

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

Сульфасалазин-ЕН
(Sulfasalazin-EN)

Склад.

Діюча речовина: 1 кишковорозчинна таблетка містить 500 мг сульфасалазину;

допоміжні речовини: повідон, крохмаль прежелатинізований, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, титану діоксид (E171), заліза оксид (E172), тальк, триетилцитрат, макрогол 6000, натрію карбоксиметилцелюлоза, метакрилатний сополімер (тип А).

Лікарська форма. Таблетки кишковорозчинні.

Фармакотерапевтична група. Протизапальні засоби, які застосовуються при захворюваннях кишечника. Сульфасалазин.

Код АТС А07Е С01.

Клінічні характеристики.**Показання.**

- Запальні захворювання кишечника (наприклад, хвороба Крона, неспецифічний виразковий коліт);
- ревматоїдний артрит у дорослих, ювенільний ревматоїдний поліартрит (у складі допоміжної терапії).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до сульфасалазину або інших інгредієнтів препарату, сульфонамідів та саліцилатів.

Порфірія.

Гранулоцитопенія.

Дитячий вік до 6 років.

Спосіб застосування та дози.

Дозу слід підбирати індивідуально, враховуючи тяжкість захворювання та можливість розвитку небажаних ефектів.

Пацієнти повинні приймати таблетки під час прийому їжі. Таблетки потрібно ковтати цілими, запиваючи склянкою рідини.

Якщо вчасно не прийнято чергову дозу препарату, потрібно прийняти її якнайшвидше. Якщо вже наближається час прийому наступної дози, потрібно продовжити рекомендований графік лікування (без подвоєння дози).

Запальні захворювання кишечника.

Лікування гострого стану:

Початкова доза для дорослих становить 2 – 4 таблетки (1 – 2 г) на добу. Добову дозу слід поділити щонайменше на три прийоми. Дозу поступово збільшують до 3 – 8 г.

Пацієнтам, які раніше не приймали Сульфасалазин-ЕН, рекомендується підвищувати дозу поступово протягом 9 днів.

Дітям старше 6 років рекомендовано застосовувати 40-150 мг/кг маси тіла на добу. Добову дозу слід поділити щонайменше на три прийоми.

Підтримка ремісії:

Рекомендована підтримуюча доза для дорослих становить 4 – 6 таблеток (2 – 3 г) на добу. Добову дозу слід поділити щонайменше на три прийоми.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Дітям старше 6 років рекомендовано застосовувати 20-75 мг/кг маси тіла на добу. Добову дозу слід поділити щонайменше на три прийоми.

Ревматоїдні артрити та ювенільні поліартрити

Рекомендована доза для дорослих становить 2 г на добу. Пацієнти повинні починати лікування з 1 таблетки (500 мг) сульфасалазину на добу. Підвищувати дозу сульфасалазину треба поступово, з тижневими інтервалами, до досягнення дози 2 г на добу (добову дозу слід розділити на 2-4 прийоми). У деяких пацієнтів виразний клінічний ефект може бути досягнутий після 12 тижнів лікування. Якщо клінічний ефект після 12 тижнів застосування недостатній, добова доза може бути збільшена до 3 г.

У разі застосування доз більше 2 г на добу слід ретельно контролювати стан хворого.

Дітям старше 6 років дозу препарату визначає лікар, із розрахунку 30-75 мг сульфасалазину на 1 кг маси тіла на добу в 2-3 прийоми. Діти будуть краще переносити препарат, якщо початкова доза у три або чотири рази менша за рекомендовану і поступово збільшується протягом місяця до досягнення підтримуючої дози. Діти можуть приймати не більше 4 таблеток (2 г) на добу.

Побічні реакції.

Більшість побічних ефектів сульфасалазину є слабкими і пов'язані головним чином із ступенем концентрації сульфапіридину в крові, особливо в осіб з його сповільненим виведенням (повільне ацетилювання). Побічні ефекти зустрічаються переважно у хворих на ревматоїдний артрит.

Загальні.

Може зустрічатися підвищення температури тіла, жовто-помаранчевий колір сечі, шкіри або м'яких контактних лінз.

З боку серцево-судинної системи.

Перикардит.

З боку шлунково-кишкового тракту.

Нудота, блювання, пронос і втрата апетиту можуть траплятися відносно часто; рідко – гепатит, панкреатит, стоматит і паротит.

Гематологічні порушення.

Макроцитоз (9%), лейкопенія (3.7%) і нейтропенія (2%) часто спостерігалися протягом терапії сульфасалазином. Інші розлади спостерігаються рідко: мегалобластична анемія, гемолітична анемія, метгемоглобінемія, анемія, агранулоцитоз, тромбоцитопенія, апластична анемія і гіпопротромбінемія.

З боку нервової системи.

Найчастіші – головний біль (30%), інші небажані ефекти спостерігаються рідко (периферична нейропатія, запаморочення, шум у вухах, атаксія, безсоння, галюцинації, конвульсії і асептичний менінгіт), енцефалопатія.

З боку психіки: депресія.

З боку органів чуття.

Порушення смакових відчуттів, нюху, дзвін у вухах.

З боку сечостатевої системи.

Можуть спостерігатися протеїнурія, гематурія, кристалурія, нефротичний синдром, олігоспермія і чоловіче безпліддя, які мають оборотний характер. У хворих на порфірію можливе виникнення гострого нападу.

Алергічні реакції

Дуже рідко, незалежно від дози, спостерігалися такі небажані ефекти: шкірні висипання, кропив'янка, еритема, свербіж, ексфолюативний дерматит, світлочутливі реакції, мультиформна екзантема, токсичний епідермальний некроліз, синдром Стівена-Джонсона, синдром Сьогрена (Шегрена), системний червоний вовчак, сироваткова хвороба, гарячка, лімфаденопатія, періорбітальний набряк, кон'юнктивальний або склеральний вузловий поліартеріт та еозинофілія.

З боку дихальної системи.

Рідко – задишка, кашель, інфільтрати в тканині легень і фіброзний альвеоліт.

З боку м'язово-скелетної системи.

Рідко – артралгія.

Лабораторні випробування.

Протягом лікування сульфасалазином можуть підвищуватись рівні активності амілази сироватки, білірубину, лужної фосфатази і трансамінази печінки.

Передозування.

Надмірні дози сульфасалазину спричиняють нудоту, блювання та абдомінальний біль. При застосуванні дуже високих доз можуть мати місце анурія, кристалурія, гематурія та симптоми токсичного ураження центральної нервової системи (судоми). Токсичність пропорційна концентрації сульфапіридину в крові.

Слід ретельно спостерігати за станом хворого, оскільки у деяких випадках може виникати метгемоглобінемія або сульфгемоглобінемія, що потребує відповідного лікування.

У разі появи симптомів передозування необхідно викликати блювання, промити шлунок, очистити кишечник, здійснити алкалізацію сечі, форсований діурез. У разі анурії та/або ниркової недостатності споживання рідини і електролітів слід обмежити. Ефективність заходів, що приймаються, може бути оцінена за рівнем концентрації сульфапіридину в сироватці.

Застосування у період вагітності та годування груддю.

Оскільки шкідливий вплив повністю не виключений, сульфасалазин можна призначати вагітним жінкам лише за суворими показаннями і в мінімально ефективних дозах.

На час лікування слід припинити годування груддю.

Діти.

Застосовують дітям віком від 6 років.

Особливості застосування.

Усім хворим рекомендовано проведення аналізів крові (розгорнутий аналіз крові; на початку лікування 1 – 2 рази на місяць, далі кожні 3 – 6 місяців), а також аналіз сечі перед початком лікування та в процесі лікування.

Під час лікування повинна бути забезпечена достатня гідратація пацієнтів.

Пацієнтам з порушенням функції печінки або нирок сульфасалазин призначають лише тоді, коли потенційна користь переважає ризик.

Спеціальне спостереження в період лікування сульфасалазином необхідне хворим з нирковою або печінковою недостатністю, бронхіальною астмою і алергією (можлива перехресна гіперчутливість до фуросеміду, тіазидних діуретиків, похідних сульфонілсечовини, інгібіторів карбонангідрази). У разі появи алергічних реакцій або інших серйозних небажаних ефектів лікування сульфасалазином має бути негайно припинене. При нетяжких формах алергії на сульфасалазин можливе проведення десенсибілізації.

Препарат не рекомендований при системних формах ювенільних ревматоїдних артритів, оскільки він часто є причиною небажаних ефектів, наприклад сироваткової хвороби. Типовими симптомами є гарячка, нудота, блювання, головний біль, висипання, порушення функції печінки. Цей стан часто буває тяжким.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Під час лікування слід утриматись від керування автотранспортом та роботи з точними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодії.

Сульфасалазин зменшує абсорбцію фолієвої кислоти і дигоксину. При одночасному призначенні з антикоагулянтами і гіпоглікемічними засобами – похідними сульфонілсечовини він підсилює їх дію. У зв'язку з пригніченням сульфасалазином ферменту тіопуринметилтрансферази при одночасному застосуванні сульфасалазину і тіопурин-6-меркаптопурину або азатіопурину може виникнути

пригнічення функції кісткового мозку і лейкопенія.

Застосування сульфасалазину та метотрексату у хворих на ревматоїдний артрит не змінює фармакокінетичних характеристик препарату. Проте повідомлялося про збільшену частоту побічних проявів з боку травного тракту, зокрема нудоти. Антибіотики можуть зменшувати ефективність Сульфасалазину-ЕН.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Накопичується в сполучній тканині кишечника з вивільненням 5-аміносаліцилової кислоти, яка має протизапальні властивості, та сульфапіридину, який чинить протимікробну дію щодо диплококів, стрептококів, гонококів, кишкової палички. Проявляє імуносупресивну дію, особливо в сполучній тканині, кишковій стінці і серозній рідині, де його концентрація найвища. Сульфапіридин зменшує системне запалення і чинить антибактеріальну дію, перешкоджає дії природних клітинних кілерів і трансформації лейкоцитів. Протизапальна дія 5-аміносаліцилової кислоти (месалазин) найбільше значуща в лікуванні запальних захворювань кишечника. Головним чином, вона локально інгібує циклооксигеназу та ліпооксигеназу в кишковій стінці і таким чином запобігає утворенню простагландинів, лейкотрієнів та інших медіаторів запалення. Завдяки низькій абсорбції зменшує запалення у товстому кишечнику.

Фармакокінетика.

Приблизно 30% прийнятої дози сульфасалазину абсорбується в тонкому кишечнику; інші 70% метаболізуються кишковими бактеріями в товстому кишечнику в сульфапіридин і 5-аміносаліцилову кислоту. Максимальні концентрації сульфасалазину та його метаболітів у сироватці досить сильно відрізняються у різних пацієнтів – при низькому рівні ацетилювання вони набагато вищі і пов'язані з частішими випадками небажаних явищ. Максимальна сироваткова концентрація сульфасалазину досягається через 3-12 год після прийому кишковорозчинних таблеток. Він добре зв'язується з білками плазми і сполучною тканиною. Найбільша частина абсорбованої кількості сульфасалазину повертається з жовчю в кишечник; незначна кількість виділяється в незміненому вигляді з сечею. Період напіввиведення сульфасалазину становить від 5 до 10 год.

Найбільша частина звільненого сульфапіридину абсорбується і досягає максимальної концентрації у сироваті через 12 – 24 год після прийому препарату. Метаболізуються в печінці (шляхом ацетилювання, гідроксилювання і кон'югації з глюкуроновою кислотою), екскретується нирками. Період напіввиведення – від 6 до 14 год, залежно від швидкості ацетилювання. Тільки майже 30% 5-аміносаліцилової кислоти абсорбується і ацетилюється в печінці та виводиться нирками з сечею. Решта виділяється в незміненому вигляді з калом.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі, світло-коричневі, злегка двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25°C. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, 5 блістерів у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. КРКА, д.д., Ново место, Словенія.

Місцезнаходження. Шмар'ешка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

