

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
САЛОФАЛЬК
(SALOFALK)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: mesalazine;

основні фізико-хімічні властивості: гомогенна суспензія, що має колір від дуже світлого коричневого до коричневого, позбавлена сторонніх часток;

склад: 1 клізма (60 г суспензії) містить 4 г месалазину (5-аміносаліцилової кислоти);

допоміжні речовини: натрію бензоат, калію метабісульфіт, динатрію едетат, карбомер 934 Р [карбопол 974 Р], калію ацетат, камедь ксантанова, вода очищена.

Форма випуску. Суспензія ректальна.

Фармакотерапевтична група. Протизапальний засіб, що застосовується при захворюваннях кишечника. Код АТС А 07 ЕС 02.

Фармакологічні властивості.

Механізм протизапальної дії не відомий. Результати досліджень *in vitro* свідчать, що певну роль може мати інгібування ліпоксигенази.

Було також продемонстровано вплив месалазину на концентрацію простагландинів у слизовій оболонці кишечника. Месалазин (5-аміносаліцилова кислота / 5-АСК) може також діяти як поглинач радикалів реактивних сполук кисню.

Месалазин при ректальному введенні діє переважним чином локально на слизову оболонку кишок і на підслизову тканину.

Фармакокінетика.

Загальні властивості месалазину

Поглинання

Поглинання месалазину у найвищим в проксимальній частині кишечника і найнижчим – в дистальній його частині.

Біотрансформація

Месалазин метаболізується як досистемно у слизовій оболонці кишечника, так і у печінці у фармакологічно неактивну N-ацетил-5-аміносаліцилову кислоту (N-Ац-5-АСК). Очевидно, що ацетилювання не залежить від фенотипу апарату для ацетилювання хворого. Ацетилювання деякою мірою також відбувається завдяки дії бактерій в товстому кишечнику. Зв'язування месалазину і N-Ац-5-АСК з білками становить відповідно 43 % і 78 %.

Виведення/екскреція

Месалазин і його метаболіт N-Ац-5-АСК виводяться з фекаліями (основна частина), через нирки (варіює між 20 і 50 % залежно від способу застосування, лікарської форми і шляху вивільнення месалазину відповідно) і з жовчю (незначна частина). Ниркова екскреція відбувається переважно у вигляді N-Ац-5-АСК. Близько 1 % від загальної введеної пероральної дози месалазину екскретується до грудного молока головним чином у вигляді N-Ац-5-АСК.

Специфічні аспекти для клізм Салофальку 4 г/60 мл

Розподіл

Інтраскопичне дослідження у хворих на незначний або помірний виразковий коліт показало, що рідина клізм на початку лікування та при ремісії через 12 тижнів розподіляється головним чином у прямій та сигмоподібній кишках і меншою мірою – в ободовій кишці.

Поглинання та виведення:

У дослідженні на хворих на виразковий коліт у стадії ремісії пік концентрації в плазмі, що дорівнював 0,92 мкг/мл 5 АСК і 1,62 мкг/мл N-Ац-5-АСК, досягався приблизно через 11-12 годин за сталих умов. Швидкість виведення була приблизно 13 % (через 45 годин), причому головним чином (близько 85 %) у вигляді метаболіту N-Ац-5-АСК.

Концентрація в плазмі за сталих умов 5-АСК і N-Ац-5-АСК у дітей з хронічним запальним захворюванням кишечника при лікуванні клізмами Салофальку 4 г/60 мл становила 0,5 – 2,8 мкг/мл і 0,9 – 4,1 мкг/мл відповідно.

Показання для застосування.

Гострі напади виразкового коліту.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі

Звичайно використовується нижченаведена схема дозування

Хворим із симптомами гострого запалення вміст однієї клізмової пляшки (60 г суспензії) вводиться в кишечник у вигляді клізми один раз на добу, перед сном.

Діти старше 6 років і підлітки

Клізми Салофальку в дозуванні 4 г/60 мл.

Потрібне дозування клізми потрібно підбирати, виходячи із тяжкості і вираженості захворювання товстого кишечника і маси тіла дитини або підлітка.

Звичайно рекомендується застосовувати половину дози для дорослих при масі тіла до 40 кг і повну звичайну дозу для дорослих - при масі тіла більше 40 кг.

Дітям, з масою тіла більше 40 кг можна призначати також половину дози (2 г/30 мл) клізми Салофальку 4 г/60 мл або повну дозу Салофальку 4 г/60 мл, залежно від ступеня запалення.

Для застосування половини дози при введенні суспензії клізму необхідно натиснути тільки до половини. Вона може триматись у цьому положенні завдяки клапану, що знаходиться нагорі клізми. Друга половина клізмової пляшки, що залишилась може бути використана наступного дня.

Найкращі результати досягаються тоді, коли перед застосуванням клізми Салофальку кишечник спорожняють.

Бажаний терапевтичний результат можна досягти лише при регулярному і постійному застосуванні клізм Салофальку.

Тривалість лікування визначає лікар індивідуально залежно від перебігу захворювання.

Гострі напади виразкового коліту регресують, як правило через 8 – 12 тижнів, після чого клізми Салофальку 4 г/60 мл звичайно не застосовують.

Побічна дія.

Для оцінки несприятливих явищ застосовують такі дані щодо їх частоти:

Дуже часті: ті, що спостерігаються більше ніж у 1 хворого, що лікується, з 10	Часті: ті, що спостерігаються більше ніж у 1 хворого, що лікується, із 100
Нечасті: ті, що спостерігаються більше ніж у 1 хворого, що лікується, з 1 000	Рідкі: ті, що спостерігаються більше ніж у 1 хворого, що лікується, з 10 000
Дуже рідкі: ті, що спостерігаються в 1 випадку з 10 000 хворих, що лікуються, або нечисленні, включаючи окремі випадки	

Побічні явища, пов'язані з шлунково-кишковим трактом (рідкі):

біль у черевній порожнині, діарея, метеоризм, нудота і блювання.

Побічні явища, пов'язані з центральною нервовою системою (рідкі):

головний біль, запаморочення.

Побічні явища, пов'язані з нирками (дуже рідкі):

порушення функції нирок, включаючи гострий хронічний інтестинальний нефрит і ниркову недостатність.

Реакції гіперчутливості (дуже рідкі):

алергічна висип, медикаментозна гарячка, бронхоспазм, перикардит, міокардит, гострий панкреатит, алергічний альвеоліт, синдром червоного вовчака, панколіт.

М'язово-скелетні порушення (дуже рідкі):

міалгія та артралгія.

Порушення з боку кровоносної і лімфатичної систем (дуже рідкі):

зміни у складі крові (апластична анемія, агранулоцитоз, панцитопенія, нейтропенія, лейкопенія, тромбоцитопенія).

Порушення з боку печінки і жовчного міхура (дуже рідкі):

зміни у параметрах функції печінки (підвищення активності трансаміназ і параметрів застою жовчі), гепатит, холестатичний гепатит.

Порушення з боку шкіри і її придатків (дуже рідкі):

алопеція.

Протипоказання.

Клізми Салофальку не можна застосовувати:

- за наявністю гіперчутливості до саліцилової кислоти, її похідних, метабісульфіту калію або будь-якого з інших інгредієнтів;
- з тяжким порушенням функції печінки або нирок;
- з наявними виразками шлунка або дванадцятипалої кишки;
- хворим з геморагічним діатезом;
- у дітей до 6 років.

Передозування.

На сьогодні про випадки інтоксикації та специфічні антидоти не повідомлялось.

За необхідності можна застосувати внутрішньовенну інфузію електролітів (примусовий діурез).

Особливості застосування.

Необхідно протягом лікування та після робити аналізи крові (формені елементи; параметри функції печінки, такі як АЛТ або АСТ; креатинін сироватки) та сечі (тестові смужки, осад). Орієнтовно аналізи рекомендується робити через 14 днів від початку лікування і потім ще 2 – 3 рази з інтервалами 4 тижні. Якщо результати лабораторних досліджень у межах норми, рутинні перевірки можуть проводитись 4 рази на рік, але при появі інших додаткових симптомів аналізи необхідно робити терміново.

Особлива увага повинна приділятися при порушенні функції печінки.

Клізми Салофальку не рекомендується застосовувати хворим з порушеною функцією нирок. При погіршенні функції нирок протягом лікування слід брати до уваги індуковану месалазином токсичність відносно нирок.

Пацієнти з легеневиими захворюваннями, у тому числі хворі на астму, повинні знаходитись під наглядом лікаря протягом курсу лікування клізмами Салофальку.

Хворі, які мають несприятливі реакції на препарати, що містять сульфасалазин, повинні перебувати під спостереженням від самого початку лікувального курсу із застосуванням клізм Салофальку. У випадку гострих симптомів непереносимості, таких як судом, гострий біль у животі, гарячка, сильний головний біль і висип, терапію препаратом треба негайно припинити.

Через те що до складу клізм Салофальку 4 г/60 мл входить метабісульфіт калію, вони можуть провокувати алергічні реакції із симптомами анафілаксії та скорочення бронхів (бронхоспазму) у чутливих хворих, зокрема у тих, хто має в анамнезі астму або алергії.

Внаслідок того, що препарат містить натрію бензоат, можуть виникнути реакції гіперчутливості у схильних до них хворих у вигляді подразнення шкіри, очей і слизових оболонок.

Клізми Салофальку не слід призначати дітям до 6 років.

Вагітність і лактація

Даних про застосування клізм Салофальку для лікування вагітних жінок недостатньо, проте дані про застосування в обмеженій кількості вагітних свідчать про відсутність небажаних впливів месалазину на перебіг вагітності або на здоров'я плода та (або) новонародженого. На сьогодні немає ніякі інші епідеміологічні дані, що мають відношення до препарату не відомі. В єдиному випадку після тривалого застосування в період вагітності месалазину у високій дозі (2-4 г перорально) повідомлялось про ниркову недостатність у новонародженого.

Клізми Салофальку необхідно застосовувати в період вагітності лише тоді, коли очікувана користь від застосування переважатиме можливий ризик.

N-ацетил-5-аміносаліцилова кислота і, меншою мірою, месалазин екскретуються до грудного молока. На сьогодні є лише обмежений досвід застосування для лікування жінок у період лактації. Не можна виключити реакцій гіперчутливості, таких як діарея. Отже, клізми Салофальку повинні застосовуватись у період годування груддю лише тоді, коли очікувана користь від застосування переважатиме можливий ризик. Якщо у грудної дитини розвинеться діарея, годування груддю слід припинити.

Вплив на здатність керувати автомобілем і працювати з механізмами

Ніякого впливу на здатність керувати автомобілем та працювати з механізмами не спостерігалось.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Спеціальних досліджень взаємодії не проводилось.

Взаємодії можуть мати місце протягом лікування клізмами Салофальку 4 г/60 мл при одночасному застосуванні нижченаведених лікарських препаратів. Більшість з цих можливих взаємодій ґрунтується на теоретичних міркуваннях:

- Антикоагулянти кумаринового типу: можливо потенціювання антикоагулюючого ефекту (збільшення ризику кишкової кровотечі);
- Глюкокортикоїди: можливо посилення небажаних шлункових явищ;
- Сульфанілсечовини: можливо посилення цукрознижуючих

- Метотрексат: можливо збільшення токсичної дії метотрексату;
- Пробенецид / сульфінпіразон: можливо послаблення урикозуричного ефекту;
- Спіронолактон / фуросемід: можливо зменшення діуретичного ефекту;
- Рифампіцин: можливо послаблення туберкулостатичного ефекту.

У хворих, які одночасно приймають азатиоприн або 6-меркаптопурин, можливо посилення мієлосупресивного ефекту азатиоприну або 6-меркаптопурину.

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при кімнатній температурі (не вище 25 С), в запечатаному блістері. Захищати від світла.

Термін придатності – 2 роки. Термін придатності розкритої та напіввикористаної клізми становить 2 доби. Відкрити та напіввикористану клізму слід зберігати при кімнатній температурі (не вище 25 С). Препарат не можна застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Суспензія ректальна 4 г/60 мл у клізмах; клізма по 60 г; 7 клізм у блістерах в коробці з картону.

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

Адреса. Лайненвеберштрассе 5,
Д-79108 Фрайбург, Німеччина
(Leinenweberstrasse 5,
D-79108 Freiburg, Germany).