

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Месалазин

**Регистрационный номер:**

**Торговое наименование:** Месалазин

**Международное непатентованное или группировочное наименование:** месалазин

**Лекарственная форма:** суппозитории ректальные

**Состав**

1 суппозиторий содержит:

*Действующее вещество:* месалазин – 250 мг или 500 мг.

*Вспомогательные вещества:* жир твердый – 1930 мг или 2280 мг, цетиловый спирт – 18 мг, докузат натрия – 2 мг.

**Описание**

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.

**Фармакотерапевтическая группа**

Пищеварительный тракт и обмен веществ; противодиарейные, кишечные противовоспалительные/противомикробные препараты; кишечные противовоспалительные препараты; аminosалициловая кислота и аналогичные препараты; месалазин.

**Код АТХ:** А07ЕС02.

**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.

### ***Фармакокинетика***

#### **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).

#### **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.

#### **Выведение**

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.

### **Показания к применению**

Лечение язвенного колита (с вовлечением дистальных отделов прямой кишки) в фазе обострения, а также в качестве поддерживающей терапии в фазе ремиссии.

### **Противопоказания**

- гиперчувствительность к месалазину, сульфасалазину и другим производным салициловой кислоты или любому вспомогательному веществу препарата;
- тяжелая почечная/печеночная недостаточность;
- детский возраст до 18 лет.

Если у Вас одно из перечисленных заболеваний, перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

## **С осторожностью**

С осторожностью препарат следует назначать пациентам с нарушением функции дыхания (особенно пациентам с бронхиальной астмой), с повышенной чувствительностью к сульфасалазину, с нарушениями функции печени и почек.

## **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

### *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. Исследования на животных не выявили неблагоприятного действия месалазина на течение беременности, развитие 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**

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

### 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.

#### *В качестве поддерживающей терапии в период ремиссии:*

1 суппозиторий, содержащий 250 мг месалазина, три 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).

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

Длительность лечения определяется врачом.

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		
	Редко ( $\geq 1/10\ 000$ , но $< 1/1000$ )	Очень редко ( $< 1/10\ 000$ )	Частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно)
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы		Патологические показатели форменных элементов крови (апластическая анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)	
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		

Органы и системы	Частота, в соответствии с классификацией MedDRA		
	Редко ( $\geq 1/10\ 000$ , но $< 1/1000$ )	Очень редко ( $< 1/10\ 000$ )	Частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно)
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)
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*

Органы и системы	Частота, в соответствии с классификацией MedDRA		
	Редко ( $\geq 1/10\ 000$ , но $< 1/1000$ )	Очень редко ( $< 1/10\ 000$ )	Частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно)
Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез		Олигоспермия (обратимая)	

\* – см. раздел «Особые указания» для получения дополнительной информации.

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 «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**

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.

**Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

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.

### **Особые указания**

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 Стивена – 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).

**Влияние на способность управлять транспортными средствами и 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.

**Форма выпуска**

Суппозитории ректальные 250 мг, 500 мг.

По 5 суппозитория 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.

**Условия хранения**

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

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

**Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

**Производитель**

ООО «ЮжФарм», Краснодарский край, Крымский муниципальный район, с.п. Троицкое, ст-ца Троицкая, тер. Нефтепромплощадка.

**Владелец регистрационного удостоверения / Организация, принимающая претензии потребителей**

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

Директор ООО «ЮжФарм»

Тараненко А.Л.