

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

Торговое название
МЕСАЛАПРИН

Международное непатентованное название (МНН)
Месалазин

Общая характеристика

Суппозитории цилиндрической формы, от светло-серого до серого с бежевым или розовым оттенком цвета.

Состав

1 суппозиторий по 250 мг содержит:
активное вещество: месалазин - 250 мг;
вспомогательное вещество: твердый жир.

1 суппозиторий по 500 мг содержит:
активное вещество: месалазин - 500 мг;
вспомогательные вещества: цетиловый спирт, докузат натрия, твердый жир.

Форма выпуска

Суппозитории ректальные

Фармакотерапевтическая группа и код АТХ

Кишечные противовоспалительные препараты. Аминосалициловая кислота и аналогичные препараты. Код АТХ: А07ЕС02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Результаты исследований *in vitro* свидетельствуют, что определенную роль может иметь ингибирование фермента липооксигеназы. Также продемонстрировано воздействие на концентрации простагландинов в слизистой оболочке кишечника. Месалазин (5-аминосалициловая кислота/5-АСК) может также действовать как поглотитель радикалов реактивных соединений кислорода.

При попадании в просвет кишечника при ректальном применении месалазин оказывает значительное местное действие на слизистую оболочку кишечника и на подслизистые слои.

Фармакокинетика

Общие свойства месалазина

Всасывание

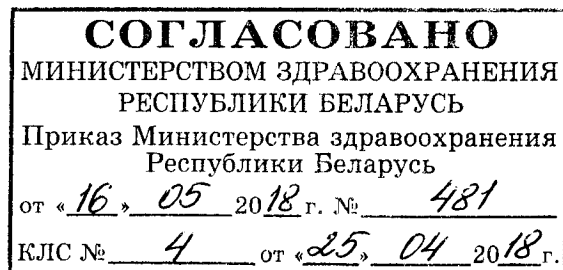
Месалазин всасывается максимально в проксимальных отделах и минимально в дистальных отделах кишечника.

Биотрансформация

Месалазин подвергается пресистемному метаболизму с образованием неактивной N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты (N-Ац-5-АСК), как в слизистой оболочке кишечника, так и в печени. По-видимому, ацетилирование не зависит от фенотипа ацетилирования пациента. Часть месалазина также ацетируется бактериями толстого кишечника. Связь с белками плазмы составляет 43 % для месалазина и 78 % для N-Ац-5-АСК.

Выведение/экскреция

Месалазин и его метаболит N-Ац-5-АСК выводятся с калом (основная часть), почками (объем варьирует от 20 % до 50 %, в зависимости от пути введения, лекарственной формы и



механизма высвобождения активного вещества) и желчью (меньшая часть). Почками выводится преимущественно в виде метаболита N-Ац-5-АСК. Около 1 % общей введенной перорально дозы месалазина выделяется с грудным молоком, в основном в виде N-Ац-5-АСК.

Специфические особенности суппозиториев Месалаприн

Распределение

В скинтиграфических исследованиях с мечеными изотопом технецием, проводимые с использованием суппозиториев Месалаприн установлено, что пик распространения суппозитория наступает через 2-3 ч после введения препарата. Распространение ограничено, прежде всего, прямой кишкой и ректосигмовидным отделом ободочной кишки.

Всасывание

Максимальная концентрация 5-аминосалициловой кислоты в плазме крови после ректального применения однократной дозы, а также после применения многократных доз (в течение нескольких недель Месалаприн суппозитории 500 мг 3 раза в день) находится в интервале 0,1-1,0 мкг/мл, а концентрация основного метаболита составляет 0,3-1,6 мкг/мл. Период достижения максимальной концентрации составляет 1 час.

Выведение

После однократного ректального введения суппозитория Месалаприн около 11 % препарата (в течение 72 ч) выводится с мочой, а после многократного применения около 13 % выводится с мочой. Примерно 10 % препарата выводится с желчью.

Показания к применению

Лечение острых приступов и предотвращение рецидива язвенного колита, выраженной в легкой или умеренной форме, ограниченного прямой кишкой (язвенный проктит).

Способ применения и дозы

Ректально

Взрослым и пациентам пожилого возраста

В острой фазе заболевания назначают по 2 суппозитория 250 мг 3 раза в день или по 1 суппозиторию 500 мг 3 раза в день. Максимальная суточная доза – 1500 мг.

С целью профилактики рецидивов назначают по 1 суппозиторию 250 мг 3 раза в день, при необходимости в течение нескольких лет.

Продолжительность приема определяется лечащим врачом.

Дети

Не существует достаточных клинических данных о применении препарата детям.

Способ применения

Ректально. Непосредственно перед введением суппозитория рекомендуется опорожнить кишечник. При трехкратном применении суппозитории следует ввести утром, в середине дня и вечером. Лечение суппозиториями Месалаприн должно проводиться регулярно и согласно инструкции, так как эффект достигается при выполнении этих условий.

Нежелательные реакции

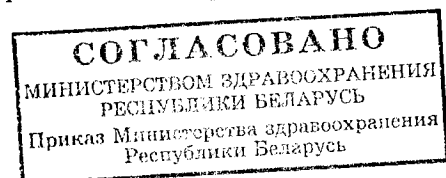
Конвенция MedDRA по частоте

Очень частые ($\geq 1/10$); частые ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечастые ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редкие ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редкие ($< 1/10000$), с неизвестной частотой (не могут быть оценены на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редкие - изменения в составе крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, тромбоцитопения).

Нарушения со стороны нервной системы: редкие - головная боль, головокружение; очень редкие - периферическая нейропатия.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: редкие - миокардит, перикардит.



Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень редкие - аллергические и фиброзные легочные реакции (включая одышку, кашель, бронхоспазм, альвеолит, легочную эозинофилию, инфильтрацию легких, пневмонию).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: редкие - боль в области живота, диарея, метеоризм, тошнота, рвота, запор; очень редкие - острый панкреатит.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редкие - нарушение функции почек, включая острый и хронический интерстициальный нефрит и почечную недостаточность.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редкие - алопеция.

Нарушения со стороны мышечной и суставной систем: очень редкие - миалгия, артралгия.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редкие - реакции гиперчувствительности, такие как аллергическая экзантема, медикаментозная лихорадка, синдром красной волчанки, панколит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редкие - изменения функциональных параметров печени (повышение уровня трансаминаз и параметров холестаза), гепатит, холестатический гепатит.

Нарушения со стороны репродуктивной системы: очень редкие - олигоспермия (обратимая).

Противопоказания

- Гиперчувствительность к салициловой кислоте и ее производным или к любому из вспомогательных веществ;
- тяжелые нарушения функции печени и почек.

Передозировка

Сообщения о случаях передозировки месалазина ограничены, признаки почечной или печеночной токсичности отсутствуют.

Специфического антидота нет, лечение является симптоматическим и поддерживающим.

Меры предосторожности

Перед началом и в течение лечения необходимо проводить анализ крови (общий анализ крови с подсчетом форменных элементов), параметры функции печени (уровни ферментов АЛТ или АСТ, содержание креатинина в плазме крови) и анализ мочи (экспресс - тесты). Рекомендуются проводить контроль через 14 дней после начала лечения и затем 2-3 раза с интервалами в 4 нед. Если полученные результаты соответствуют норме, тогда достаточно проводить данные анализы каждые 3 мес. Если появляются дополнительные проявления заболевания, анализы следует провести немедленно.

Особое внимание необходимо при лечении пациентов с нарушением функции печени. Не рекомендуется применять препарат Месалаприн суппозитории у больных с нарушенной функцией почек. Если во время лечения снижается функция почек, следует предположить наличие нефротоксичности, связанной с месалазином.

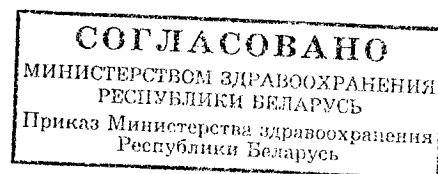
Пациенты с расстройствами дыхательной системы, в том числе с бронхиальной астмой, должны находиться под наблюдением врача в течение курса лечения суппозиториями Месалаприн.

Лечение пациентов с гиперчувствительностью к препаратам, содержащим сульфасалазин, требуют наблюдения врача. При появлении симптомов острой непереносимости, таких, как спазмы, острая боль в области живота, лихорадка, сильные головные боли и сыпь на коже лечение следует немедленно прекратить.

В связи с содержанием цетилового спирта в качестве вспомогательного вещества, могут возникать местные кожные реакции (например, дерматит контакт).

Беременность и лактация

Достаточных данных относительно применения Месалаприн суппозитории у беременных нет. Тем не менее, не наблюдалось никаких негативных эффектов на беременность или здоровье плода и/или новорожденного.



Исследования на животных при пероральном применении месалазина не продемонстрировали никаких прямых или косвенных побочных эффектов на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие. Применение препарата в период беременности возможно только в том случае, когда потенциальная польза превышает возможный риск.

N-ацетил-5-аминосалициловая кислота и, в меньшей мере, месалазин секретируются в материнское молоко. Опыт применения месалазина во время грудного вскармливания очень ограничен. У младенцев не исключены такие аллергические реакции, как диарея. Поэтому препарат Месалаприн суппозитории во время грудного вскармливания можно применять только тогда, когда потенциальная польза для матери преобладает над вероятным риском для плода. При появлении у ребенка грудного возраста диареи кормление грудью следует прекратить.

Влияние на способность управлять механическими средствами передвижения и обслуживать механические устройства, находящиеся в движении

Месалаприн не оказывает влияния на способность к вождению автотранспорта и управлению потенциально опасными механизмами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Конкретные исследования взаимодействия не проводились.

При одновременном применении азатиоприна, 6-меркаптопурина или тиогуанина необходимо иметь в виду вероятность усиления миелосупрессивного эффекта. Существуют слабые доказательства того, что месалазин может уменьшить антикоагулянтное действие варфарина.

Условия и срок хранения

В защищенном от влаги и света месте, при температуре не выше 25 °С.

Не замораживать.

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

Упаковка

По 7 суппозиториев в контурной ячейковой упаковке из ПВХ/ПЭ пленки.

По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

Информация о производителе

ЗАО «ИНТЕГРАФАРМ»

УНП 691778830, Республика Беларусь, 223045,

Минская область, Минский р-н, Юзуфовский с/с, 8-5, р-н а/г Юзуфово.

тел. +375 44 570 56 61

e-mail: office@integrafarm.by

