

## **Состав**

*действующее вещество:* mesalazine;

1 таблетка содержит месаламин (месалазина) 400 мг

*вспомогательные вещества:* кальция гидрофосфат, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, гипромеллоза, повидон, тальк, кремния диоксид коллоидный, натрия крахмала (тип А), метакрилатный сополимер (тип С), метакрилатный сополимер (тип В), дибутилфталат, титана диоксид (Е 171), железа оксид красный (Е172), полиэтиленгликоль 6000.

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые оболочкой,.

*Основные физико-химические свойства:* круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой (кишечно покрытия), красно-коричневого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Противовоспалительные средства, применяемые при заболеваниях кишечника.  
Код АТХ А07Е С02.

## **Фармакодинамика**

Механизм противовоспалительного действия месалазина (5-аминосалициловой кислоты) неизвестен. Результаты исследований свидетельствуют, что месалазин подавляет миграцию полиморфноядерных лейкоцитов и ингибирует активность липооксигеназы, вследствие чего угнетается синтез противовоспалительных лейкотриенов в макрофагах стенки кишечника. Существуют также данные о влиянии месалазина на концентрацию простагландинов в слизистой оболочке кишечника. Месалазин может связывать свободные радикалы.

При пероральном применении месалазин действует преимущественно локально на слизистую оболочку кишечника и на подслизистую ткань со стороны полости кишечника. Следовательно, важно, что месалазин доступен в зонах воспаления. Системная биодоступность и концентрация в плазме крови не являются существенными для терапевтического эффекта, а скорее всего является фактором безвредности.

## **Фармакокинетика**

Таблетки Месакол, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, резистентные к желудочному соку. Полимерная оболочка таблеток обеспечивает высвобождение действующего вещества в зависимости от pH среды в нижнем отделе подвздошной кишки и толстом кишечнике, которые являются основными ячейками воспаления. Состав таблеток подобран таким образом, чтобы свести к минимуму всасывание месалазина в пищеварительном тракте. Поглощение месалазина является самым высоким в проксимальной части кишечника и низким - в дистальной части. Абсорбция после перорального приема составляет около 24%. Соответственно, 76% введенной дозы остается в нижнем отделе подвздошной кишки и толстом кишечнике, а также в прямой кишке, проявляя местное противовоспалительное действие.

Месалазин метаболизируется в печени и слизистой оболочке кишечника с образованием неактивного метаболита N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты. Связывание месалазина и его метаболита с белками плазмы крови составляет соответственно 43% и 78%. Экскреция происходит в основном с фекалиями и мочой в неизменном виде и в виде метаболита.

### **Показания**

Неспецифический язвенный колит легкой и средней степени тяжести, поддерживающее лечение в стадии ремиссии. Болезнь Крона.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к действующему веществу, к любому другому компоненту препарата или к салицилатам; тяжелые нарушения функции печени и почек (клиренс креатинина <30 мл / мин); язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; геморрагический диатез.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Специальных исследований лекарственного взаимодействия не проводили.

При одновременном применении сульфасалазина и дигоксина всасывание дигоксина снижается. Данные по взаимодействию дигоксина и месалазина отсутствуют.

Во время комплексного лечения месалазином и азатиоприном, 6-меркаптопурином или тиогуанином в некоторых исследованиях было обнаружено большую частоту миелосупрессивных эффектов, якобы свидетельствует о наличии взаимодействия, однако механизм взаимодействия установлен не полностью.

Рекомендуется проводить регулярный контроль (1 раз в неделю) показателей крови, в частности количество лейкоцитов, тромбоцитов и лимфоцитов, особенно в начале комбинированной Терапия. Если количество лейкоцитов остается стабильной в течение первого месяца лечения, достаточно проводить исследования каждые 4 недели в течение следующих 12 недель, после чего увеличить интервал до 3 месяцев.

Режим дозирования тиопуринов следует откорректировать.

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

При одновременном применении с лекарственными средствами, оказывающими нефротоксическое действие, такими как НПВС, азатиоприн или метотрексат, возможно повышение риска нежелательных реакций со стороны почек. Однако побочные эффекты, которые могут указывать на такое взаимодействие, не зарегистрированы.

Возможно усиление гипогликемического действия производных сульфонилмочевины, токсического действия метотрексата. Активность фуросемида, спиронолактона, сульфаниламидов, рифампицина, урикозурических препаратов (пробенецида и сульфинпиразона) может ослабевать.

## **Особенности применения**

### *Нарушение функции почек*

Препарат не назначают пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек.

Перед началом и во время лечения врач назначает анализы для проверки состояния мочи (с помощью тест-полоски). Препарат следует назначать с осторожностью пациентам с повышенной концентрацией креатинина сыворотки крови или протеинурией. Если во время лечения отмечено нарушение функции почек, это может быть проявлением нефротоксического действия месалазина.

Рекомендуется проводить контроль функции почек для всех пациентов перед началом лечения Месаколом, а также при лечении по схеме: через 14 дней от начала терапии, затем еще 2-3 раза с 4-недельными интервалами. При отсутствии признаков нарушения функции почек анализы повторять каждые полгода, а после 5 лет терапии - 1 раз в год. Если появляются другие лабораторные или клинические признаки нарушения функции почек, анализы необходимо сделать срочно. В случае наличия признаков нарушения функции почек пациенту следует немедленно прекратить Месаколом и срочно обратиться к врачу.

## *Дискразия крови*

Очень редко сообщалось о случаях дискразии крови. При подозрении или наличии дискразии крови (признаки кровотечения неясного происхождения, гематома, пурпура, анемия, повышение температуры тела, длительно сохраняется, а также жалобы на боль в горле), пациенту следует немедленно прекратить Месакол и срочно обратиться к врачу. Перед началом и во время лечения следует проводить исследование крови - рекомендуется проводить контроль через 14 дней от начала лечения, затем еще 2-3 раза с 4-недельными интервалами. Если результаты исследований в норме, рутинные проверки достаточно проводить каждые 3 месяца. Если же развиваются другие дополнительные симптомы, анализы необходимо сделать срочно.

Особенно важно следить за картиной крови с появлением у пациента во время лечения таких симптомов: кровотечения неясного происхождения, гематомы, пурпура, анемии, повышения температуры тела, длительное время сохраняется, а также при жалобах на боль в горле. В таких случаях лечение необходимо немедленно прекратить и предоставить пациенту необходимую медицинскую помощь.

## *Повышенная чувствительность к сульфасалазину*

При наличии у пациента гиперчувствительности к сульфасалазину лечение следует проводить только под постоянным медицинским контролем и немедленно прекратить при развитии признаков острой непереносимости препарата, таких как судороги, боль в животе, повышенная температура тела, сильная головная боль, сыпь на коже.

## *Нарушение функции печени*

Сообщалось о повышении уровня печеночных ферментов у пациентов, принимавших препараты, содержащие месалазин. Месакол следует применять с осторожностью пациентам с поражениями печени.

К началу и в течение курса лечения необходимо проводить исследование крови (показатели функционального состояния печени, такие как АЛТ или АСТ), дату которых определяет врач. Такие исследования рекомендуется проводить в течение 14 дней от начала лечения, а затем еще 2-3 раза с 4-недельными интервалами. При нормальных результатах анализы повторять каждые три месяца. При наличии дополнительных симптомов необходимо немедленно провести дополнительные исследования.

## *Реакции повышенной чувствительности со стороны сердца*

При применении Месакола сообщали о единичных случаях реакций гиперчувствительности со стороны сердца (мио- или перикардиты), вызванные приемом месалазина. Месакол не следует назначать повторно пациентам с повышенной чувствительностью со стороны сердца, вызванной месалазином в анамнезе. Препарат применять с осторожностью пациентам с аллергическими мио или перикардитами в анамнезе, независимо от того, какой препарат вызвал такую реакцию.

#### *Язва желудка или двенадцатиперстной кишки*

В случае наличия у пациента язвы желудка или двенадцатиперстной кишки применения Месакола противопоказано.

#### *Наличие таблеток в испражнениях*

Есть отдельные сообщения о наличии целых таблеток в испражнениях. В подавляющем большинстве случаев это остатки оболочки таблетки. При частом обнаружении целых таблеток в испражнениях пациенту следует проконсультироваться с врачом.

#### *Заболевания легких*

Больным с легочными заболеваниями, в частности с астмой, необходимо находиться под наблюдением врача во время лечения месалазином.

#### *Пациенты пожилого возраста*

Пациентам пожилого возраста препарат назначают с осторожностью только при сохранении нормальной функции почек.

#### *Непереносимость углеводов*

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует назначать пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

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

Влияние на способность управлять автомобилем и работать с механизмами не наблюдалось, но следует учитывать возможность возникновения такой побочной реакции головокружение.

#### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Данных по применению Месакола беременным женщинам недостаточно. Ограниченные данные указывают на отсутствие нежелательных воздействий месалазина на течение беременности или на здоровье плода и / или новорожденного. Однако отдельные данные свидетельствуют о повышении риска преждевременных родов и снижении массы тела новорожденного. В одном случае сообщалось о почечной недостаточности у новорожденного после длительного применения матерью в течение беременности месалазина в высокой дозе (2-4 г в сутки).

Таким образом препарат можно назначать в период беременности только тогда, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

N-ацетил-5-аминосалициловая кислота и в меньшей степени месалазин экскретируются в грудное молоко. В настоящее время является лишь ограниченный опыт применения препарата в период кормления грудью. Нельзя исключить реакций гиперчувствительности, таких как диарея. Итак, таблетки Месакол можно применять в период кормления грудью только тогда, когда потенциальная польза от применения преобладает возможный риск. Если у грудного ребенка разовьется диарея, кормление грудью следует прекратить.

## **Способ применения и дозы**

### Взрослые

#### *Язвенный колит*

При лечении заболевания в фазе обострения доза подбирается индивидуально и составляет до 4 г месалазина в сутки, разделенная на несколько приемов.

При поддерживающем лечении в стадии ремиссии рекомендуемая доза составляет до 2 г месалазина 1 раз в сутки, подбирается индивидуально. Возможен также распределение дозы на несколько приемов.

#### *Болезнь Крона*

При лечении заболевания в фазе обострения и поддерживающей терапии доза подбирается индивидуально и составляет до 4 г месалазина в сутки, разделенная на несколько приемов.

Пациенты пожилого возраста не требуются коррекции дозы, если не нарушена функция почек.

#### *Дети в возрасте от 6 лет*

- При лечении язвенного колита и болезни Крона в стадии обострения дозу подбирать индивидуально, начиная с 30-50 мг / кг / сутки, разделенную на несколько приемов. Максимальная доза составляет 75 мг / кг / сутки, разделенная на несколько приемов. Общая суточная доза не должна превышать 4 г месалазина.
- При поддерживающей терапии дозу подбирать индивидуально, начиная с 15-30 мг / кг / сутки, разделенную на несколько приемов. Общая суточная доза не должна превышать 2 г месалазина.

Как правило, детям с массой тела до 40 кг следует назначать половину дозы для взрослых, а детям с массой тела более 40 кг назначать полную дозу для взрослых.

Таблетки следует принимать целиком, не разжевывая, с достаточным количеством жидкости, за 1 час до еды. Как при обострении заболевания, так и при поддерживающем лечении в стадии ремиссии для достижения желаемого терапевтического эффекта таблетки Месакол следует принимать регулярно и постоянно. Длительность применения определяет врач. Обычно ремиссия при язвенном колите и болезни Крона наступает через 8-12 недель приема Месакола.

## **Дети**

Таблетки Месакол не применять детям до 6 лет, потому что опыт применения препарата в этой возрастной группе недостаточен.

## **Передозировка**

До сих пор о случаях интоксикации и специфические антидоты не сообщалось.

В случае необходимости провести инфузию электролитов (принудительный диурез).

## **Побочные реакции**

Побочные эффекты классифицированы по частоте проявлений: очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $<1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$ ,  $<1/1000$ ), очень редко ( $<1/10000$ ), единичные случаи.

*Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы*

Нечасто: эозинофилия.

Очень редко: изменены показатели крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения),

угнетение функции костного мозга, заболевания крови.

#### *Со стороны иммунной системы*

Очень редко: реакции гиперчувствительности, такие как аллергическая сыпь, лекарственная лихорадка, кожная сыпь, панколит, отек Квинке, волчаночноподобный синдром.

#### *Со стороны нервной системы*

Нечасто: парестезии.

Редко: головная боль, головокружение.

Очень редко: периферическая нейропатия, доброкачественная внутричерепная гипертензия (у детей в пубертатном периоде).

#### *Со стороны сердечно-сосудистой системы*

Редко: миокардит, перикардит.

#### *Со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения*

Очень редко: аллергические и фиброзирующиеся реакции легких (в том числе одышка, кашель, бронхоспазм, альвеолит, легочная эозинофилия, инфильтрация легочной ткани, пневмонит), пневмония, интерстициальное заболевание легких, эозинофильный пневмония, заболевания органов дыхания.

#### *Со стороны желудочно-кишечного тракта*

Редко: боль в животе, диарея, метеоризм, тошнота, рвота, диспепсия.

Нечасто: обострение болезни Крона или язвенного колита.

Очень редко: острый панкреатит.

#### *Со стороны пищеварительной системы*

Очень редко: изменения в параметрах функции печени (повышение уровня трансаминаз и ферментов холеостаза), гепатит, холестатический гепатит, печеночная недостаточность.

#### *Со стороны кожи и подкожных тканей*

Часто: высыпания на коже.

Нечасто: крапивница, зуд.

Очень редко: алопеция.

*Со стороны костно-мышечной системы, соединительной ткани и поражения костей*

Очень редко: миалгия, артралгия.

Неизвестная частота: волчаночноподобный синдром с перикардитом и плевроперикардитом в качестве основных симптомов, а также высыпания на коже и артралгия.

*Со стороны почек и мочевыводящих путей*

Очень редко: нарушение функции почек, в том числе острый и хронический интерстициальный нефрит и почечная недостаточность, нефротический синдром, почечная недостаточность, иногда нормализуется после отмены препарата.

*Со стороны репродуктивной системы и молочных желез*

Очень редко: олигоспермия (оборотная).

*Лабораторные показатели*

Частота неизвестна: повышение уровня креатинина в плазме крови, снижение массы тела, снижение клиренса креатинина, повышение концентрации амилазы, повышение скорости оседания эритроцитов, повышение концентрации липазы, повышение азота мочевины крови.

## **Срок годности**

4 года.

## **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

## **Упаковка**

По 10 таблеток в стрипе. По 5 стрипов в картонной упаковке.

## **Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Сурва № 214, участок № 20 Гавт.Индл.Ерия, Фаза ИИ, Пипариа, Сильвасса - 396230, У.Т. Дадра и Нагар Хавели, Индия.

**Источник инструкции**

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