

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства
САЛОФАЛЬК®

МНН: Месалазин



Общая характеристика

Однородная суспензия от светло-коричневого до коричневого цвета, не содержит посторонних частиц.

Состав лекарственного средства

Каждый флакон (= 60 мл суспензии) содержит: месалазина (5-аминосалициловой кислоты) - 4,0 г; вспомогательные вещества: калия метабисульфит (Е 224), натрия бензоат (Е 211), карбомер 934Р (карбопол 974Р), динатрия эдетат (в виде динатрия эдетата дигидрата), калия ацетат (Е 261), ксантановая камедь (Е 415), вода очищенная.

Лекарственная форма

Суспензия ректальная.

Фармакотерапевтическая группа: кишечные противовоспалительные средства.

Код ATХ: A07EC02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Исследования *in vitro* продемонстрировали, что, возможно, роль играет ингибирование фермента липоксигеназы.

Также было продемонстрировано воздействие на концентрации простагландинов в слизистой оболочке кишечника. Месалазин (5-аминосалициловая кислота / 5-АСК) может также выступать в качестве акцептора радикалов активных соединений кислорода.

При попадании в просвет кишечника введенный ректально месалазин оказывает значительное местное действие на кишечную слизистую оболочку и на подслизистые слои.

Фармакокинетика

Общие свойства месалазина:

Всасывание

Месалазин всасывается наиболее эффективно в проксимальных отделах и наименее эффективно в дистальных отделах кишечника.

Биотрансформация

Месалазин подвергается пресистемному метаболизму с образованием неактивной N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты (N-Ац-5-АСК), как в слизистой оболочке кишечника, так и в печени. По-видимому, ацетилирование не зависит от фенотипа ацетилирования больного. Часть месалазина также ацетилируется бактериями толстого кишечника. Связь с белками плазмы составляет 43% для месалазина и 78% для N-Ац-5-АСК.

Выведение / экскреция

Месалазин и его метаболит N-Ац-5-АСК выделяются с экскрементами (большая часть), почками (количество варьирует от 20 до 50% в зависимости от пути введения, лекарственной формы и механизма высвобождения действующего вещества) и вместе с желчью (меньшая часть). Почками выделяется, в основном, в виде N-Ац-5-АСК. Приблизительно 1% дозы принятой перорально дозы месалазина выделяется с грудным молоком, в основном, в виде N-Ац-5-АСК.

Специфические особенности Салофалька®, суспензии ректальной 4 г/60 мл:

Распределение:

В исследованиях установлено, что при применении у пациентов с язвенным колитом легкой или средней степени тяжести суспензия в начале лечения и при ремиссии после 12 недель лече-

ния распределяется, в основном, по прямой кишке и сигмовидной кишке, в меньшей степени – по нисходящему отделу толстой кишки.

Всасывание и выведение:

Установлено, что при применении у пациентов с язвенным колитом в стадии ремиссии наивысшая концентрация в плазме крови составляла 0,92 мкг/мл 5-ACK и 1,62 мкг/мл N-Ац-5-ACK, она достигалась приблизительно через 11-12 часов в условиях равновесия. Скорость выведения составляла приблизительно 13% (45-часовое значение), большая часть (около 85 %) принятой дозы выводилась в виде метаболита N-Ац-5-ACK.

Концентрация в плазме крови 5-ACK и N-Ац-5-ACK у детей с хронической воспалительной болезнью кишечника, проходящих лечение препаратом Салофальк®, суспензия ректальная 4 г/60 мл, составляла 0,5-2,8 мкг/мл и 0,9-4,1 мкг/мл соответственно в условиях равновесия.

Данные доклинических исследований безопасности:

Доклинические данные из стандартных исследований фармакологической безопасности, генотоксичности, канцерогенности (у крыс) при репродуктивной токсичности не выявили какой-либо особой опасности для человека.

В исследованиях токсичности при многократном введении орально высоких доз месалазина наблюдалась нефротоксичность (медуллярный некроз почки и повреждение эпителия проксимального извитого почечного канальца или всего нефronа). Клиническое значение полученных данных неясно.

Показания к применению

Лечение острых приступов воспалительного заболевания толстого кишечника, известного в медицине, как язвенный колит.

Способ применения и дозирование

Взрослые и пожилые люди

При использовании для лечения пациентов с острым приступом воспаления содержимое одного флакона (= 60 мл суспензии) вводят в кишечник в виде клизмы один раз в день перед сном.

Дети

Не существует достаточных данных о применении суспензии ректальной Салофальк® 4г/60мл у детей.

Общая информация для всех пациентов

Препарат Салофальк®, суспензия ректальная 4г/60мл должен использоваться один раз в день перед сном.

Препарат Салофальк®, суспензия ректальная 4г/60мл должен использоваться регулярно и систематически, поскольку только в таком случае можно добиться положительного результата.

Продолжительность лечения определяет лечащий врач.

Путь введения:

Применяется ректально.

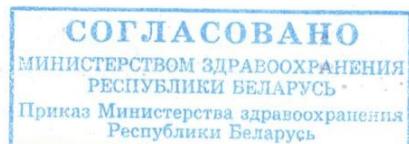
Наилучшие результаты будут достигнуты, если перед использованием суспензии ректальной Салофальк® 4г/60мл пациент опорожнит кишечник.

Подготовка к введению:

Флакон встряхивают в течение 30 секунд.

Удаляют защитный колпачок аппликатора.

Удерживают флакон сверху и снизу.



Правильная поза при введении ректальной суспензии:

Пациент должен лечь на левый бок, вытянув левую ногу, а правую согнув в колене. Такая поза облегчает введение клизмы и позволяет достичь большего эффекта.

Введение ректальной супсепзии:

Ведите кончик аппликатора глубоко в прямую кишку.

Слегка наклоните флакон и осторожно начинайте сжимать.

Когда флакон будет пуст, медленно извлеките кончик аппликатора из прямой кишки.

Пациент должен оставаться в горизонтальном положении в течение, как минимум, 30 минут после введения, чтобы обеспечить равномерное распределение препарата по прямой кишке.

По возможности, следует оставить клизму на всю ночь.

Побочное действие

В связи с применением месалазина были зарегистрированы следующие побочные эффекты:

Система органов/ орган/ категория	Частота в соответствии с медицинским словарем нормативно-правовой деятельности	
	Редко ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)	Очень редко ($< 1/10.000$)
Нарушения со стороны кровеносной и лимфатической систем		Изменения формулы крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)
Нарушения со стороны нервной системы	Головные боли, головокружения	Периферические нейропатии
Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы	Миокардит, перикардит	
Нарушения со стороны респираторного тракта		Аллергические и фиброзные легочные реакции (включая одышку, кашель, бронхоспазм, альвеолит, легочную эозинофилию, инфильтрацию легких, пневмонию)
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	Боли в области живота, диарея, вздутие, тошнота и рвота	Острый панкреатит
Нарушения со стороны почек		Дисфункция почек, включая острый и хронический интерстициальный нефрит и почечную недостаточность
Нарушения со стороны кожи и подкожно-жижевой клетчатки		Алопеция (выпадение волос)
Нарушения со стороны мышечной и суставной систем		Миалгия, артраптогия
Нарушения со стороны иммунной системы		Реакции гиперчувствительности, такие как аллергическая экзантема, медикаментозная лихорадка, синдром медикаментозной красной волчанки, панколит
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей		Изменения функциональных параметров печени (повышение уровня трансамина и параметров холестаза), гепатит, холестатический гепатит
Нарушения со стороны репродуктивной системы		Олигоспермия (обратимая)

СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Противопоказания

Препарат Салофальк®, суспензия ректальная 4г/60 мл противопоказан пациентам с:

- известной гиперчувствительностью к салициловой кислоте и ее производным или к какому-либо из вспомогательных веществ, входящих в состав лекарственного средства;
- тяжелой дисфункцией печени или почек.

Передозировка

Существуют очень ограниченные сведения о передозировке месалазина (например, при приеме внутрь высоких доз с суициальной целью). Специфического антитода не известно. Лечение является симптоматическим и поддерживающим.

Меры предосторожности

По усмотрению врача перед началом лечения и в течение лечения должны проводиться анализ крови (общий анализ крови с подсчетом форменных элементов), определение показателей функционального состояния печени (уровни ферментов АЛТ или АСТ, содержание креатинина в плазме крови) и анализ мочи (тестовые полоски / осадок). Рекомендуется проводить данные исследования через 14 дней после начала лечения и затем 2-3 раза с интервалом в 4 недели.

Если полученные результаты соответствуют норме, тогда достаточно проводить данные анализы каждые три месяца. Если появляются дополнительные проявления заболевания, следует немедленно провести дополнительные исследования.

Использовать с осторожностью при лечении пациентов со сниженной функцией печени.

Не следует использовать Салофальк®, суспензию ректальную 4г/60мл при лечении пациентов со сниженной функцией почек. Если во время лечения произойдет снижение функции почек, следует предположить наличие нефротоксичности, связанной с месалазином.

Необходимо внимательное наблюдение за пациентами с расстройствами дыхательной системы, в особенности с астмой, при назначении Салофалька®, суспензии ректальной 4г/60мл.

Лечение пациентов с известной гиперчувствительностью к препаратам, содержащим сульфасалазин, можно начинать только под тщательным медицинским наблюдением. При появлении симптомов острой непереносимости, таких, как спазмы, осткая боль в области живота, лихорадка, сильные головные боли и сыпь на коже, лечение должно быть прекращено немедленно.

В связи с содержанием метабисульфита калия в качестве вспомогательного вещества, могут возникать аллергические реакции с симптомами анафилаксии и бронхоконстрикции (бронхоспазма) у чувствительных пациентов, особенно у страдающих астмой или другой аллергией.

В связи с содержанием бензоата натрия в качестве вспомогательного вещества, могут возникать реакции гиперчувствительности у предрасположенных к ним пациентов в виде раздражения кожи, глаз и слизистых.

Период беременности и кормления грудью

На данный момент имеется недостаточное количество данных о назначении препарата суспензии ректальной Салофальк® 4г/60мл беременным. Тем не менее, не наблюдалось никаких негативных эффектов на беременность или здоровье плода и новорожденного. На данный момент какая-либо прочая информация отсутствует. Имеется один случай отказа функции почек у новорожденного, родившегося у женщины, долгое время получавшей высокие дозы месалазина в течение беременности (2-4 г в день перорально).

Исследования перорального пути введения месалазина, проводимые на животных, не продемонстрировали никаких прямых или косвенных побочных эффектов на гестацию, развитие эмбриона/плода, роды и постнатальное развитие.

Препарат суспензия Салофальк® 4г/60мл следует назначать во время беременности только в том случае, если ожидаемая польза превышает потенциальный риск.

С грудным молоком секретируется N-ацетил-5-аминосалициловая кислота и малые количества месалазина. Опыт использования месалазина во время кормления грудью очень ограничен. Нельзя исключить развитие реакций гиперчувствительности у младенцев, одним из проявлений которых может быть диарея. Таким образом, препарат Салофальк®, суспензия ректальная

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

4г/60мл следует назначать во время кормления грудью только в том случае, если ожидаемая польза превышает потенциальный риск. Если у ребенка начнется диарея, кормление грудью следует прекратить.

Влияние на способность вождения автомобиля и управления сложной техникой
Отсутствует влияние на способность водить автомобиль и управлять сложной техникой.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Специальных исследований взаимодействия не проводилось.

Следует учитывать вероятность усиления подавляющего действия азатиоприна, 6-меркаптопурина или тиогуанина на костный мозг при лечении при одновременном применении Салофалька®.

Существуют слабые доказательства того, что месалазин может уменьшить эффект антикоагулянта варфарина.

Условия хранения и срок годности

Не требует особых условий хранения.

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в запечатанной контурной упаковке.

Срок годности - 2 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

Упаковка

Суспензия ректальная, 4 г/60 мл: по 60 мл в белых, круглых, сжимающихся флаconах из плотного полиэтилена, закрытые смазанным наконечником ректального аппликатора и защитной крышкой.

Флаcon помещен в контурную упаковку из термосвариваемой поливинилхлоридной пленки и бумаги ламинированной с алюминиевым покрытием. По 7 флаconов, помещенных в контурную упаковку, с инструкцией по применению в пачку из картона.

Заявитель/производитель

Др. Фальк Фарма ГмбХ

Лайненвеберштр. 5

79108 Фрайбург

Германия.

СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ

РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ

Приказ Министерства здравоохранения

Республики Беларусь

Представитель в Республике Беларусь

Представительство АО "Alpen Pharma AG" в Республике Беларусь

220053, г. Минск, ул. Пархоменко 3, офис 1Б

Тел./факс: (+375 17) 3350642.