

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
САЛОФАЛЬК
(SALOFALK)

Загальна характеристика:

Міжнародна назва: mesalazine;

основні фізико-хімічні властивості: супозиторії торпедоподібної форми, від білого до кремового кольору, з рівномірною консистенцією та непошкодженою, гладкою поверхнею;

склад: 1 супозиторій містить 250 мг месалазину (5-аміносаліцилової кислоти);

допоміжні речовини: жир твердий.

1 супозиторій містить 500 мг месалазину (5-аміносаліцилової кислоти);

допоміжні речовини: жир твердий, спирт цетиловий, натрію докунат.

Форма випуску. Супозиторії ректальні.

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

Фармакологічні властивості.

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

Доведено вплив 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 ендотелій з просвіту кишок.

Фармакокінетика.

Загальні властивості месалазину

Поглинання

Поглинання месалазину є найвищим у 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 ацетиляторного фенотипу хворого. Деяке ацетилювання 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 типу 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 перорально дози месалазину екскретується до грудного молока головним чином у вигляді N-Ац-5-АСК.

Специфічні аспекти для супозиторіїв Салофальку

Розподіл

Сцинтиграфічне дослідження з міченими технецієм супозиторіями Салофальку показало пік розповсюдження супозиторія, що розтанув при температурі тіла, через 2 – 3 години. Розповсюдження обмежене перш за все прямою кишкою і ретросигмоподібним з'єднан'ям. Отже, супозиторії

Салофальку особливо придатні для лікування проктиту (виразкового коліту прямої кишки).

Поглинання

Пік концентрації в плазмі 5-АСК після одноразового застосування, а також при терапії протягом декількох тижнів 500 мг месалазину тричі на добу у вигляді супозиторіїв Салофальку варіював від 0,1 до 1,0 мкг/мл, тоді як для основного метаболіту N-Ац-5-АСК – від 0,3 до 1,6 мкг/мл. У деяких випадках пік концентрації 5-АСК в плазмі досягався протягом 1 години після застосування.

Виведення

Після одноразового застосування 500 мг месалазину у вигляді супозиторія Салофальку приблизно 11 % (протягом 72 годин) і після кількотижневої терапії 500 мг месалазину тричі на добу у вигляді супозиторіїв Салофальку приблизно 13 % від введеної дози 5-АСК виводились із сечею. Приблизно 10 % від введеної дози виводилося з жовчю.

Показання для застосування.

Салофальк, супозиторії по 250 мг

Лікування та профілактика рецидивів виразкового коліту, обмеженого прямою кишкою.

Салофальк, супозиторії по 500 мг

Лікування загострень виразкового коліту, обмеженого прямою кишкою.

Спосіб застосування та дози.

Салофальк супозиторії по 250 мг

Для лікування загострень виразкового коліту

Залежно від індивідуальної клінічної потреби 2 супозиторія Салофальку 250 мг або 1 супозиторій Салофальку 500 мг вводиться прямою кишкою тричі на добу (еквівалентно 1 500 мг месалазину на добу).

Профілактика рецидивів виразкового коліту

Один супозиторій Салофальку 250 мг тричі на добу (що еквівалентно 750 мг месалазину на добу).

Діти старше 6 років і підлітки

Залежно від тяжкості захворювання під час загострення слід призначати 30-50 мг месалазину на 1 кг маси тіла на добу, поділені на три порції.

Для профілактики рецидивів слід призначати 15-30 мг месалазину на 1 кг маси тіла на добу, поділені на дві або три порції.

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.

Отже, діти, з масою тіла до 40 кг, отримують

- при загостреннях: 1 супозиторій Салофальку 250 мг тричі на добу;

- для профілактики рецидивів: 1 супозиторій Салофальку 250 мг двічі на добу (зранку і ввечері).

Діти з масою тіла більше 40 кг отримують дозу для дорослих.

Коли супозиторії Салофальку застосовують тричі на день, їх вводять в анус вранці, вдень і ввечері.

Бажаного лікувального результату можна досягти лише при регулярному і постійному застосуванні супозиторіїв Салофальку.

Загострення виразкового коліту стихають протягом 8 – 12 тижнів. Тривалість застосування визначає лікар.

Салофальк супозиторії по 500 мг

Залежно від індивідуальної клінічної потреби 1 супозиторій Салофальку 500 мг вводиться в пряму кишку тричі на добу (еквівалентно 1 500 мг месалазину на добу).

Як тільки досягнуто покращення стану, доза повинна бути зменшена до 250 мг месалазину (1 супозиторій Салофальк 250 мг), що застосовується тричі на день для профілактики повторення загострення.

Діти старше 6 років і підлітки

Залежно від тяжкості захворювання під час загострення слід призначати 30-50 мг месалазину на 1 кг маси тіла на добу, поділені на три порції, у період загострення.

Для профілактики рецидивів слід призначати 15-30 мг месалазину на 1 кг маси тіла на добу, поділені на дві або три порції.

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.

Отже, діти з масою тіла до 40 кг отримують:

- при загостреннях: 1 супозиторій Салофальку 250 мг тричі на добу;
- для профілактики рецидивів: 1 супозиторій Салофальку 250 мг двічі на добу (зранку і ввечері).

Діти з масою тіла більше 40 кг отримують дозу для дорослих.

Коли супозиторії Салофальку застосовують тричі на добу, їх вводять в анус вранці, вдень і ввечері.

Бажаного лікувального результату можна досягти лише при регулярному і постійному застосуванні супозиторіїв Салофальку.

Загострення зазвичай стихає впродовж 8 – 12 тижнів. Тривалість лікування визначає лікар.

Побічна дія.

Для оцінки несприятливих явищ застосовують такі дані щодо їх частоти:

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

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 висипка, 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 параметри застою жовчі), гепатит, холестатичний гепатит.

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

Алопеція.

Протипоказання.

Супозиторії Салофальку не можна застосовувати пацієнтам з:

- наявністю гіперчутливості до саліцилової кислоти, її похідних, метабісульфіту калію або будь-якого з інших інгредієнтів, що входить до складу лікарського засобу;
- тяжким порушенням функції печінки або нирок;
- наявними виразками шлунка або дванадцятипалої кишки;
- геморагічним діатезом.

Діти до 6 років.

Передозування.

На сьогодні про випадки інтоксикації не повідомлялось.

У разі необхідності можна застосувати внутрішньовенну інфузію електролітів (примусовий діурез).

Особливості застосування.

Протягом та після лікування потрібно 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 досліджень нормальні, рутинні перевірки рекомендується проводити кожні 3 місяця, але при появі будь-яких симптомів розвитку захворювання, аналізи необхідно робити терміново.

Особлива увага повинна приділятися при порушенні функції печінки.

Супозиторії Салофальку не рекомендується застосовувати хворим з порушеною функцією нирок. При погіршенні функції нирок під час лікування слід мати на увазі індуковану месалазином токсичність по відношенню до нирок.

Пацієнти з легневими захворюваннями, зокрема хворі на астму, повинні знаходитись під наглядом протягом курсу лікування супозиторіями Салофальку.

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

Вагітність і лактація.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Даних про лікування Салофальку супозиторіями вагітних жінок недостатньо, проте дані про застосування в обмеженій кількості вагітних вказують на відсутність небажаних впливів месалазину на перебіг вагітності або на здоров'я плода та (або) новонародженого. На сьогодні немає ніяких інших епідеміологічних даних, що мають відношення до препарату. В одному єдиному випадку після тривалого застосування в період вагітності месалазину у високій дозі (2-4 г перорально) повідомлялось про ниркову недостатність у новонародженого.

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

N-ацетил-5-аміносаліцилова кислота і, меншою мірою, месалазин екскретуються в грудне молоко. На сьогодні є лише обмежений досвід застосування для лікування жінок у період лактації. Не можна виключити реакцій гіперчутливості, таких як діарея. Отже, супозиторії Салофальку повинні застосовуватись в 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 користуватись механізмами

Ніякого впливу на здатність керувати автомобілем та користуватись механізмами не спостерігалось. Однак, якщо пацієнт відчуває будь-які явища з боку центральної-нервової системи згадані в розділі "Побічна дія", йому не слід керувати транспортом та працювати з механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Спеціальних досліджень взаємодії не проводилось.

Взаємодії можуть мати місце протягом лікування супозиторіями Салофальку 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 ефектів у крові. |
| - 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 азатіоприн або 6-меркаптопурин, можливо посилення мієлосупресивного ефекту азатіоприну або 6-меркаптопурину.

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

Термін придатності – 3 роки. Препарат не можна застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Супозиторії ректальні по 250 мг або 500 мг по 10 штук у контурних чарункових упаковках; по 2 контурні чарункові упаковки кожна з яких містить по 5 супозиторіїв у 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).