Инструкция по применению
Салофальк таблетки покрытые оболочкой 250мг N100

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Германия
Производитель: Др. Фальк Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Месалазин
Количество в упаковке: 100
Дозировка действующего вещества: 250 мг
Срок годности: 36.0

Действующее вещество

Месалазин

Состав

Месалазин (5-АСК) 250 мг Вспомогательные вещества: натрия карбонат, глицин, повидон, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, кальция стеарат, гипромеллоза, сополимер метакриловой кислоты и метакрилата (1:1), тальк, титана диоксид, краситель железа оксид желтый, макрогол, бутилметакрилат.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

Всасывание и распределение Высвобождение месалазина происходит в терминальном отделе тонкой и толстой кишки. Таблетки начинают растворяться в тонкой кишке через 110-170 мин и полностью растворяются через 165-225 мин после приема. На скорость растворения не влияют изменения pH среды, вызванные приемом пищи или других препаратов. Высвобождение месалазина из гранул начинается с замедлением в 2-3 ч, Cmax в плазме достигается примерно через 4-5 ч. Системная биодоступность месалазина после перорального приема составляет приблизительно 15-25%. Прием пищи замедляем абсорбцию на 1-2 ч, но не изменяет скорость и степень абсорбции. Прием пищи может замедлить транзит препарата на 1-

2 ч, при этом возрастают значения Tlar (разрыв времени после которого содержание месалазина впервые определяется в крови) и Tmax, однако в связи с малым размером гранул это не изменяет скорость и степень абсорбции. Прием пищи вызывает небольшое увеличение значений Cmax и AUC. Общее количество месалазина и N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты (N-Ац-5-АСК), выводимое почками в течение 24 ч, эквивалентно примерно 25-32% соответственно назначенной дозы гранул и таблеток Салофальк. Примерно 30% этого количества всасывается в илеоцекальной зоне, а примерно 90% в целом в илеоцекальной зоне и восходящей толстой кишке. Таким образом, примерно 80-90% 5-АСК назначенной дозы присутствует в нисходящей толстой кишке, сигмовидной и прямой кишках, где скорость их всасывания низка. Значения сывороточной Cmax 5-АСК и Ац-5-АСК в равновесном состоянии были примерно в 1.4 и 1.2 раз выше после при приеме 1 раз/сут в сравнении со значениями, наблюдавшимися при приеме препарата 3 раза/сут в той же суточной дозе. Css в сыворотке на момент окончания периода дозирования при приеме 1 раз/сут была лишь несколько ниже, чем при приеме 3 раза/сут (в 0.3 и 0.4 раза - для 5-АСК и Ац-5-АСК соответственно). При приеме препарата 1 раз/сут признаков системной кумуляции не отмечено. Благодаря размеру гранул (около 1 мм), транзит из желудка до тонкой кишки происходит быстро. Комбинированное фармакосцинтиграфическое и фармакокинетическое исследование показало, что препарат достигает илеоцекального отдела примерно через 3 ч, а восходящего отдела толстой кишки - приблизительно через 4 ч. Общее время транзита по толстой кишке составляет около 20 ч. Примерно 80% от принятой пероральной дозы достигает толстой, сигмовидной и прямой кишки. Связывание с белками плазмы месалазина и N-Ац-5-АСК составляет соответственно 43% и 78% (75-83%). В материнское молоко проникает (в виде метаболита) 0.1% дозы. Метаболизм Месалазин метаболизируется как пресистемным путем в слизистой оболочке кишечника, так и системным путем в печени, превращаясь в фармакологически неактивную N-Ац-5-АСК. Характер ацетилирования не зависит от ацетилирующего фенотипа больного. В небольшой степени ацетилирование может осуществляться за счет действия бактериальной микрофлоры толстой кишки. Выведение При приеме месалазина в дозе 500 мг 3 раза /сут общая элиминация почками месалазина и N-Ац-5-АСК в условиях насыщающей концентрации составила около 25%. Экскреция неметаболизированной части месалазина составила менее 1% от перорально принятой дозы. T1/2 в этом исследовании оказался равным 4.4 ч. Фармакокинетика в особых клинических случаях При однократном пероральном назначении гранул Салофальк в дозе 20 мг/кг 13 детям с активным воспалительным заболеванием толстого кишечника (возраст от 5.9 до 15.8 лет) фармакокинетика системной экспозиции препарата соответствовала

таковой у взрослых. Салофальк был безопасен и хорошо переносился. Данные о фармакокинетике Салофалька у пожилых при его применении, как в таблетках, так и в гранулах отсутствуют.

Показания

Таблетки — неспецифический язвенный колит (НЯК); — болезнь Крона (профилактика, лечение обострений).

Способ применения и дозы

Таблетки Препарат назначают внутрь взрослым по 500 мг 3 раза/сут. При тяжелых формах заболевания доза может быть увеличена до 3-4 г/сут в течение 8-12 недель. Для профилактики рецидивов препарат назначают по 500 мг 3 раза/сут, при необходимости - в течение нескольких лет. Детям с массой тела до 40 кг назначают 1 /2 суточной дозы для взрослых - по 250 мг 3 раза/сут (следует использовать таблетки по 250 мг), детям с массой тела более 40 кг - по 500 мг 3 раза/сут. Для профилактики рецидивов препарат назначают по 250 мг 3 раза/сут, при необходимости - в течение нескольких лет. Таблетки следует принимать целиком, не разжевывая, после еды и запивать большим количеством воды. При дистальных формах НЯК предпочтительно ректальное введение препарата в форме свечей ректальных или суспензии ректальной.

Противопоказания

— заболевания крови; — язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; — геморрагический диатез (со склонностью к кровотечениям); — тяжелая почечная недостаточность; — тяжелая печеночная недостаточность; — дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; — фенилкетонурия (для гранул); — детский возраст до 3 лет (для таблеток); — детский возраст до 6 лет (для гранул); — повышенная чувствительность к компонентам препарата и другим производным салициловой кислоты. С осторожностью следует назначать Салофальк при почечной/печеночной недостаточности легкой и средней тяжести, заболеваниях легких (особенно бронхиальная астма), в I триместре беременности.

Применение при беременности и кормлении грудью

В I триместре беременности назначение препарата возможно только по строгим показаниям. Если позволяет течение заболевания, то в последние 2-4 недели беременности прием препарата следует прекратить. Во II и III триместрах Салофальк следует применять только в тех случаях, когда потенциальная польза терапии для матери превышает возможный риск для плода. Салофальк в форме гранул можно применять в период грудного вскармливания только в тех случаях, если потенциальный эффект его применения для матери превышает возможный риск неблагоприятного действия для ребенка. Если у новорожденного, вскармливаемого грудью, появляется диарея, грудное вскармливание необходимо прекратить. При необходимости назначения Сальфалька в форме таблеток в период лактации грудное вскармливание следует прекратить. Перед запланированной беременностью рекомендуется, по возможности, прекратить лечение Салофальком или применять препарат в уменьшенных дозах.

Побочные действия

Реакции, связанные с повышенной чувствительностью: кожная сыпь, зуд, эритема, лихорадка, бронхоспазм, перикардит, миокардит, острый панкреатит, интерстициальный нефрит, нефротический синдром. Наблюдались отдельные случаи аллергического альвеолита и панколита. При определенных условиях месалазин и препараты, имеющие аналогичную химическую структуру, могут привести к развитию синдрома, сходного с синдромом системной красной волчанки. Со стороны пищеварительной системы: потеря аппетита; редко (меньше 1/1000, но > 1/10 000) - диарея, тошнота, боли в животе, метеоризм, рвота; очень редко (меньше 1/10 000) - сильная боль в животе вследствие панкреатита, сильная диарея и боль в животе из-за аллергического воспаления кишечника, желтуха и боли в животе вследствие нарушения желчеотделения, повышение уровня печеночных ферментов в крови, гепатит. Со стороны нервной системы: редко (1/10 000) - головная боль, головокружение; очень редко (меньше 1/10 000) - периферическая невропатия; возможно - депрессия, нарушения сна, недомогание, парестезии, судороги, тремор, шум в ушах. Со стороны сердечно-сосудистой системы: возможно - тахикардия, артериальная гипертензия или гипотензия; очень редко (меньше 1/10 000) - боли за грудиной, одышка. Со стороны костно-мышечной системы: очень редко (меньше 1/10 000) - миалгии, артралгии. Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях - анемия, лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения. Со стороны свертывающей системы крови: в отдельных случаях - гипопротромбинемия. Со стороны мочевыделительной системы: в отдельных случаях - протеинурия, гематурия, кристаллурия, олигурия, анурия. Прочие: в отдельных случаях - уменьшение продукции слезной жидкости; очень редко (меньше 1/10 000) - алопеция, лихорадка, ангина, реверсивное уменьшение подвижности сперматозоидов. С учетом химической структуры активного вещества нельзя исключить возможности повышения уровня метгемоглобина. При возникновении острых признаков непереносимости лечение необходимо немедленно прекратить.

Передозировка

Симптомы: тошнота, рвота, гастралгия, слабость, сонливость. Лечение: промывание желудка, назначение слабительных, симптоматическая терапия. В случаях передозировки при необходимости проводится инфузия растворов электролитов (форсированный диурез).

Взаимодействие с другими препаратами

При одновременном применении Салофальк вызывает усиление действия антикоагулянтов непрямого действия (возрастание риска желудочно-кишечных кровотечений). При одновременном применении ГКС с Салофальком возможно усиление нежелательных реакций со стороны слизистой оболочки желудка. При одновременном применении Салофальк повышает токсичность метотрексата. При одновременном применении пробенецида и сульфинпиразона с Салофальком возможно уменьшение выведения мочевой кислоты. При одновременном применении Салофальк уменьшает диуретический эффект спиронолактона и фуросемида. При одновременном применении с Салофальком возможно ослабление туберкулостатического действия рифампицина. При одновременном применении Салофальк усиливает гипогликемическое действие производных сульфонилмочевины. При одновременном применении с лактулозой или другими препаратами, снижающими pH кишечного содержимого, возможно уменьшение освобождения месалазина из гранул вследствие снижения pH, обусловленного метаболизмом бактерий. У пациентов, которые одновременно получают лечение азатиоприном или 6-меркаптопурином, следует помнить о возможном усилении миелосупрессивного эффекта азатиоприна и 6-меркаптопурина.

Особые указания

Перед началом лечения, во время, а также после лечения необходимо проведение общего анализа крови и мочи. Перед началом лечения и в процессе его проведения необходимо определять параметры функционального состояния печени (такие как активность АЛТ или АСТ) и контролировать анализы мочи (с помощью погружения тест-полосок). Проведение контроля рекомендуется обычно через 14 дней после начала лечения, затем еще 2-3 раза с интервалом в 4 недели. Если результаты анализов оказываются нормальными, контрольные исследования следует проводить каждые 3 месяца. Если отмечается появление дополнительных симптомов, контрольные исследования необходимо выполнять немедленно. С осторожностью применять у пациентов с нарушением функции печени. Назначение Салофалька не рекомендуется пациентам с выраженными нарушениями функции почек. Если нарушение функции почек развилось во время лечения, следует думать о нефротоксическом действии месалазина. В период лечения следует контролировать функцию почек. При назначении Салофалька пациентам с заболеваниями легких, в частности, бронхиальной астмой, необходимо осуществлять тщательный контроль в процессе лечения. Больные с указанием в анамнезе указания на побочные реакции при назначении препаратов, содержащих сульфасалазин, подлежат тщательному наблюдению в начальный период лечения Салофальком. Если на фоне лечения Салофальком возникают реакции острой непереносимости, такие как судороги, острые боли в животе, лихорадка, выраженная головная боль и сыпь, применение препарата необходимо немедленно прекратить. Больные, являющиеся "медленными ацетиляторами", имеют повышенный риск развития побочных эффектов. Может наблюдаться окрашивание мочи и слезы в желто-оранжевый цвет, прокрашивание мягких контактных линз. Если пропущен прием нескольких доз, то, не прекращая лечения, пациент должен обратиться к врачу. При назначении препарата пациентам, страдающим фенилкетонурией, следует помнить, что Салофальк в гранулах содержит аспартам в дозах, эквивалентных следующему количеству фенилаланина: 0.56 мг (Салофальк гранулы 500 мг), 1.12 мг (Салофальк гранулы 1 г). Использование в педиатрии Салофальк в гранулах не должен назначаться детям моложе 6 лет, поскольку опыт применения препарата у больных этой возрастной группы очень ограничен. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами Следует соблюдать осторожность при управлении транспортным средством и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторной реакции.

Условия хранения

В сухом месте