Состав

действующее вещество: месалазин;

1 клизма (60 г суспензии) содержит 4,0 г месалазина (5-аминосалициловой кислоты)\$

вспомогательные вещества: натрия бензоат (Е 211), калия метабисульфит (Е 224), трилон Б, карбомер 934 Р, калия ацетат, ксантановая камедь, вода очищенная.

Лекарственная форма

Суспензия ректальная.

Основные физико-химические свойства: гомогенная суспензия, имеет цвет от очень светлого коричневого до коричневого, лишена посторонних частиц.

Фармакотерапевтическая группа

Противовоспалительные средства, применяемые для лечения заболеваний кишечника. Код АТХ А07Е С02.

Фармакодинамика

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Результаты исследований *in vitro* свидетельствуют, что определенную роль может иметь 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 кишечника и на подслизистую ткань из просвета кишечника.

Доклинические данные, основанные на традиционных исследованиях безопасности, фармакологии, генотоксичности, канцерогенности (на крысах) или токсичности по репродуктивной системы, не указывают об особой опасности для человека.

Была отмечена нефротоксичность (почечный папиллярный некроз и повреждение эпителия в проксимальных канальцах (Pars convoluta) или целого нефрона) в исследованиях токсичности при применении повторных высоких пероральных доз месалазина. Клиническая значимость этих данных неизвестна.

Фармакокинетика

Общие свойства месалазина

Абсорбция

Абсорбция месалазина является самой высокой в проксимальной части кишечника и низкой - 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 ацетилирование не зависит от фенотипа ацетилирования больного. Некоторое ацетилирование также происходит благодаря действию бактерий в толстом кишечнике. Связывание месалазина и N-Ац-5-АСК с белками составляет соответственно 43% и 78%.

Выведение / 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 клизмы Салофалька, 4 г / 60 мл

Распределение

Сцинтиграфические исследования с участием пациентов с незначительным или умеренным острым язвенным колитом показали, что жидкость клизмы в начале лечения и через 12 недель применения распределяется главным образом в прямой и сигмовидной кишке и в меньшей степени - в ободочной кишке.

Абсорбция и выведение

В исследовании с участием пациентов с язвенным колитом в стадии ремиссии пик концентрации в плазме составлял для 5-АСК 0,92 мкг / мл и для N-Ац-5-АСК

1,62 мкг / мл через примерно 11-12 часов при постоянных условиях . Скорость элиминации составляла примерно 13% (через 45 часов), причем большее количество (около 85%) выводилась в форме метаболита - N-АЦ-5-АСК.

Концентрация в плазме 5-АСК и N-АЦ-5-АСК у детей с хроническим воспалением толстого кишечника при лечении Салофалька, 4 г / 60 мл, составляла 0,5-2,8 мкг / мл и 0,9-4,1 мкг / мл соответственно.

Показания

Лечение обострений язвенного колита (хронического воспалительного заболевания толстого кишечника).

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 лекарственного взаимодействия не проводилось.

Во время комплексного лечения Салофальк и азатиоприн, 6-меркаптопурином или тиогуанин в некоторых исследованиях было обнаружено большую частоту миелосупрессивных эффектов, якобы свидетельствует о наличии взаимодействия, однако механизм взаимодействия установлен полностью. Рекомендуется регулярно контролировать уровень лейкоцитов, а режим дозирования тиопуринов следует откорректировать.

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

Возможно усиление гипогликемического действия производных сульфонилмочевины, токсического действия метотрексата. Активность фуросемида, спиронолактона, сульфаниламидов, рифампицина, урикозурических препаратов (пробенецида и сульфинпиразона) может ослабевать. Месалазин может усиливать нежелательное действие глюкокортикоидов на слизистую оболочку желудка, уменьшать всасывание дигоксина.

Особенности применения

По усмотрению врача нужно во время и после лечения 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 можно проводить каждые 3 месяца, но при появлении других дополнительных симптомов анализы необходимо сделать срочно.

С осторожностью следует применять больным с нарушениями функции печени.

Нужно с осторожностью применять клизмы Салофалька при нарушении функции почек легкой и средней степени тяжести. Необходимо регулярно контролировать функцию почек, а именно измерять уровень азота мочевины крови, креатинина у пациентов с протеинурией. При ухудшении функции почек в течение лечения следует иметь в виду индуцированную месалазином токсичность относительно почек.

При применении месалазина сообщалось о случаях нефролитиаза, в том числе образование камней со 100% содержанием месалазина. Рекомендуется обеспечить достаточный прием жидкости во время лечения.

Больным с легочными заболеваниями, в частности с астмой, следует находиться под наблюдением врача в течение курса лечения клизмами Салофалька.

Больным, имеющим в анамнезе побочные реакции на препараты, содержащие сульфасалазин, следует находиться под тщательным контролем с самого начала курса лечения клизмами Салофалька. Если суспензия Салофальк вызывает острые реакции непереносимости, такие как спазмы в животе, острая боль в животе, лихорадка, сильная головная боль и сыпь, терапию следует немедленно прекратить.

Благодаря тому, что клизмы Салофалька, 4 г / 60 мл, содержащих метабисульфит калия, они могут спровоцировать аллергические реакции с анафилактическими симптомами и сокращением бронхов (бронхоспазм) в чувствительных пациентов, особенно у больных бронхиальной астмой или у больных с аллергией в анамнезе.

Поскольку препарат содержит натрия бензоат, он может спровоцировать развитие реакции повышенной чувствительности у пациентов в виде раздражения кожи, глаз или слизистых оболочек.

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

Никакого влияния на способность управлять автомобилем и пользоваться механизмами не наблюдалось. Если во время лечения наблюдается головокружение, следует воздержаться от управления транспортными средствами и работы с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Адекватных данных о применении клизм Салофалька беременным женщинам нет. Однако данные о применении ограниченном количестве беременных указывают на отсутствие нежелательного влияния месалазина на течение беременности или на здоровье плода и (или) новорожденного. На сегодня любые другие эпидемиологические данные о препарате недоступны. Только в одном случае после длительного применения месалазина в высокой дозе (2-4 г перорально) в течение беременности сообщалось о почечной недостаточности у новорожденного. Были сообщения о нарушениях со стороны системы крови (лейкопения, тромбоцитопения, анемия) у новорожденных, матери которых применяли месалазин.

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

Клизмы Салофалька в течение беременности необходимо применять только тогда, когда ожидаемая польза от применения преобладать возможный риск.

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 клизмы Салофалька можно применять во время грудного вскармливания только тогда, когда ожидаемая польза от применения преобладать возможный риск. Если у грудного ребенка разовьется диарея, кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

Взрослые и пациенты пожилого возраста

Пациентам с симптомами острого воспаления рекомендуется применять содержимое одной клизмы (60 г суспензии) ректально 1 раз в сутки вечером, перед сном.

Лучший результат достигается, если перед применением клизмы Салофалька проводится очистка кишечника.

Желаемого лечебного результата можно достичь только при регулярном и постоянном применении клизм Салофалька.

Длительность применения определяет врач.

Инструкция по введению суспензии

Подготовка:

- Взболтать клизму в течение 30 секунд.
- Снять защитный колпачок с аппликатора.
- Держать клизму за боковые поверхности.

Правильное положение при введении клизмы:

Пациент имеет лечь на левый бок и вытянуть левую ногу, согнув правую. Это облегчает введение клизмы и повышает ее эффективность.

Введение клизмы:

- Ввести кончик аппликатора подальше в прямую кишку.
- Приподнять клизму вверх дном и медленно сжать.
- Как только клизма опустеет, медленно вывести кончик аппликатора из прямой кишки.
- Пациенту следует продолжать лежать не менее 30 минут, чтобы содержание клизмы распространилось по прямой кишке.
- Если это возможно, пусть жидкость клизмы вызывает свой эффект в течение всей ночи.

Дети

Нет достаточного опыта применения этого лекарственного средства детям.

Передозировка

На сегодня о случаях интоксикации и специфических антидотах не сообщалось. Есть данные о 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.

В случае необходимости применяют инфузию электролитов (принудительный диурез).

Побочные реакции

	Частота согласно MedDRA		
	редкие ($\geq 1/10000$; $< 1/1000$)	очень редкие ($< 1/10000$)	неизвестно (Невозможно определить на основе доступных данных)
Система органов			
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, плеврит)	

Желудочно-кишечный тракт	Боль в брюшной полости, диарея, метеоризм, тошнота и рвота	Острый панкреатит	
Почки и желчный пузырь		Нарушение функции почек, включая острый и хронический интестинальный нефрит, нефротический синдром 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 аллергическое высыпание, медикаментозную лихорадку, синдром красной волчанки, панколит, отек Квинке	
Гепатобилиарные нарушения			

Печень и желчный пузырь		Изменения в параметрах функции печени (повышение активности трансаминаз и параметры застоя желчи), гепатит, холестатический гепатит, печеночная недостаточность	
Репродуктивная система		Олигоспермия (оборотная)	
Состояние места введения		Анальный дискомфорт, боль в прямой кишке, тенезмы, раздражение	

*Смотрите раздел «Особенности применения».

Фоточувствительность

Сообщалось о более тяжелых реакциях у пациентов с ранее существующими кожными заболеваниями, такими как атопический дерматит и атопическая экзема.

Также возможны усталость, парестезии, метгемоглобинемия, длительная диарея, усиление симптомов колита.

Механизм развития миокардита, перикардита, панкреатита, нефрита и гепатита в связи с применением месалазина неизвестен; он может иметь аллергическую этиологию.

Следует отметить, что некоторые из этих расстройств можно объяснить самым воспалением кишечника.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях 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 через Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte (Федеральный институт лекарственных средств и медицинских изделий) Отдел Фармаконадзора Курт Георг-Кизингера-Алле 3 53175 Бонн.

Срок годности

2 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Не требует специальных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 60 г суспензии в клизме; по 7 клизм в блистерах в коробке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Др. Фальк Фарма ГмбХ/Dr. Falk Pharma GmbH.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Ляйненвеберштрассе 5, 79108 Фрайбург, Германия /Leinenweberstrasse 5, 79108 Freiburg, Germany.

Источник инструкции

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