

Состав

действующее вещество: месалазин (5-аминосалициловая кислота)

1 суппозиторий содержит 250 мг месалазина;

вспомогательные вещества: твердый жир.

Лекарственная форма

Суппозитории ректальные.

Основные физико-химические свойства: суппозитории от белого до кремового цвета, торпедообразное, с однородной консистенцией и неповрежденной, гладкой поверхностью.

Фармакотерапевтическая группа

Желудочно-кишечный тракт и обмен веществ. Противодиарейные, кишечные противовоспалительные / противомикробные препараты. Кишечные противовоспалительные препараты. Аминосалициловая кислота и подобные средства. Месалазин.

Код АТХ А07ЕС02.

Фармакодинамика

Механизм действия

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Результаты исследований *in vitro* свидетельствуют, что определенную роль может играть ингибирования липооксигеназы.

Было также продемонстрировано влияние на концентрацию простагландинов в слизистой оболочке кишечника. Месалазин (5-аминосалициловая кислота / 5-АСК) может также действовать как поглотитель радикалов реактивных соединений кислорода.

Месалазин при ректальном введении действует преимущественно образом локально на слизистую оболочку и подслизистый слой кишечника.

Фармакокинетика

Общие свойства месалазина

Поглощение

Поглощение месалазина является самым высоким в проксимальной части кишечника и низким - в дистальной части.

Метаболизм

Месалазин метаболизируется как досистемно в слизистой оболочке кишечника, так и в печени в фармакологически неактивную N-ацетил-5-ПАСК (N-Ац-5-АСК). Очевидно, что ацетилирования не зависит от фенотипа ацетилирования у пациента. Некоторое ацетилирования также происходит благодаря действию бактерий в толстом кишечнике. Связывание месалазина и N-Ац-5-АСК с белками составляет соответственно 43% и 78%.

Вывод / экскреция

Месалазин и его метаболит N-Ац-5-АСК выводятся с фекалиями (основная часть), почками (варьирует между 20% и 50% в зависимости от типа применения, фармацевтической формы и пути высвобождения месалазина) и с желчью (незначительная часть). Почечная экскреция происходит преимущественно в виде N-Ац-5-АСК. Около 1% от общей введенной пероральной дозы месалазина выводится в грудное молоко, главным образом в виде N-Ац-5-АСК.

Особенности суппозиториев препарата Салофальк

Распределение

Сцинтиграфические исследования с мечеными технецием суппозиториями препарата Салофальк показали пик распространения суппозитория, растаял при температуре тела, через 2-3 часа. Распространение ограничено прежде всего прямой кишкой и ректосигмоподобным отделом. Итак, суппозитории препарата Салофальк особенно пригодны для лечения проктита (язвенного колита прямой кишки).

Поглощение

Как после однократного применения, так и после нескольких недель терапии 500 мг месалазина в виде суппозиториев препарата Салофальк три раза в сутки максимальная концентрация 5-АСК в плазме варьировал от 0,1 до 1,0 мкг / мл при диапазоне того же показателя для основного метаболита N-Ац-5-АСК от 0,3 до 1,6 мкг / мл. В некоторых случаях пик концентрации 5-АСК в плазме достигался в течение первого часа после применения.

Вывод

После однократного применения 500 мг месалазина в виде суппозитория препарата Салофальк примерно 11% (в течение 72 часов) и после нескольких недель или длительной терапии 500 мг месалазина с применением суппозитория препарата Салофальк трижды в сутки примерно 13% от введенной дозы 5-АСК выводились с мочой. Примерно 10% от введенной однократной дозы выводилось с желчью.

Показания

Лечение обострений и поддержания ремиссии язвенного колита, ограниченного прямой кишкой.

Противопоказания

Гиперчувствительность к месалазину, к любому из компонентов препарата или к салицилатам, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, тяжелая печеночная и / или почечная недостаточность, геморрагический диатез.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Специальных исследований взаимодействия с другими лекарственными средствами не проводилось.

В случае одновременного лечения Салофальк и азатиоприн, 6-меркаптопурином или тиогуанин следует принимать во внимание возможное повышение миелосупрессивного эффекта азатиоприна, 6-меркаптопурина или тиогуанина.

Есть данные о том, что месалазин может снизить антикоагулянтное действие варфарина.

Особенности применения

По усмотрению врача до и во время лечения нужно делать анализы крови (развернутый анализ крови показатели функции печени, такие как АЛТ или АСТ; креатинин сыворотки) и мочи (тестовые полоски, осадок). Ориентировочно анализы рекомендуется делать через 14 дней от начала лечения и затем еще 2-3 раза с интервалом 4 недели.

Если результаты исследований нормальные, рутинные проверки могут проводиться каждые 3 месяца, но при появлении других дополнительных симптомов анализы необходимо сделать срочно.

С осторожностью следует применять больным с нарушением функции печени.

Не следует применять суппозитории препарата Салофальк при нарушении функции почек. При применении месалазина сообщалось о случаях нефролитиаза, в том числе образование камней со 100% содержанием месалазина. Во время лечения рекомендуется обеспечивать достаточное потребление жидкости.

Если возникает нарушение функции почек в течение лечения, нужно принимать во внимание токсичность месалазина по функции почек.

Пациентам с легочными заболеваниями, в частности с астмой, следует находиться под наблюдением врача в течение курса лечения суппозиториями препарата Салофальк.

Пациентам, имеющим реакции гиперчувствительности на препараты, содержащие сульфасалазин, следует находиться под наблюдением врача с самого начала лечебного курса с применением суппозиторий препарата Салофальк. При появлении острых симптомов непереносимости, таких как судороги, острая боль в животе, лихорадка, сильная головная боль и сыпь, терапию следует немедленно прекратить.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Применение препарата Салофальк, суппозиторий по 250 мг или 500 мг, не влияет или имеет незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами или работать с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Адекватных данных о применении суппозиторий препарата Салофальк беременным женщинам нет. Однако данные о применении ограниченном количестве беременных указывают на отсутствие нежелательных воздействий месалазина на течение беременности или на здоровье плода и (или) новорожденного. На сегодняшний день нет никаких других эпидемиологических данных по этому препарату. Только в одном случае после длительного применения месалазина в высокой дозе (2-4 г перорально) в течение беременности сообщалось о почечной недостаточности у новорожденного.

Исследования на животных при пероральном приеме месалазина НЕ показало прямого или опосредованного неблагоприятного влияния на беременность, развитие эмбриона / плода, роды или постнатальное развитие.

Суппозитории препарата Салофальк необходимо применять во время беременности только тогда, когда ожидаемая польза от применения преобладать возможный риск.

Лактация

N-ацетил-5-аминосалициловая кислота и в меньшей степени месалазин экскретируются в грудное молоко. На сегодня есть только ограниченный опыт применения женщинам в период кормления грудью. Нельзя исключить реакций гиперчувствительности у грудного ребенка, таких как диарея. Итак, суппозитории препарата Салофальк должны применяться в период кормления грудью только тогда, когда ожидаемая польза для матери будет преобладать возможный риск для ребенка. Если у грудного ребенка разовьется диарея, кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

В случае применения суппозиториев препарата Салофальк трижды в сутки их вводят в прямую кишку утром, днем и вечером перед сном.

Желаемого лечебного результата можно достичь только при регулярном и постоянном применении суппозиториев препарата Салофальк.

Длительность применения определяет врач.

Взрослые и пациенты пожилого возраста

Лечение обострений язвенного колита

В зависимости от индивидуальной клинической потребности, 2 суппозитория препарата Салофальк 250 мг или 1 суппозиторий препарата Салофальк 500 мг вводят в прямую кишку 3 раза в сутки (эквивалентно 1500 мг месалазина в сутки).

Поддержание ремиссии язвенного колита

1 суппозиторий препарата Салофальк 250 мг вводят в прямую кишку 3 раза в сутки (эквивалентно 750 мг месалазина в сутки).

Дети

Нет достаточных данных о применении этого лекарственного средства детям.

Передозировка

Есть данные о редких случаях передозировки (например, умышленное самоубийство путем приема высокой пероральной дозы месалазина), которые не указывают на почечную или печеночную токсичность. Специфического антидота не существует, лечение должно быть симптоматическим и поддерживающим.

Побочные реакции

После введения месалазина наблюдались такие побочные реакции:

Система органов	Частота согласно MedDRA		
	редкие ($\geq 1/10\ 000$; $< 1/1\ 000$) очень редкие	(<1/10 000) частота неизвестна	(Невозможно оценить на основе доступных данных)
Система крови и лимфатическая система		Изменения в составе крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)	
Нервная система	Головная боль, головокружение	Периферическая нейропатия	
Сердечно-сосудистая система	Миокардит, перикардит		

Органы дыхания, грудной клетки и средостения		Аллергические и фиброзные реакции легких (включая одышка, кашель, бронхоспазм, альвеолит, легочную эозинофилию, инфильтрацию легких, пневмонит)	
Желудочно-кишечный тракт	Боль в животе, диарея, метеоризм, тошнота и рвота	острый панкреатит	
Почки и органы мочеиспускания		Нарушение функции почек, включая острый и хронический интестинальный нефрит и почечную недостаточность	нефролитиаз *
Кожа и ее производные	Повышенная чувствительность кожи к солнечным и ультрафиолетовым лучам (фотосенсибилизация)	алопеция	
Скелетно-мышечная система и соединительные ткани		Миалгия, артралгия, судороги	
Иммунная система		Реакции гиперчувствительности, включая аллергические высыпания, лекарственная лихорадка, синдром красной волчанки, панколит	

Печень и желчный пузырь		Изменения функции печени (повышение уровня трансаминаз и параметров застоя желчи), гепатит, холестатический гепатит, печеночная недостаточность	
Репродуктивная система		Олигоспермия (оборотная)	

* Более подробная информация приведена в разделе «Особенности применения».

Фоточувствительность

Были сообщения о тяжелых реакциях у пациентов с заболеваниями кожи, например с атопическим дерматитом и атопической экземой.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после получения разрешения на реализацию лекарственного средства является очень важным. Это позволяет постоянно контролировать баланс польза / риск применения лекарственного средства. Медицинские работники просят сообщать о любых подозрениях на побочные реакции из-за Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte

(Федеральный институт лекарственных средств и медицинских изделий)

Отдел Фармаконадзора

Курт Георг-Кизингера-Алле 3

53175 Бонн

www.bfarm.de

Срок годности

3 года.

Нельзя применять после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте. Хранить при температуре не выше 30 °С. Хранить в оригинальной упаковке для защиты от света.

Упаковка

По 5 суппозитория в стрипе, по 2 стрипа в коробке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Др. Фальк Фарма ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Ляйненвеберштрассе 5, 79108 Фрайбург, Германия

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).