



## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАСТВЕНИЯ ПРЕПАРАТ SALOFALK® 500 mg

Стомашно-устойчиви (ентеросолвентни таблетки)

Активна съставка : месалазин .

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

2.1. Активна съставка : една стомашно-устойчива таблетка  
съдържа 500 mg месалазин(5-аминосалицилова киселина)

2.2. Други съставки : евдрагит L-дибутилфталат, талк, глицин, поливинил пирилонидон, натриев карбонат, калциев стеарат, микрокристална целулоза, колоидален силиций, хидроксипропил метилцелулоза, евдрагит E, макрогол 6000, оцветителни агенти : титанов диоксид (E 171) и жълт железен оксид (E172) .

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви ентеросолвентни таблетки.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. ТЕРАПЕВТИЧНИ ПОКАЗАНИЯ

- Лечение на острия пристъп и профилактика на рецидивите на улцерозния колит.
- Лечение на острия пристъп от болест на Crohn.

#### 4.2. ДОЗИРОВКА С ЕДНОКРАТНА И ОБЩА ДНЕВНА ДОЗА

-За лечение на остри пристъпи от болестта на Crohn

В зависимост от клиничните нужди на отделния пациент 1 до 2 таблетки Salofalk® 500mg три пъти дневно (еквивалентни на 1.5g - 4.5 g месалазин дневно).

-При остър пристъп от улцерозен колит

В зависимост от клиничните нужди на отделния болен 1 до 2 таблетки Salofalk® 500mg три пъти дневно (еквивалентни на 1.5-3g месалазин дневно).

-За предотвратяване на рецидиви от улцерозен колит

1 таблетка Salofalk® 500mg три пъти дневно (еквивалентни на 1.5g месалазин дневно).

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® 500mg.

Таблетите Salofalk® 500mg трябва да се поглъщат цели с голямо количество вода 1 час преди хранене сутрин, на обяд и вечер.



Желаният лечебен ефект от приемането на Salofalk ®500mg таблетки се постига ако същите се приемат редовно не само по време на острия възпалителен стадий , но също като продължително лечение.

#### 4.3.ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Salofalk ®500mg таблетки не трябва да се предписват при:

-Предшестваща свърхчувствителност към салицилова киселина и ацетизал или някоя друга съставка .

- Тежко нарушена чернодробна или бъбречна функция.

- Активна стомашна или дуоденална язва.

Salofalk ®500mg 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 ®500mg (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 отблизо по време на лечение със Salofalk ®(месалазин).

Болните с установена свърхчувствителност 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)таблети 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.

-Probenesid : Възможно отслабване на урикозо-Sulfipregazone уричният 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 че 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 коремен 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.

В отделни 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 в чернодробните функционални 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

**Фармакотерапевтична група:**

За употреба при възпалителни чревни заболявания  
(противовъзпалителен агент/чревен агент)

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 чревната лигавица.

#### 5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Достъпните изследвания с ниски дози Salofalk® показват следното: Благодарение на специфичната формула на стомашно-устойчивото покритие на таблетите, месалазинът не се освобождава докато не достигне илео-цекалната зона. Средната постоянна серумна концентрация е 0.7 мкг/мл. Бионаличността е 44%.

Главният метаболит е N-ацетил-5-аминосалицилат.

##### Бионаличност

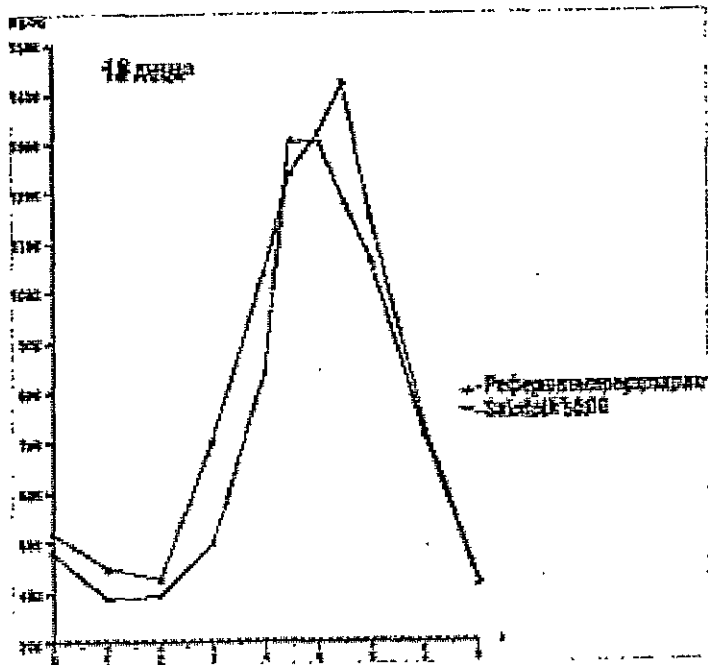
Едно проучване на бионаличността извършено през 1998 върху 18 лица с постоянна серумна концентрация (5 и 6 ден от лечението) дава следните резултати сравнени с референтния препарат: Виж таблицата.

Средните стойности на плазменото ниво на продукта са сравнени с тези на референтния препарат, като на ординатата се отчитат промените в концентрацията, а на абсцисата-времето (виж фигурата).

	Salofalk® 500mg 3 x 1 табл. дневно	Salofalk® 250mg 3x 2 табл. дневно
Пикова плазмена концентрация- $C_{max}$ (ng/ml)	1668.8±1145.7	1756.8±1145.2
Време на пикова плазмена концентрация- $t_{max}$ (h)	4.9±0.7	4.8±0.8
Площ под кривата концентрация-време(AUC)	5869.1±4112.6	6092.1±3996.1

Стойностите са посочени като средна (стандартно отклонение)





### 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 (ацетисал).

По-нататъшните проучвания намират, че след предписване на лечебни дози месалазин не се наблюдават 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 пирилон, натриев карбонат, калциев стеарат, микрокристална целулоза, колоиден силиций дидроксипропил 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 50 и 100 таблетки

### **6.6. ИНСТРУЦИИ 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(07 61) 1514-  
321 Reg.No.2881.00.01

## **8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА РЕГИСТРАЦИЯ**

9600067/16.04.1996 г.

## **9. ПОДНОВЯВАНЕ НА РЕГИСТРАЦИЯТА**

## **10. ДАТА НА ПРЕРАБОТВАНЕ НА ТЕКСТА**

Февруари 2000

