

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ  
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА  
**САЛОФАЛЬК**

**Регистрационный номер:** ЛП-000833

**Торговое наименование:** САЛОФАЛЬК

**Международное непатентованное или группировочное наименование:**  
месалазин

**Лекарственная форма:** пена ректальная дозированная

**СОСТАВ:**

1 аппликация содержит:

*Действующее вещество:* месалазин 1 г.

*Вспомогательные вещества:* пропиленгликоль, натрия дисульфит, полисорбат 60, динатрия эдетат, цетостеариловый спирт, пропелленты (пропан/изобутан/бутан под давлением около 2,5 бар).

**ОПИСАНИЕ**

Пена ректальная. Кремообразная стойкая пена от серовато-белого до слегка красновато-фиолетового цвета.

**ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА**

Противовоспалительное кишечное средство

**Код АТХ:** A07EC02

**ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

*Фармакодинамика*

Механизм действия

Механизм противовоспалительного действия неизвестен. Результаты исследований *in vitro* свидетельствуют, что определенную роль может играть ингибирование липооксигеназы. Показано влияние на концентрацию простагландинов в слизистой оболочке кишечника. Месалазин (5-аминосалициловая кислота/5-АСК) может также выполнять функцию поглотителя свободных радикалов (активных форм кислорода).

После попадания в просвет кишки ректально введенный месалазин оказывает преимущественно местное действие на слизистую оболочку кишечника и подслизистую ткань. Поэтому показатели системной биодоступности и концентрации месалазина в плазме не важны в плане его терапевтической эффективности, а служат, скорее, факторами оценки его безопасности.

### **Фармакокинетика**

#### **Распределение**

Комбинированное фармакосцинтиграфическое/ фармакокинетическое исследование показало, что лекарственный препарат Салофальк пена ректальная распределяется равномерно, быстро и почти полностью в течение 1 часа. Он достигает ректальной области пищеварительного тракта, сигмовидной ободочной кишки и левой стороны толстой кишки в зависимости от степени воспаления.

#### **Абсорбция**

Месалазин быстро всасывается, пиковые концентрации месалазина и его метаболита N-Ац-5-АСК в плазме достигаются примерно через 4 часа. Однако плазменные концентрации после ректального введения дозы 2 г месалазина в виде пены практически сопоставимы с таковыми после приема внутрь 250 мг месалазина, достигая максимальных концентраций около 0,4 мкг/мл. Пресистемный метаболизм происходит быстро и N-Ац-5-АСК, подобно месалазину, также достигает своей максимальной плазменной концентрации примерно через 4 часа, однако его плазменные концентрации почти в 4–5 раз выше, около 2 мкг/мл.



## **ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ**

Обострение дистальных форм язвенного колита средней и легкой степени тяжести; поддержание ремиссии язвенного колита.

## **ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ**

Повышенная чувствительность к месалазину, салициловой кислоте и ее производным или другим компонентам препарата, тяжелые нарушения функции печени или почек, детский возраст до 18 лет.

## **С ОСТОРОЖНОСТЬЮ**

Заболевания легких, в т.ч. бронхиальная астма, так как сульфит, содержащийся в ректальной пене, может вызвать реакции гиперчувствительности.

## **ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ**

### *Беременность*

Достаточных данных о применении месалазина у беременных нет. Ограниченные данные о применении месалазина перорально во время беременности не свидетельствуют о повышении риска врожденных пороков развития. Месалазин проникает через плацентарный барьер, но концентрация вещества у плода значительно ниже, чем у взрослых при применении в терапевтических дозах. Исследования на животных не выявили неблагоприятного действия месалазина на течение беременности, развития эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие потомства. Месалазин следует применять во время беременности, только если возможная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

### *Грудное вскармливание*

Клинические данные о применении препарата у кормящих женщин ограничены. Экспериментальные исследования на животных свидетельствуют о том, что месалазин и его метаболит при пероральном применении в высоких дозах экскретируются в грудное молоко. У детей, получающих грудное

вскармливание, были описаны случаи спорадической диареи. Риск для ребенка полностью не исключен. Вопрос о целесообразности применения препарата в период грудного вскармливания должен решаться индивидуально после консультации врача, если потенциальная польза для матери превосходит возможный риск для ребенка. При необходимости следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

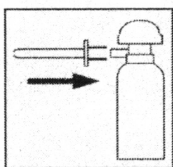
## **СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ**

Препарат применяется ректально, т. е. должен вводиться через анальный проход. Он *не предназначен для приема внутрь через рот*. Не проглатывать.

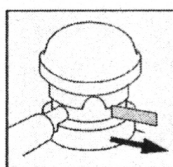
### **Взрослые**

Препарат Салофальк пена ректальная обычно применяется один раз в день перед сном. Если трудно удержать такой объем пены в кишке, препарат можно вводить в два этапа: один раз на ночь, и еще один раз – ночью либо рано утром (после дефекации). Для достижения наилучшего результата рекомендуется введение препарата после опорожнения кишечника (дефекации).

### **Подготовка препарата для применения**

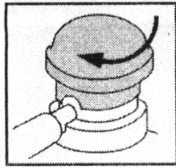


Хранить и вводить препарат Салофальк пена ректальная при комнатной температуре (между 20°C и не выше 30°C). Плотнo установить аппликатор на головку баллона. Встряхивать баллон в течение 20 секунд для перемешивания его содержимого.



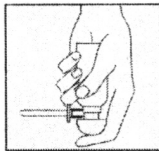
При первом использовании: удалить защитный язычок с основания дозирующей головки.



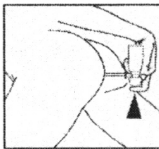


Повернуть колпачок, чтобы полукруглый вырез на предохранительном кольце оказался на одной линии с насадкой. Баллон готов к применению.

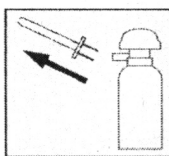
### **До и после применения препарата**



Поместить указательный палец на колпачок и перевернуть баллон вверх дном. Обратите внимание, что пена будет правильно распыляться только при удерживании баллона в перевернутом виде.



Ввести аппликатор в прямую кишку как можно глубже. Лучше всего при этом поставить ногу на стул или табурет. Для того, чтобы ввести первую часть дозы/аппликацию препарата, нажать на колпачок до упора и медленно отпустить. Чтобы ввести вторую часть дозы/ аппликацию препарата, снова нажать на колпачок и медленно отпустить. Подождать 10-15 секунд, затем медленно извлечь аппликатор из прямой кишки, поскольку пена в незначительном количестве еще выделяется в процессе расширения и в противном случае может капать из аппликатора.



После введения пены, удалить аппликатор и выбросить его, упаковав в пластиковый пакет. Для каждого нового введения дозы препарата следует использовать новый аппликатор.

- После процедуры вымыть руки. Постарайтесь не опорожнять кишечник до следующего утра.
- Если Вы поступаете в больницу или консультируетесь с другими врачами, сообщите им о том, что пользуетесь этим препаратом.

Терапевтический эффект достигается при регулярном применении препарата Салофальк пена ректальная.

### **Продолжительность курса лечения**

Продолжительность курса лечения зависит от характера, степени тяжести и развития заболевания и подбирается врачом индивидуально. Как правило, обострение легких форм язвенного колита может быть купировано в течение 4 – 6 недель. По истечении этого срока рекомендуется посетить лечащего врача для решения вопроса о назначении пероральной формы месалазина для поддерживающей терапии.

Если Вы считаете, что эффект препарата Салофальк пена ректальная слишком сильный или слишком слабый, сообщите об этом лечащему врачу.

Если после лечения улучшения не наступает или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом. Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции. В случае необходимости, пожалуйста, проконсультируйтесь с врачом.

### **ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ**

При применении месалазина наблюдались следующие побочные эффекты, систематизированные по системе органов и частоте встречаемости.

| Органы и системы                                       | Частота в соответствии с классификацией MedDRA |                                                                            |                                            |                             |                                                                  |
|--------------------------------------------------------|------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------|-----------------------------|------------------------------------------------------------------|
|                                                        | Часто<br>( $\geq 1/100$ ,<br>< 1/10)           | Нечасто<br>( $\geq 1/1000$ ,<br>< 1/100)                                   | Редко<br>( $\geq 1/10\ 000$ ,<br>< 1/1000) | Очень редко<br>(< 1/10 000) | Неизвестный<br>(невозможно<br>оценить по<br>имеющимся<br>данным) |
| Осложнения общего характера и реакции в месте введения | Вздутие живота                                 | Дискомфорт в области анального отверстия;<br>раздражение в месте введения, |                                            |                             |                                                                  |



| Органы и системы                                                               | Частота в соответствии с классификацией MedDRA |                                          |                                            |                                                                                                                                                                 |                                                                  |
|--------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------|------------------------------------------|--------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------|
|                                                                                | Часто<br>( $\geq 1/100$ ,<br>< 1/10)           | Нечасто<br>( $\geq 1/1000$ ,<br>< 1/100) | Редко<br>( $\geq 1/10\ 000$ ,<br>< 1/1000) | Очень редко<br>(< 1/10 000)                                                                                                                                     | Неизвестный<br>(невозможно<br>оценить по<br>имеющимся<br>данным) |
|                                                                                |                                                | болезненный<br>позыв на<br>дефекацию     |                                            |                                                                                                                                                                 |                                                                  |
| Нарушения со стороны крови и лимфатической системы                             |                                                |                                          |                                            | Изменения картины крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)                                           |                                                                  |
| Нарушения со стороны нервной системы                                           |                                                |                                          | Головная боль, головокружение              | Периферическая нейропатия                                                                                                                                       |                                                                  |
| Нарушения со стороны сердца                                                    |                                                |                                          | Миокардит<br>перикардит                    |                                                                                                                                                                 |                                                                  |
| Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения |                                                |                                          |                                            | Аллергические и фиброзные реакции со стороны легких (в том числе одышка, кашель, бронхоспазм, альвеолит, легочная эозинофилия, инфильтраты в легких, пневмонит) |                                                                  |

| Органы и системы                                 | Частота в соответствии с классификацией MedDRA |                                          |                                                                 |                                                                                                          |                                                                                                                                                     |
|--------------------------------------------------|------------------------------------------------|------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                  | Часто<br>( $\geq 1/100$ ,<br>< 1/10)           | Нечасто<br>( $\geq 1/1000$ ,<br>< 1/100) | Редко<br>( $\geq 1/10\ 000$ ,<br>< 1/1000)                      | Очень редко<br>(< 1/10 000)                                                                              | Неизвестный<br>(невозможно<br>оценить по<br>имеющимся<br>данным)                                                                                    |
| Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта  |                                                |                                          | Боль в области живота, диарея, метеоризм, тошнота, рвота        | Острый панкреатит                                                                                        |                                                                                                                                                     |
| Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей |                                                |                                          |                                                                 | Нарушение функции почек, включая острый и хронический интерстициальный нефрит и почечную недостаточность | Нефролитиаз*                                                                                                                                        |
| Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей     | Сыпь, зуд                                      |                                          | Фоточувствительность (повышенная чувствительность кожи к свету) | Алоpecia                                                                                                 | Лекарственная реакция с эозинофилией и системными проявлениями (DRESS), Синдром Стивенса - Джонсона (ССД), токсический эпидермальный некролиз (ТЭН) |
| Нарушения со стороны опорно-                     |                                                |                                          |                                                                 | Миалгия, артралгия                                                                                       |                                                                                                                                                     |



| Органы и системы                                   | Частота в соответствии с классификацией MedDRA |                                          |                                            |                                                                                                                                  |                                                                  |
|----------------------------------------------------|------------------------------------------------|------------------------------------------|--------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------|
|                                                    | Часто<br>( $\geq 1/100$ ,<br>< 1/10)           | Нечасто<br>( $\geq 1/1000$ ,<br>< 1/100) | Редко<br>( $\geq 1/10\ 000$ ,<br>< 1/1000) | Очень редко<br>(< 1/10 000)                                                                                                      | Неизвестный<br>(невозможно<br>оценить по<br>имеющимся<br>данным) |
| двигательной системы                               |                                                |                                          |                                            |                                                                                                                                  |                                                                  |
| Нарушения со стороны иммунной системы              |                                                |                                          |                                            | Реакции гиперчувствительности, такие как аллергическая экзантема, лекарственная лихорадка, волчаночно-подобный синдром, панколит |                                                                  |
| Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей |                                                |                                          |                                            | Изменения функции печени (повышение активности трансаминаз и показателей холестаза), гепатит, холестатически й гепатит           |                                                                  |
| Нарушения со стороны репродуктивной системы        |                                                |                                          |                                            | Олигоспермия (обратимая)                                                                                                         |                                                                  |

\* см. раздел ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ для получения дополнительной информации

Сообщалось о появлении тяжелых кожных нежелательных реакций (ТКНР), включая лекарственную реакцию с эозинофилией и системными проявлениями

(DRESS), синдром Стивенса - Джонсона (ССД) и токсический эпидермальный некролиз (ТЭН), в связи с лечением месалазином (см. раздел ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ).

#### Фоточувствительность (повышенная чувствительность кожи к свету)

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

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

### **ПЕРЕДОЗИРОВКА**

При применении препарата Салофальк пена ректальная в соответствии с инструкцией по применению, передозировка маловероятна. Описаны случаи передозировки при пероральном применении месалазина в высоких дозах. Специфического антидота нет. Лечение: симптоматическая терапия.

### **ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ**

Исследований взаимодействия месалазина при ректальном введении с другими препаратами не проводилось.

У пациентов, которые одновременно получают лечение азатиоприном, меркаптопурином, либо тиогуанином, следует помнить о возможном усилении миелосупрессивного эффекта азатиоприна и меркаптопурина, либо тиогуанина. Применение месалазина вместе с антикоагулянтами, например, варфарином, может снижать антикоагулянтный эффект последнего.

### **ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ**

Перед началом лечения и во время лечения по усмотрению лечащего врача необходимо проводить анализы крови (лейкоцитарная формула, параметры функционального состояния печени, такие как АЛТ (аланинаминотрансфераза) или АСТ (аспартатаминотрансфераза), креатинин сыворотки). Проведение



контроля рекомендуется обычно через 14 дней после начала лечения, затем еще 2–3 раза с интервалом в 4 недели.

Если результаты анализов нормальные, контрольные исследования следует проводить каждые 3 месяца. Если отмечается появление дополнительных симптомов, контрольные исследования необходимо выполнять немедленно.

Рекомендуется соблюдать осторожность у пациентов с нарушением функции печени.

Месалазин не следует применять у пациентов с нарушением функции почек.

При ухудшении функции почек во время лечения следует думать о возможном нефротоксическом действии месалазина. В этом случае применение ректальной пены Салофалька следует немедленно прекратить.

Сообщалось о случаях нефролитиаза с использованием месалазина, включая камни со 100% содержанием месалазина. Рекомендуется обеспечить достаточное потребление жидкости во время лечения.

Месалазин может вызывать окрашивание мочи в красно-коричневый цвет при контакте с чистящим средством, содержащим гипохлорит натрия (например, в туалетах, обработанных гипохлоритом натрия, содержащимся в некоторых отбеливающих средствах).

Очень редко сообщалось о серьезных нарушениях свертываемости крови при применении месалазина. Гематологические исследования следует проводить, если пациенты отмечают необъяснимые кровотечения, кровоподтеки, пурпура, анемия, лихорадка или боли в горле. Ректальную пену Салофалька следует отменить в случае подозрения или подтверждения патологического изменения крови.

Редко сообщалось о реакциях гиперчувствительности со стороны сердца (миокардит и перикардит), вызванных месалазином. Применение ректальной пены Салофалька следует немедленно прекратить



В процессе лечения препаратом Салофальк пена ректальная следует внимательно следить за состоянием пациентов с заболеваниями легких, в частности с бронхиальной астмой.

#### Тяжелые кожные нежелательные реакции

Сообщалось о появлении тяжелых кожных нежелательных реакций (ТКНР), включая лекарственную реакцию с эозинофилией и системными проявлениями (DRESS), синдром Стивенса - Джонсона (ССД) и токсический эпидермальный некролиз (ТЭН), в связи с лечением месалазином. Следует отменить прием месалазина при первом появлении признаков и симптомов тяжелых кожных реакций, например, кожной сыпи, повреждений слизистых оболочек или любых других признаков гиперчувствительности.

Пациенты с анамнезом нежелательных реакций на препараты, содержащие сульфасалазин, подлежат тщательному медицинскому наблюдению в начальный период лечения месалазином. Если препарат вызывает острые реакции непереносимости, такие как схваткообразные (спастические) боли в животе, острая боль в животе, лихорадка, сильная головная боль и сыпь, терапию следует немедленно прекратить.

#### Особые примечания

В отдельных случаях реакции гиперчувствительности, главным образом в виде проблем с дыханием, могут также наблюдаться у людей, не страдающих астмой, вследствие наличия сульфита. Данное лекарственное средство содержит пропиленгликоль, который может вызвать молочнокислый ацидоз, гиперосмолярность, гемолиз и угнетение ЦНС. Может возникнуть незначительное или легкое раздражение кожи, вследствие действия пропиленгликоля. Данное лекарственное средство содержит цетостеариловый спирт, который может вызывать местные кожные реакции (например, контактный дерматит).

В исследованиях токсичности при многократном применении месалазина, в случае его использования в высоких дозах, наблюдалась токсичность для почек



(почечный папиллярный некроз и повреждение эпителия в проксимальной трубчатке (pars convoluta) или всего нефрона). Имеют ли эти данные клиническое значение, не установлено.

Содержимое контейнера находится под высоким давлением. Баллон не следует подвергать воздействию солнечного света и нагревать до температуры более 50°C. Вскрывать и прокалывать баллон, а также сжигать пустые использованные баллоны недопустимо. Не использовать вблизи открытого огня или раскаленных предметов.

## **ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ, МЕХАНИЗМАМИ**

Месалазин не оказывает влияния на управление транспортными средствами и движущимися механизмами или же его влияние незначительно.

## **ФОРМА ВЫПУСКА**

Пена ректальная дозированная 1 г/ аппликация.

По 14 аппликаций (7 доз) в алюминиевый баллон, лакированный изнутри, снабженный дозирующим устройством, в комплекте со специальными аппликаторами из ПВХ, вставленными в защитные лотки-держатели из ПНП, и полиэтиленовыми пакетами для использованных аппликаторов. Аппликатор покрыт смазкой, состоящей из смеси белого мягкого парафина и вазелинового масла, 7:3.

1 баллон, 14 аппликаторов и 14 полиэтиленовых пакетов вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

## **УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ**

Хранить при температуре не выше 25°C, не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

## **СРОК ГОДНОСТИ**

2 года. После вскрытия баллона его следует использовать в течение 12 недель.

Не применять по истечении срока годности.

## УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускают по рецепту.

**ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ И  
ВЫПУСКАЮЩИЙ КОНТРОЛЬ КАЧЕСТВА, ПРОИЗВОДИТЕЛЬ**



Др. Фальк Фарма ГмбХ

Ляйненвеберштр. 5

79108 Фрайбург

Германия

тел. +49 0761 1514-0;

факс +49 0761 1514-356

### *Произведено:*

Аэрозоль-Сервис АГ, г. Мелин, Швейцария

## ПРЕТЕНЗИИ ПОТРЕБИТЕЛЕЙ НАПРАВЛЯТЬ ПО АДРЕСУ:

*Представительство компании Доктор Фальк Фарма ГмбХ*

127055, г. Москва, ул. Бутырский Вал, д. 68/70, стр. 4,5

тел./факс (495) 933-99-04

Менеджер по регистрации



О.А. Мещерякова