

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Месалазол, 250 мг, суппозитории ректальные

Месалазол, 500 мг, суппозитории ректальные

**2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ**

Действующее вещество: mesalazine

Месалазол, 250 мг, суппозитории ректальные

Каждый суппозиторий содержит 250 мг месалазина.

Месалазол, 500 мг, суппозитории ректальные

Каждый суппозиторий содержит 500 мг месалазина.

Вспомогательное вещество, наличие которого надо учитывать в составе лекарственного препарата: цетиловый спирт.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Суппозитории ректальные

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

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Лечение острых приступов и предотвращение рецидива хронического язвенного колита, ограниченного прямой кишкой (язвенный проктит).

4.2 Режим дозирования и способ примененияВзрослым 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 Месалазол должно проводиться регулярно и согласно рекомендациям, так как эффект достигается при выполнении этих условий.

4.3 Противопоказания

- Гиперчувствительность к месалазину, салициловой кислоте и ее производным или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- тяжелые нарушения функции печени и почек.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении
 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). Рекомендуется 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 Месалазол у больных с нарушенной функцией почек. Перед началом лечения следует обратить внимание на индуцированную месалазином токсичность по отношению к почкам.

Нефролитиаз

Были получены сообщения о развитии нефролитиаза при применении месалазина, включая камни со 100 % содержанием мезалазина. Во время применения препарата рекомендуется обеспечить адекватное потребление жидкости.

Тяжелые кожные нежелательные реакции

Сообщалось о тяжелых кожных нежелательных реакциях (SCAR), включая синдром Стивенса-Джонсона (ССД) и токсический эпидермальный некролиз (ТЭН), в связи с лечением месалазином. Применение месалазина следует прекратить при первых признаках и симптомах тяжелых кожных реакций, таких как кожная сыпь, повреждение слизистых оболочек или любые другие признаки гиперчувствительности.

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

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

Месалазол 500 мг суппозитории ректальные содержат цетиловый спирт, который может вызывать местные кожные реакции (например, контактный дерматит)

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Контролируемых исследований взаимодействия лекарственного средства не проводилось. При одновременном применении азатиоприна, 6-меркаптопурина или тиогуанина необходимо иметь в виду вероятность усиления миелосупрессивного эффекта. По неподтвержденным данным, месалазин может уменьшить антикоагулянтное действие варфарина.

4.6 Фертильность, беременность и лактация

Достаточных данных относительно применения месалазина у беременных нет. Тем не менее, не наблюдалось никаких негативных эффектов на беременность или здоровье плода и новорожденного. Сообщалось об одном случае почечной недостаточности у новорожденного, рожденного женщиной длительное время получавшей высокие дозы месалазина.

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, экскретируются в материнское молоко. Опыт применения месалазина во время грудного вскармливания очень ограничен. У младенцев не исключены такие аллергические реакции, как диарея.

Поэтому препарат Месалазол 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.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Месалазол не оказывает влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению потенциально опасными механизмами.

4.8 Нежелательные реакции

Нежелательные реакции классифицированы по органам, системам и по частоте их возникновения (классификация MedDRA): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\ 000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (исходя из имеющихся данных частоту возникновения определить невозможно). *Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:* очень редко - изменения в составе крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, тромбоцитопения).

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

Нарушения со стороны сердца: редко - миокардит, перикардит.

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

Желудочно-кишечные нарушения: редко - боль в области живота, диарея, метеоризм, тошнота, рвота; очень редко - острый панкреатит.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко - дисфункция почек, включая острый и хронический интерстициальный нефрит, и почечную недостаточность; частота неизвестна - нефролитиаз.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко - алопеция; частота неизвестна - синдром Стивенса-Джонсона (ССД), токсический эпидермальный некролиз (ТЭН).

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: очень редко - миалгия, артрит.

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

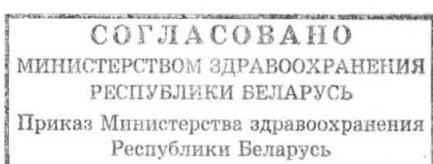
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко - изменения функциональных параметров печени (повышение уровня трансаминаз и параметров холестаза), гепатит, холестатический гепатит.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: очень редко - олигоспермия (обратимая).

Сообщалось о тяжелых кожных нежелательных реакциях (SCAR), включая синдром Стивенса-Джонсона (ССД) и токсический эпидермальный некролиз (ТЭН), в связи с лечением месалазином (см. раздел «Особые указания и меры предосторожности при применении»).

Фоточувствительность

Сообщалось о более тяжелых реакциях у пациентов с такими кожными заболеваниями, как атопический дерматит и атопическая экзема.



Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза-риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Республика Беларусь

220037, Минск, Товарищеский пер., 2а

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

Телефон отдела фармаконадзора: +375 (17) 242-00-29; факс: +375 (17) 242-00-19

Эл. почта: rcpl@rceth.by, rceth@rceth.by

<https://www.rceth.by>

4.9 Передозировка

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

Специфического антидота нет, лечение является симптоматическим и поддерживающим.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Кишечные противовоспалительные препараты. Аминосалициловая кислота и аналогичные препараты. Месалазин; код ATХ: A07EC02.

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Результаты исследований *in vitro* свидетельствуют, что, определенную роль может иметь ингибиция фермента липооксигеназы. Также продемонстрировано воздействие на концентрацию 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.

5.2 Фармакокинетические свойства

Общие свойства месалазина:

Всасывание

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

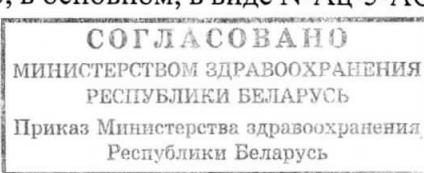
Биотрансформация

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. Ацетилирование месалазина, очевидно, не связано с фенотипом ацетилирования пациента. Часть месалазина также ацетилируется 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 действующего вещества) и желчью (меньшая часть). Почками выводится преимущественно в виде метаболита N-Ац-5-АСК. Около 1 % общей введенной перорально дозы месалазина проникает в грудное молоко, в основном, в виде N-Ац-5-АСК.

Распределение



В сцинтиграфических исследованиях, с меченными изотопом технецием суппозиториями, содержащими месалазин, 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 применения 500 мг месалазина 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 месалазина, около 11 % препарата (в течение 72 ч) выводится с мочой, а после многократного применения около 13 % выводится с мочой. Примерно 10 % препарата выводится вместе с желчью.

5.3 Данные доклинической безопасности

Доклинические данные из исследований фармакологической безопасности, генотоксичности, канцерогенности (у крыс), при репродуктивной токсичности, не выявили какой-либо опасности для человека.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1 Перечень вспомогательных веществ

Месалазол, 250 мг, суппозитории ректальные: твердый жир.

Месалазол, 500 мг, суппозитории ректальные: цетиловый спирт, докузат натрия, твердый жир.

6.2 Несовместимость

Не применимо

6.3 Срок годности (срок хранения)

3 года

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре ниже 25 °C.

6.5 Характер и содержание упаковки

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

По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем в картонной пачке.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним

Нет специальных требований.

6.7 Условия отпуска

По рецепту

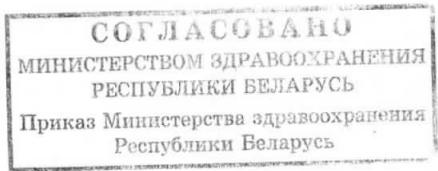
7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ООО «ФАРМАПРИМ»

ул. Кринилор, 5, с. Порумбень, р-он Криулень,

Республика Молдова, MD-4829

тел.: (+373 22) 28-18-45



тел./факс: (+373 22) 28-18-46
e-mail: safety@farmaprim.md

8285 - 2016

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Республика Беларусь, г. Минск, ул. Мележа, дом 5, корпус 2, офис 1105,
тел.: + 375 173 85 26 09

тел. моб: + 375 296641080

e-mail: pavlovich.farmaprim@gmail.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации: 31.03.2006

Дата последнего подтверждения регистрации (перерегистрации):

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата доступна на официальном сайте
<https://www.rceth.by>

