

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Месалазин, 250 мг, суппозитории ректальные

Месалазин, 500 мг, суппозитории ректальные

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: месалазин

Месалазин, 250 мг, суппозитории ректальные

1 суппозиторий содержит 250 мг месалазина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: цетиловый спирт – 18 мг (см. раздел 4.4).

Месалазин, 500 мг, суппозитории ректальные

1 суппозиторий содержит 500 мг месалазина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: цетиловый спирт – 18 мг (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Суппозитории ректальные.

Месалазин, 250 мг, суппозитории ректальные

Суппозитории торпедовидной формы, от белого до темно-серого цвета, с гладкой поверхностью. Допускается наличие коричневатого оттенка и вкраплений светло-коричневого цвета. На срезе допускается наличие воздушного стержня и воронкообразного углубления.

Месалазин, 500 мг, суппозитории ректальные

Суппозитории торпедовидной формы, от белого до темно-серого цвета, с гладкой поверхностью. Допускается наличие коричневатого оттенка и вкраплений светло-коричневого цвета. На срезе допускается наличие воздушного стержня и воронкообразного углубления.

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

Месалазин показан к применению у взрослых для лечения язвенного колита (с вовлечением дистальных отделов прямой кишки) в фазе обострения, а также в качестве поддерживающей терапии в фазе ремиссии.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

Для лечения обострений язвенного колита:

2 суппозитория по 250 мг или 1 суппозиторий по 500 мг 3 раза в сутки (соответствует 1500 мг месалазина в сутки) ректально.

Длительность лечения определяется врачом.

В качестве поддерживающей терапии в период ремиссии:

1 суппозиторий, содержащий 250 мг месалазина, 3 раза в сутки (соответствует 750 мг месалазина в сутки), ректально с целью предотвращения рецидивов.

При применении три раза в день суппозитории следует вводить в прямую кишку утром, днем и на ночь (перед сном).

Длительность лечения определяется врачом.

Способ применения

Ректально. Суппозиторий освобождают от контурной упаковки и вводят заостренным концом после опорожнения кишечника.

Для достижения желаемого терапевтического эффекта препарат Месалазин, суппозитории ректальные следует применять регулярно и непрерывно.

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.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к месалазину, сульфасалазину и другим производным салициловой кислоты или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- тяжелая почечная/печеночная недостаточность;
- детский возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Перед началом и в ходе лечения по усмотрению лечащего врача необходимо проводить следующие обследования: анализ крови (общий анализ крови, показатели функционального состояния печени (такие, как активность АЛТ и АСТ), содержание креатинина в плазме крови) и анализ мочи. Проведение контрольного обследования рекомендуется обычно через 14 дней после начала лечения и затем 2–3 раза с интервалом в 4 недели.

Если полученные результаты соответствуют нормам значений, тогда достаточно проводить данные анализы каждые 3 месяца. Если отмечается появление дополнительных симптомов, контрольные исследования необходимо выполнять немедленно.

Следует соблюдать осторожность у пациентов с нарушением функции печени.

Препарат Месалазин, суппозитории ректальные не следует применять у пациентов с нарушением функции почек. При ухудшении функции почек во время лечения следует думать о возможном нефротоксическом действии месалазина.

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

Тяжелые кожные нежелательные реакции

Сообщалось о появлении тяжелых кожных нежелательных реакций (ТКНР), включая 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.

В процессе лечения препаратом Месалазин, суппозитории ректальные следует внимательно следить за состоянием пациентов с заболеваниями легких, в частности с бронхиальной астмой.

Пациенты с анамнезом нежелательных реакций на препараты, содержащие сульфасалазин, подлежат тщательному медицинскому наблюдению в начальный период лечения препаратом Месалазин, суппозитории ректальные.

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.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит спирт цетиловый, который может вызывать местные кожные реакции (например, контактный дерматит).

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Исследований взаимодействия препарата с другими лекарственными средствами не проводилось.

У пациентов, которые одновременно получают лечение азатиоприном, 6-меркаптопурином либо тиогуанином, следует помнить о возможном усилении миелосупрессивного эффекта азатиоприна и 6-меркаптопурина, либо тиогуанина.

Применение месалазина вместе с антикоагулянтами, например, варфарином, может снижать антикоагулянтный эффект последнего.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Данных о применении препарата Месалазин в лекарственной форме суппозитории ректальные 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. Месалазин следует применять во время беременности только если возможная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

Клинические данные о применении препарата у кормящих женщин ограничены. 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.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Препарат не оказывает влияния на способность к управлению транспортными средствами и обслуживанию движущихся механизмов. При появлении описанных нежелательных явлений (таких как головокружение и др.) следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

4.8. Нежелательные реакции

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные лекарственные реакции сгруппированы по системно-органным классам в соответствии со следующей градацией частоты: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Органы и системы	Частота		
	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы		Патологические показатели форменных элементов крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)	

Органы и системы	Частота		
	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны иммунной системы		Реакции гиперчувствительности, например, аллергическая экзантема, лекарственная лихорадка, синдром красной волчанки (СКВ), панколит	
Нарушения со стороны нервной системы	Головная боль, головокружение	Периферическая нейропатия	
Нарушения со стороны сердца	Миокардит, 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, легочные инфильтраты, пневмонит)	
Желудочно-кишечные нарушения	Боль в животе, диарея, вздутие живота, тошнота, рвота	Острый панкреатит	
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей		Изменения функции печени (повышение активности трансаминаз и параметров холестаза), гепатит, холестатический гепатит	
Нарушение со стороны кожи и подкожных тканей	Фоточувствительность (повышенная чувствительность кожи к свету)	Алопеция	Синдром Стивенса – Джонсона (ССД), токсический эпидермальный некролиз (ТЭН)

Органы и системы	Частота		
	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани		Миалгия, артралгия	
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей		Нарушение функции почек, в том числе острый и хронический интерстициальный нефрит, почечная недостаточность	Нефролитиаз*
Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез		Олигоспермия (обратимая)	

*– см. раздел 4.4 для получения дополнительной информации.

Описание отдельных нежелательных реакций

Сообщалось о появлении тяжелых кожных нежелательных реакций (ТКНР), включая синдром Стивенса – Джонсона (ССД) и токсический эпидермальный некролиз (ТЭН), в связи с лечением месалазином (см. раздел 4.4).

Сообщалось о более тяжелых реакциях фоточувствительности 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 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.

Российская Федерация

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения Российской Федерации

Телефон: +7 (499) 578-06-70, +7 (499) 578-02-20

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы

При применении препарата в соответствии с инструкцией по медицинскому применению передозировка маловероятна. Описаны случаи передозировки при пероральном применении месалазина в высоких дозах. Специфического антидота нет.

Лечение

Симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: пищеварительный тракт и обмен веществ; противодиарейные, кишечные противовоспалительные/противомикробные препараты; кишечные противовоспалительные препараты; аminosалициловая кислота и аналогичные препараты; месалазин.

Код АТХ: A07EC02.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

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.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После однократного введения и после длительного лечения в течение нескольких недель 500 мг месалазина три раза в сутки в виде препарата «Месалазин, суппозитории ректальные», пиковые плазменные концентрации 5-АСК были в диапазоне 0,1-1,0 мкг/мл, пиковые плазменные концентрации основного метаболита N-Ац-5-АСК были в диапазоне 0,3-1,6 мкг/мл. Пиковые плазменные концентрации 5-АСК частично достигаются в течение первого часа после применения.

Распределение

Сцинтиграфические исследования с препарата «Месалазин, суппозитории ректальные 500 мг», меченным технецием, продемонстрировали пиковое распределение суппозитория через 2–3 часа после расплавления под действием температуры тела. Распространение было ограничено в основном прямой кишкой и ректосигмоидным соединением. Поэтому

лекарственный препарат «Месалазин, суппозитории ректальные 500 мг» особенно пригоден для лечения проктита (язвенный колит прямой кишки).

Элиминация

После однократного введения месалазина в дозе 500 мг ректально в виде препарата «Месалазин, суппозитории ректальные» примерно 11 % (в течение 72 часов) выводилось с мочой, а после нескольких недель длительного лечения дозой 500 мг месалазина три раза в сутки в виде препарата «Месалазин, суппозитории ректальные» с мочой выводилось примерно 13 % введенной дозы 5-АСК. Примерно 10 % однократной введенной дозы выводилось с желчью.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Жир твёрдый

Цетиловый спирт

Докузат натрия

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищённом от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 5 суппозиториев в контурную ячейковую упаковку из полимерной пленки ПВХ/ПЭ.

1, 2, 3 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «ЮжФарм»

353821, Краснодарский край, Красноармейский район, ст-ца Ивановская, ул. Дубинская, д. 65.

Тел.: +7 (86131) 5-35-65

Факс: +7 (86131) 2-28-28

E-mail: info@yuzhpharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ЮжФарм»

353821, Краснодарский край, Красноармейский район, ст-ца Ивановская, ул. Дубинская, д. 65.

Тел.: +7 (86131) 5-35-65

Факс: +7 (86131) 2-28-28

E-mail: info@yuzhpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Месалазин доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>