

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВООПАЗЕНИЕТО	
Приложение към Разрешение за употреба № 11-5247/14.05.02г.	
018/05.03.02	<i>[Signature]</i>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРЕПАРАТ SALOFALK ®250mg

Стомашно-устойчиви (ентеросолвентни таблетки)
Активна съставка : месалазин .

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

2.1. Химична и фармакологична група: за употреба при възпалителни чревни заболявания (противовъзпалителен чревен агент).

2.2. Активна съставка : една стомашно-устойчива таблетка съдържа 250mg месалазин(5-аминосалицилова киселина)

2.3. Други съставки : евдрагит L-дibuтилфталат, талк, глицин, поливинил пиролidon, натриев карбонат, калциев стеарат, микрокристална целулоза, колоидален силиций, хидроксипропил метилцелулоза, евдрагит E, макрогол 6000, оцветителни агенти : титанов диоксид (E171) и жълт железен оксид (E172) .

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви ентеросолвентни таблетки.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ТЕРАПЕВТИЧНИ ПОКАЗАНИЯ

- Улцерозен колит-както за лечение на острия пристъп, така и за профилактика на рецидивите.
- Болест на Crohn-за лечение на острия пристъп.

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА ПРИЛОЖЕНИЕ

Както Salofalk ®250mg , така и Salofalk® 500mg са подходящи за лечение на хронични възпалителни чревни заболявания като болестта на Crohn и улцерозния колит.

При предписана доза 1.5mg месалазин дневно се приемат 3 пъти дневно по 2 таблетки Salofalk® 250mg . При дозировка повече от 1.5mg месалазин дневно трябва да се вземат по възможност Salofalk ®500mg неколккратно дневно. В зависимост от клиничните изисквания в отделния случай се препоръчват следните дозировки : дневна дозировка на месалазин при болест на Crohn и улцерозен колит.

остър епизод/ ремисия/ дългосрочно лечение
1.5g - 4.5g / 1.5 - 3-0g / 1.5g



В редки случаи при болни, които са претърпяли тънкочревна резекция или операция на дебелото черво с отстраняване на илеоцекалната валвула поради ексцесивно бързия чревен пасаж може да се изхвърлят с изпражненията неразтворени таблетки Salofalk® 250mg.

Таблетите Salofalk® 250mg трябва да се поглъщат цели с голямо количество вода 1 час преди хранене сутрин, на обяд и вечер.

Острият пристъп на улцерозен колит или болестта на Crohn, обикновено продължава 8 до 12 седмици. Едно по-продължително лечение от този срок с високи дози няма предимства.

Желаният лечебен ефект от приемането на Salofalk® таблетки се постига, ако същите се приемат не само по време на острия възпалителен стадий, но също като продължително лечение.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Salofalk® 250mg таблетки не трябва да се предписват при:

- Предшестваща свръхчувствителност към салицилова киселина и ацетизал или някоя друга съставка.
- Тежко нарушена чернодробна или бъбречна функция.
- Активна стомашна или дуоденална язва.

Salofalk® 250mg не трябва да се използва за лечение на кърмачета и малки деца, тъй като опитът в тази възрастова група е недостатъчен.

4.4. ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И ПРЕДПАЗНИ МЕРКИ.

Salofalk® 250mg (месалазин) трябва да се приема под лекарски контрол. Кръвта и урината да се изследват по преценка на лекуващия лекар. Препоръчва се изследванията да се извършат 14 дни след началото на лечението, а след това 2-3 пъти през 4 седмични интервали. Ако находката е нормална са достатъчни контролни изследвания веднъж в тримесечие.

При поява на допълнителни болестни симптоми, трябва да се извърши незабавно контролно изследване.

За преценка на бъбречната функция се препоръчва изследване на уреята и креатинина в серума и на седимента в урината.

Съществува възможност за повишаване нивото на метхемоглобина в кръвта.

Болните с нарушена белодробна функция и в частност тези с астма изискват следене от близо по време на лечение със Salofalk® (месалазин).

Болните с установена свръхчувствителност към сулфасалазин-съдържащи лекарства, трябва да започнат лечението със Salofalk® (месалазин) само под непосредствено лекарско наблюдение. В случай на поява на симптоми на остра непоносимост като: спазми, остра коремна болка, втрисане, силно главоболие и кожен обрив, лечението трябва да спре незабавно!

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ФОРМИ НА ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ.

Такива взаимодействия може да се срещнат при паралелно лечение със Salofalk® (месалазин) таблетки и следните лекарствени продукти:

- Антикоагуланти: Възможно засилване на противосъсирващия ефект (повишен риск от кървене в стомашно-чревния тракт).



-Глюкокортикоиди: Възможно засилване на нежеланите реакции от стомаха .
-Сулфанилуреини: Възможно засилване на хипогликемичния ефект.
-Methotrexat: Възможно засилване на токсичното му действие.
-Probenecid : Възможно отслабване на урикозо-Sulfinperazone уричния му ефект
-Спиринолактон: Възможно отслабване на диуретичното му действие.
-Рифампицин : Възможно отслабване на туберкулоостатичния му ефект.
В един случай при болен който е приемал месалазин едновременно с азатиоприн и б-меркаптопурин е наблюдавана панцитопения..

4.6.БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Месалазин не трябва да се използва през първите три месеца на бременността, освен при стриктни показания.

Жените , които желаят да забременеят би трябвало да изчакат периода ,когато ще е необходима възможно най-малка доза или няма да се налага лечение. Ако състоянието на заболяването позволява, лечението би могло да прекъсне през последните 2-4 месеца на бременността.

За сега опитът за лечение с месалазин по време на кърмене е недостатъчен. Ако лечението през този период е наложително, кърмачето трябва да се отбие, още повече експерименталните данни показват ,че малки количества месалазин преминават в кърмата.

4.7.ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Такива не се съобщават.

4.8.ВЪЗМОЖНИ НЕЖЕЛАНИ РЕАКЦИИ

*Стомашно-чревни нежелани реакции

Рядко се съобщава за коремна дискомфорт, диария, флатуленция, гадене и повръщане.

*Нежелани реакции засягащи централната нервна система

Реакции от ЦНС като главоболие и замаяване са наблюдавани рядко при лечение с месалазин.

*Нежелани реакции от бъбреците

Нарушена бъбречна функция и бъбречна недостатъчност при остър и хроничен интерстициален нефрит се наблюдават рядко по време на лечение с месалазин-съдържащи лекарства.

*Реакции на свръхчувствителност

Срещат се реакции на свръхчувствителност, които не са дозозависими и са общи за салициловата киселина и нейните производни (ацетизал) като: алергичен екзантем, лекарствена треска, бронхоспазм, перикардит, миокардит и остър панкреатит. Съобщават се също изолирани случаи на алергичен алвеолит. Понякога се среща панколит. Има съобщения и за лекарствено-предизвикан лупус еритематодес-подобен синдром с пеперудообразен обрив на лицето от продукти със сходна химическа структура на месалазина.



***Други нежелани реакции**

Миалгия и артралгия са наблюдавани рядко.

Повишеното ниво на метхемоглобин се свързва с химическата структура на активното вещество.

Вотделни случаи се съобщава за промени в кръвната картина след употреба на месалазин-съдържащи лекарства като: апластична анемия, агранулоцитоза, панцитопения, неутропения, левкопения и тромбоцитопения.

Има единични съобщения за медикаментозен хепатит и в редки случаи се срещат промени във функционалните проби (повишени трансаминази).

В единични случаи се среща алоpecia и опадане на косата

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

Досега не са известни съобщения за отравяне с препарата, нито за специфични антидоти. При случаи на предозирание е показана венозна инфузия с електролити за стимулиране на диурезата.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

Точният механизъм на противовъзпалителното действие на Salofalk® (месалазин) не е известен. Опитите *in vitro* дават основания да се предположи, че инхибирането на липооксигеназата играе роля. Демонстриран е също аналогичен ефект върху съдържанието на простагландини в червната лигавица.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Главното място на действие на месалазина е възпалената лигавица в терминалния илеум и колона. Резултат на специалната формула на таблетите Salofalk® месалазина не се освобождава докато не достигне илеоцекалната зона. Там активната субстанция се абсорбира на малко протежение и се елиминира от бъбрека в ацетилирана форма. Една малка част около 5% от абсорбираното количество се елиминира с жлъчката. Месалазинът се намира във фекалиите отчасти в непроменена, отчасти в ацетилирана форма. Времето на полуелиминиране варира от 0.7 до 2.4 часа (средно 1.4 (0.6 часа). Месалазинът се свързва с плазмените белтъци в 43%, а ацетилираният месалазин в 78%. Бързото ацетилиране е необратимо и за разлика от сулфапиридина, болните не могат да бъдат разделени на бавни и бързи ацетилатори.

Бионаличност

Средните устойчиви плазмени концентрации на месалазин и ацетилиран месалазин от Salofalk® 250mg таблетки при болестта на Crohn са 0.4 (0.4 и 1.2) 0.3 мкг/мл съответно. Количеството ацетилиран месалазин, което се отделя с урината след приемане на Salofalk® 250mg таблетки, представлява 44 процента от приетото количество

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ



***Токсикологични свойства а/**

остра токсичност

LD 50 след орално и интравенозно предписване варира от 1000 до 5000 mg/kg телесна маса в зависимост от вида на опитните животни.

LD 50(летална доза 50) е тази доза която предизвиква смърт при 50% от третираните животни.

б/хронична токсичност

Патологичните промени, наблюдавани при опити с животни след много високи дози месалазин като: некроза на бъбречните папили, увреждане на проксималния тубул или на целия нефрон са аналогични на промените при токсикологични проучвания със салицилати(ацетизал).

По-нататъшните проучвания намират,че след предписване на лечебни дози месалазин не се наблюдава локално дразнене, сензибилизиране или влошаване на жизнените функции. Нарушена бъбречна функция се среща само при високи дози.

***Туморогенен и мутагенен потенциал**

Дългосрочните проучвания върху плъхове не намират туморогенен потенциал. Пространните in vitro и in vivo изпитвания не откриват доказателства за мутагенност на месалазина.

***Репродуктивна токсичност**

Месалазинът няма ембриотоксични, фетотоксични или тератогенни ефекти при проучвания върху животни и няма увреждащ ефект върху фертилитета,репродукцията, гестационния период раждането, преживяемостта,размера или поведението на потомството.

6.ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1.ПОМОЩНИ ВЕЩЕСТВА:

Еудрагит L, дибутилфталат,талк, глицин, поливинил пиролidon, натриев карбонат, калциев стеарат,микрокристална целулоза,колоидален силиций, хидроксипропил метилцелулоза, еудрагит E, макрогол 6000,оцветяващи агенти : титанов диоксид (E 171),жълт железен окис (E 172).

6.2.НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

До сега такива не са известни.

6.3.СРОК НА ГОДНОСТ

*Три години.

6.4.СПЕЦИАЛНИ УСЛОВИЯ ЗА СЪХРАНЕНИЕ

*Няма такива.

6.5.ВИД И СЪДЪРЖАНИЕ НА ОПАКОВКАТА

Стандартна опаковка с 100 таблетки



6.6.ИНСТРУКЦИИ ЗА УПОТРЕБА НА ПРОДУКТА

-Няма специални указания за работа с лекарствения продукт.Начинът на употреба е посочен в 4.2.

7.ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА РЕГИСТРАЦИЯ

Dr.FALK PHARMA GmbH
Leinenweberstr.5 Postfach 6529 D-
79041 Freiburg Tel (07 61) 1514-0
Fax(0761) 1514-321
Reg.No.2881.00.01

8.НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА РЕГИСТРАЦИЯ

№ 9600114/23.05.1996 г.

9.ПОДНОВЯВАНЕ НА РЕГИСТРАЦИЯТА

10.ДАТА НА ПРЕРАБОТВАНЕ НА ТЕКСТА

Февруари 2000

