ингибитор бета-лактамаз; расширяет спектр активности ампициллина в отношении устойчивых штаммов, резистентность которых развивается под воздействием бета-лактамаз; не изменяет активности ампициллина в отношении чувствительных штаммов; связываясь с некоторыми пенициллинсвязывающими белками бактерий, проявляет синергизм при одновременном применении с бета-лактамами антибиотиками. Стабилен в водном растворе, обладает самостоятельной антибактериальной активностью в

отношении семейства *Neisseriaceae* и *Acinetobacter spp.*, устойчив к действию большинства плазмидных бета-лактамаз.

Ампициллин+сульбактам активен в отношении следующих микроорганизмов:

Аэробные грамположительные бактерии: *Staphylococcus aureus* (продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Staphylococcus epidermidis* (продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Staphylococcus saprophyticus* (продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus pneumoniae* (в том числе штаммы, устойчивые к пенициллину), *Streptococcus spp.* группы *viridans*, *Enterococcus faecalis*, *Listeria monocytogenes*.

Аэробные грамотрицательные бактерии: *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Klebsiella spp.*, *Neisseria gonorrhoeae* (продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Moraxella catarrhalis* (продуцирующие и непродуцирующие бета-лактамазу штаммы), *Morganella morganii*, *Haemophilus influenzae* (в том числе штаммы, устойчивые к ампициллину), *Providencia rettgeri*, *Providencia stuartii*.

Анаэробные микроорганизмы: *Bacteroides spp.*, включая *Bacteroides fragilis*, *Clostridium spp.* (кроме *Clostridium difficile*), *Peptococcus spp.*, *Peptostreptococcus spp.*

Резистентны: метициллиноустойчивые *Staphylococcus spp.*, *Citrobacter spp.*, большинство штаммов *Enterobacter spp.*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Mycobacterium spp.*, *Clostridium difficile*, *Chlamydia pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae*.

### **Фармакокинетика**

Максимальные сывороточные концентрации ( $C_{max}$ ) ампициллина и сульбактама после внутривенного (в/в) введения 1,5 г и 3,0 г препарата составляют 40-71 мкг/мл и 109-150 мкг/мл для ампициллина; 21-40 мкг/мл и 48-88 мкг/мл для сульбактама соответственно. После внутримышечной (в/м) инъекции 1,5 г ампициллина+сульбактам  $C_{max}$  ампициллина варьируется от 8 мкг/мл до 37 мкг/мл,  $C_{max}$  сульбактама - от 6 мкг/мл до 24 мкг/мл. Степень связывания с белками плазмы крови составляет 28 % для ампициллина и 38 % для сульбактама.

Ампициллин и сульбактам хорошо распределяются в различных тканях и жидкостях. Терапевтические концентрации после в/м и в/в введения создаются в перитонеальной и плевральной жидкостях, интерстициальной жидкости, кишечной стенке, органах малого таза, коже и подкожной клетчатке. Плохо проникают через гематоэнцефалический барьер, при воспалении мозговых оболочек проницаемость в спинномозговую жидкость возрастает. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) ампициллина и сульбактама составляет в среднем около 1 ч. Оба компонента препарата экскретируются преимущественно почками в неизменном виде. От 75 % до 85 % от введенной дозы ампициллина и сульбактама

выводятся почками в течение первых 8 часов. У пациентов с различной степенью нарушений функции почек  $T_{1/2}$  компонентов препарата увеличивается, что требует коррекции дозы и режима введения препарата.

### **Показания к применению**

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к ампициллину+сульбактаму штаммами микроорганизмов:

- инфекции ЛОР-органов (в т.ч. синусит, средний отит, тонзиллит);
- инфекции органов дыхания (острый и обострение хронического бронхита, пневмония, абсцесс легкого, эмпиема плевры);
- инфекционный эндокардит;
- бактериальный менингит;
- сепсис;
- интраабдоминальные инфекции (холецистит, холангит, перитонит, абсцесс брюшной полости);
- инфекции мочевыводящих путей (острый и обострение хронического пиелонефрита, пиелит);
- инфекционно-воспалительные заболевания органов малого таза (сальпингит, сальпингоофорит, tuboовариальный абсцесс, эндометрит, пельвиоперитонит);
- гонококковая инфекция;
- инфекции кожи и мягких тканей (рожа, абсцесс, флегмона, раневая и послеоперационная инфекция);
- инфекции костей и суставов.

Профилактика послеоперационных осложнений при операциях на органах брюшной полости и малого таза.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата и другим бета-лактамам антибиотикам (другим пенициллинам, цефалоспорином и карбапенемам); инфекционный мононуклеоз (в т.ч. при появлении кореподобной сыпи), лимфолейкоз. Безопасность применения ампициллина+сульбактама у пациентов с терминальной стадией хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 5 мл/мин) не установлена.

При использовании лидокаина в качестве растворителя: повышенная чувствительность к местным анестетикам амидного типа, тяжелый шок, блокада внутрисердечной проводимости, тяжелая сердечная недостаточность.

Перед внутримышечной инъекцией ампициллина+сульбактама с использованием лидокаина или прокаина необходимо исключить наличие противопоказаний к лидокаину или прокаину. Противопоказания к применению лидокаина и прокаина приведены в инструкции по медицинскому применению лидокаина и инструкции по медицинскому применению прокаина.

### **С осторожностью**

Бронхиальная астма, поллиноз и другие аллергические заболевания, почечная недостаточность, хронические заболевания желудочно-кишечного тракта в анамнезе, ранее перенесенный колит, связанный с применением антибактериальных препаратов, нарушения функции почек, пожилой возраст.

### **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Применение во время беременности возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Ампициллин и сульбактам проникают в грудное молоко в низких концентрациях. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

### **Способ применения и дозы**

Внутривенно (струйно и капельно), внутримышечно. Способ введения зависит от тяжести инфекции и выбранной дозы. Далее указаны суммарные дозы ампициллина и сульбактама (в соотношении 2:1).

*У взрослых и детей старше 12 лет и массой тела более 40 кг:* для лечения инфекций средней степени тяжести вводят в/м или в/в по 1,5 г каждые 6 часов. При тяжелых инфекциях - по 3 г каждые 6 часов. Максимальная суточная доза сульбактама не должна превышать 4 г, что соответствует суточной дозе препарата равной 12 г.

Лечение следует продолжать как минимум в течение еще 2-3 дней после исчезновения клинических симптомов заболевания. Продолжительность лечения составляет 5-14 дней, однако в более тяжелых случаях ее можно увеличить или назначить дополнительно ампициллин.

*При неосложненной гонорее* – 1,5 г однократно.

Для профилактики послеоперационной инфекции – 1,5-3 г во время анестезии, затем в течение 24 часов после операции в той же дозе каждые 6-8 часов.

*У детей старше 1 месяца и до 12 лет (или массой тела менее 40 кг)* препарат вводят в дозе 150 мг/кг в сутки, которую делят на 3-4 введения. При тяжелом течении инфекции доза может быть увеличена до 300 мг/кг/сут. Продолжительность курса терапии не должна превышать 14 дней.

У недоношенных новорожденных и детей первой недели жизни суточная доза препарата составляет 75 мг/кг, которую делят на два введения.

У детей в возрасте от 7 дней до 28 дней препарат назначают в дозе 150 мг/кг в сутки, разделенную на 3 в/в введения.

У пациентов с нарушениями функции почек коррекцию режима дозирования производят в зависимости от значений клиренса креатинина (КК).

Клиренс креатинина, мл/мин	T <sub>1/2</sub> , ч	Рекомендуемый режим введения
≥ 30	1	1,5-3 г каждые 6-8 ч
15-29	5	1,5-3 г каждые 12 ч
5-14	9	1,5-3 г каждые 24 ч

У детей с почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин) препарат вводят в обычных разовых дозах (50-75 мг/кг), увеличивая интервалы между введениями, как это указано у взрослых.

#### **Приготовление растворов**

Для приготовления раствора для в/м введения в качестве растворителя используют стерильную воду для инъекций, 0,5 % раствор прокаина, 0,5 % раствор лидокаина, 0,9 % раствор натрия хлорида.

Следующие минимальные количества растворителя добавляют непосредственно во флакон с порошком антибиотика:

во флакон, содержащий 1,5 г препарата - 4 мл растворителя;

во флакон, содержащий 0,75 г препарата - 2 мл растворителя.

Полученный раствор вводят глубоко внутримышечно в участки тела с выраженным мышечным слоем (верхненаружный квадрант ягодицы или латеральная поверхность бедра). Рекомендуется провести тест на аспирацию, чтобы избежать нежелательного введения раствора в кровеносный сосуд.

#### **Препарат, разведенный лидокаином или прокаином, нельзя вводить внутривенно.**

Для приготовления раствора для в/в струйного введения в качестве растворителя используют стерильную воду для инъекций либо 0,9 % раствор натрия хлорида.

Следующие минимальные количества растворителя добавляют непосредственно во флакон с порошком антибиотика:

во флакон, содержащий 1,5 г препарата - 20 мл растворителя;

во флакон, содержащий 0,75 г препарата - 10 мл растворителя.

Полученный раствор вводят внутривенно медленно в течение 3-5 мин. Раствор препарата Сульфасин® можно вводить непосредственно в вену или в трубку инфузионной системы, если пациент получает инфузионную терапию.

Для в/в капельного введения: приготовленный, как указано выше, раствор переносят во флакон, содержащий 100-200 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 5 % раствора декстрозы; вводят со скоростью 60-80 капель в минуту.

### **Побочное действие**

*Аллергические реакции:* крапивница, гиперемия кожи, кожный зуд, отек Квинке, ринит, конъюнктивит, лихорадка, артралгия, анафилактический шок, синдром Стивенса-Джонсона, мультиформная экссудативная эритема, токсический эпидермальный некролиз.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, снижение аппетита, диарея, метеоризм, глоссит, псевдомембранозный колит, повышение активности «печеночных» трансаминаз.

*Со стороны органов кроветворения:* гемолитическая анемия, снижение гемоглобина, тромбоцитопения, эозинофилия, лейкопения, нейтропения, лимфопения, лимфоцитоз, тромбоцитоз, моноцитоз, ложноположительная проба Кумбса.

*Со стороны центральной нервной системы:* сонливость, головная боль.

*Лабораторные показатели:* азотемия, повышение концентрации мочевины в плазме крови, гиперкреатининемия, снижение содержания сывороточного белка, лейкоцитурия, цилиндрурия.

*Местные реакции:* при в/м введении - болезненность в месте инъекции, при в/в введении - флебит, тромбфлебит.

*Прочие:* недомогание, боль в груди, боль в горле, дизурия, отеки, кровоточивость, при длительном лечении - кандидамикоз, развитие суперинфекции.

### **Передозировка**

*Симптомы:* неврологические нарушения вплоть до судорог (особенно у пациентов с нарушением функции почек), тошнота, рвота, диарея, нарушение водно-электролитного баланса (как следствие рвоты и диареи).

*Лечение:* симптоматическая терапия; в тяжелых случаях - гемодиализ.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

При одновременном применении с непрямыми антикоагулянтами ампициллин+сульбактам потенцирует их действие; снижает эффективность пероральных контрацептивов, лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется парааминобензойная кислота и этинилэстрадиол (риск развития кровотечений «прорыва»).

При одновременном применении с аминогликозидами наблюдается выраженный синергизм бактерицидного действия в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий. Фармацевтически несовместим с продуктами крови или

белковыми гидролизатами, аминогликозидами. При одновременном применении препарата с аминогликозидами не следует смешивать препараты в одном шприце или одной инфузионной системе; при в/м введении вводить в разные участки тела; при в/в введении вводить отдельно, соблюдая определенную последовательность с как можно большим временным интервалом между введениями, либо использовать отдельные внутривенные катетеры.

Пробенецид, аллопуринол, фенилбутазон, нестероидные противовоспалительные препараты снижают канальцевую секрецию ампициллина и сульфактама и повышают их период полувыведения. Диуретики снижают клиренс пенициллинов.

Бактерицидные антибиотики (в т.ч. цефалоспорины, циклосерин, ванкомицин, рифампицин, аминогликозиды) оказывают синергидное действие; бактериостатические антибиотики (в т.ч. макролиды, хлорамфеникол, линкозамиды, тетрациклины) - антагонистическое.

Одновременное применение ампициллина и аллопуринола увеличивает риск развития кожной сыпи.

### **Особые указания**

При длительном применении препарата необходимо проводить периодический контроль функций почек, печени и общего анализа крови.

Перед началом терапии должен быть собран тщательный анамнез на предмет предыдущих аллергических реакций на бета-лактамы антибиотики.

При применении практически всех антибиотиков широкого спектра действия возможно развитие *Clostridium difficile*-ассоциированной диареи, которая может протекать как легкая спонтанно проходящая диарея, так и в форме псевдомембранозного колита - тяжелого заболевания, сопровождающегося общими симптомами (лихорадка, симптомы дегидратации и электролитных расстройств, в том числе тахикардия, артериальная гипотония, вентиляционные нарушения, высокий лейкоцитоз), частым жидким стулом, иногда с примесью крови, болями в животе. Регистрировались случаи возникновения *Clostridium difficile*-ассоциированной диареи спустя несколько недель и даже месяцев после прекращения применения антибиотиков.

При подозрении или установленном диагнозе псевдомембранозного колита ампициллин+сульбактам следует отменить и назначить соответствующее лечение (метронидазол, ванкомицин per os, энтеросорбенты, инфузионная терапия). В таких случаях нельзя применять лекарственные средства, угнетающие моторику кишечника.

При лечении больных, получающих диету с низким содержанием натрия, необходимо учитывать, что 3000 мг препарата содержат примерно 230 мг (10 ммоль) натрия.

При курсовом лечении необходимо проводить контроль за состоянием функции органов кроветворения, печени и почек.

Возможно развитие суперинфекции за счет роста нечувствительной к препарату микрофлоры, что требует соответствующего изменения антибактериальной терапии.

Во время лечения возможна ложноположительная прямая проба Кумбса и ложноположительная реакция мочи на глюкозу (при использовании методов Бенедикта или Фелинга).

При лечении пациентов с сепсисом возможно развитие реакции бактериолиза (реакция Яриша-Герксгеймера).

#### **Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами**

Данных об отрицательном влиянии препарата в рекомендуемых дозах на способность к управлению транспортными средствами или работе с механизмами нет. Однако, учитывая вероятность побочных эффектов со стороны центральной нервной системы, следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

#### **Форма выпуска**

Порошок для приготовления раствора для внутривенного и внутримышечного введения 500 мг + 250 мг, 1000 мг + 500 мг.

По 500 мг + 250 мг, 1000 мг + 500 мг во флаконы стеклянные 1-го гидролитического класса вместимостью 10 или 20 мл, герметично укупоренные пробками резиновыми, обжатými колпачками алюминиевыми или колпачками комбинированными алюминиевыми с пластмассовыми крышками.

1, 10 флаконов с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

50 флаконов с равным количеством инструкций по применению помещают в коробки из картона для поставки в стационары.

#### Упаковка с растворителем:

«Натрия хлорид растворитель для приготовления лекарственных форм для инъекций 0,9%» в стеклянных ампулах по 5 мл

или

«Вода для инъекций» в стеклянных ампулах по 5 мл.

1 флакон с препаратом, 1 или 2 ампулы с растворителем помещают в контурную ячейковую упаковку.

1 контурную ячейковую упаковку со скарификатором ампульным и инструкцией по применению препарата помещают в пачку из картона.



При использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой скарификатор ампульный не вкладывают.

**Условия хранения**

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

**Срок годности**

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

**Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

**Владелец регистрационного удостоверения / Производитель / Организация, принимающая претензии потребителей**

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»), Россия

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Телефон: 8-800-600-00-80

e-mail: [contact@ksintez.ru](mailto:contact@ksintez.ru)

[www.ksintez.ru](http://www.ksintez.ru)

Директор по регуляторике и исследованиям

Г.У. Сетдекова