

707/21.11.06



КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Mesafoam®

Месафоум

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Едно впръскване съдържа:

Meselazine 1.0g

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Пяна ректална

Бяло-сива до слабо червено-виолетова, кремообразна твърда пяна

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**4.1 Показания**

Лечение на острия стадий на леката форма на улцерозен колит, ограничен в сигмата и ректума.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Начин на употреба: ректално приложение

Възрастни и деца над 12 години:

2 прилагания един път дневно преди лягане. Първо се поставя апликатор на флакона и преди апликатора да се постави в ректума в удобната дълбочина, флакона се разклаща в продължение на 15 секунди. За да се освободи една доза Mesafoam®, горната част на помпата се натиска докрая. Горната част на помпата трябва да бъде насочена надолу. След първото или второто активиране, в зависимост от нуждата (виж по-долу), апликаторът трябва да се държи в позиция в продължение на 10-15 секунди преди да бъде отстранен от ректума. Ако пациентът не може да задържи необходимото количество пяна, тя може да се приложи в разделени дози: една доза преди лягане и другата доза през нощта (след освобождаване на първата единична доза) или рано сутринта. Ако нормалната доза не осигури необходимия ефект, дозата може да бъде удвоена (две прилагания преди лягане и две прилагания рано сутринта). Най-добрите резултати се наблюдават, когато червата са предварително изпразнени.

По принцип, острия епизод на улцерозен колит затихва след четири-шест седмици. Препоръчва се лечението да продължи с месалазин през устата -поддържаща терапия, например Salofalk tabl.gastr. res..

Деца под 12 години:

Mesafoam® не трябва да бъде използвана при деца под 12 години поради недостатъчен опит с тази възрастова група.



4.3 Противопоказания

Mesafoam[®] е противопоказана в случай на:

- съществуваща свръхчувствителност към салицилова киселина и нейните производни или към всяка една от съставките на Salofalk[®] пяна
- тежко нарушение на чернодробната и бъбречна функция
- съществуваща стомашна или дуоденална язва
- хеморагична диатеза

Mesafoam[®] не трябва да се използва за лечение на деца под 12 години.

Внимание: Пациентите с астма трябва да бъдат лекувани внимателно със Mesafoam[®], тъй като сулфитът, съдържащ се в пяната може да причини реакции на свръхчувствителност.

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

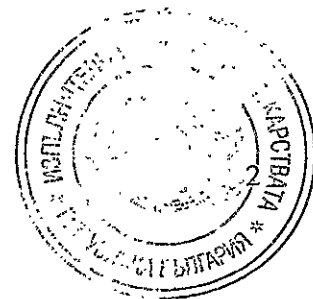
Кръвта (ПМК (диференциално броене); функционални параметри на черния дроб като ALT или AST; серумен креатинин) и урината трябва да бъдат изследвани преди и по време на лечението, по преценка на лекуващия лекар. Препоръчва се контролни изследвания да се извършват 14 дни след началото на лечението, след това два до три пъти на интервал от 4 седмици.

Ако резултатите са нормални, контролни изследвания трябва да се извършват на всеки три месеца. При поява на допълнителни симптоми трябва да се извършат незабавно контролни изследвания. Препоръчва се особено внимание при пациенти с нарушена чернодробна функция. Mesafoam[®] не се препоръчва при пациенти с нарушена бъбречна функция. Трябва да се има предвид Mesalazine-индуцирана бъбречна токсичност, ако бъбречната функция се влоши по време на лечението. Пациенти с белодробни заболявания, по-точно астма, трябва да бъдат наблюдавани по време на курса на лечение със Mesafoam[®].

Пациенти с анамнеза за алергични реакции към лекарствени продукти, съдържащи сулфалазин трябва да бъдат под непосредствено лекарско наблюдение при започването на курса на лечение със Mesafoam[®]. При поява на симптоми на остра непоносимост: спазми, остра стомашна болка, втрисане, силно главоболие и кожен обрив, лечението трябва да бъде преустановено незабавно.

Специални забележки:

В изолирани случаи може да се наблюдават реакции на свръхчувствителност при пациенти без анамнеза за астма, поради съдържанието на сулфид. Mesafoam[®] съдържа пропилен гликол, който може да причини ацидоза, хиперосмоларитет, хемолиза и депресия. Поради наличието на пропилен гликол могат да бъдат наблюдавани реакции на свръхчувствителност като иритация на кожата. Mesafoam[®] съдържа цетостеарилов алкохол, който може да причини локални кожни реакции (например контактен дерматит).



4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Не са извършвани специфични изследвания за лекарствени и други взаимодействия.

Взаимодействия могат да се появят при паралелно лечение със Mesafoam[®] и следните лекарствени продукти. Повече от тези възможни взаимодействия се основават на теоритични причини.

- Кумаринов-тип антикоагуланти: възможно засилване на противосъсирвация ефект (повишен риск от кървене в стомашно-чревния тракт)
- Глюкокортикоиди: възможно повишаване на нежеланите стомашни реакции
- Сулфанилуреини: възможно повишаване на хипогликемичния ефект.
- Methotrexate: възможно повишение на токсичния му ефект.
- Probenecid/Sulphinpyrazone: възможно отслабване на урикозо- Sulphinpyrazone уричният им ефект.
- Spironolactone/Frusemide: възможно намаляване на диуретичния ефект
- Rifampicin: възможно намаляване на туберколостатичния ефект.

При пациенти, лекувани паралелно с азатиоприн или 6-меркатопурин е възможно повишаване на миелосупресивния им ефект.

4.6 Бременност и кърмене

Няма данни за употреба на Mesafoam[®] при бременни жени.

Не са извършвани изследвания със Mesafoam[®] върху репродуктивността при животни. Предишни изследвания при животни след орално приемане на Mesalazine не са показали директни или индиректни опасни ефекти по отношение на бременност, ембрионално/фетално развитие, раждане или постнатално развитие. Mesafoam[®] не трябва да бъде използвана по време на бременност, докато не бъде преценена потенциалната полза пред възможния риск. В малки количества Mesalazine преминава в кърмата. Прилагането на Mesafoam[®] не се препоръчва по време на кърмене. Ако е необходимо лечение, кърменето трябва да бъде преустановено.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са наблюдавани ефекти върху способността за шофиране и използване на машини.

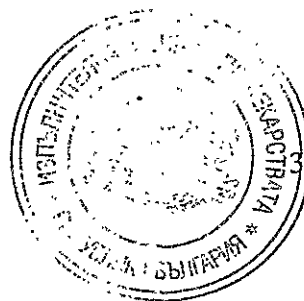
4.8 Нежелани лекарствени реакции

Стомашно-чревни нежелани реакции (рядко; $\geq 0.01\%$ -< 0.1%):

Стомашна болка, диария, флатуленция, гадене, повръщане

Нежелани реакции, засягащи ЦНС (рядко $\geq 0.01\%$ -< 0.1%):

Главоболие, замаяване



Нежелани реакции, засягащи бъбреците (много рядко <0.01%):

Нарушена бъбречна функция и бъбречна недостатъчност вследствие остър и хроничен интерстициален нефрит.

Реакции на свръхчувствителност (много рядко <0.01%):

Алергичен обрив, лекарствена треска, бронхоспазъм, пери-и миокардит, остър панкреатит, алергичен алвеолит, лупус еритематодес синдром, панколит

Мускулно-скелетни нарушения (много рядко <0.01%):

Болки в мускулите и ставите

Нарушения на кръвната и лимфна система (много рядко <0.01%):

Промени в кръвната картина (апластична анемия, агранулоцитоза, панцитопения, неутропения, левкопения, тромбоцитопения)

Нарушения в хепато-билиарната система (много рядко <0.01%):

Промени във функционалните чернодробни параметри (повишаване на трансаминазите), хепатит.

Кожни нарушения (много рядко <0.01%):

Алопеция

Специална забележка:

Трябва да се обръща специално внимание при прилагане на Mesafoam[®] при пациенти с намалена бъбречна функция. При клинични изследвания, в някои случаи е наблюдавано леко до средно перианално/анално парене, а при един случай – в допълнение метеоризъм.

4.9 Предозиране

До този момент не са докладвани случаи на интоксикация и не са известни специфични антидоти. Ако е необходимо, при случаи на предозиране може да се има предвид интравенозно вливане на електролити (форсирана диуреза).

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1 Фармакодинамични свойства

Механизмът на противовъзпалително действие на Mesalazine не е изяснен. Резултатите при “ин витро” проучвания показват, че инхибирането на липоксигеназа може да играе роля. Mesalazine оказва въздействие върху концентрациите на простагландин в чревната мукоза. Mesalazine действа като радикален “чистач” на реактивни кислородни съединения. Mesalazine действа предимно върху мукозата и субмукозата локално в чревния лумен. Важно е наличието на Mesalazine в местата на инфекция. Следователно системната



бионаличност /плазмените концентрации/ на Mesalazine не са релевантни за терапевтичното му действие, а по скоро като фактор за безопасност.

5.2 Фармакокинетични свойства

Общи характеристики на Mesalazine:

Абсорбция:

Абсорбцията на Mesalazine е по-висока в проксималните отдели на червата и по-слаба в дисталните.

Биотрансформация:

Mesalazine се метаболизира пре-систематично чрез чревната мукоза и чрез черния дроб до фармакологично неактивната N-acetyl-5aminosalicylic acid (N-Ас-5-ASA). Смята се, че ацелирането зависи от ацетиляторния фенотип на пациента. Известно ацелиране се наблюдава и чрез действието на бактериите в колона. Свързването на Mesalazine и N-Ас-5-ASA с протеини е съответно 43% и 78%.

Елиминирание:

Mesalazine и неговия метаболит N-Ас-5-ASA се елиминират чрез изпражненията (по-голямата част), през бъбреците (между 20 % и 50% в зависимост от начина на приложение, фармацевтичния продукт и съответно пътя на освобождаване на Mesalazine), и билиарно (по-малка част). Бъбречна екскреция преди всичко се появява като N-Ас-5-ASA. Около 1% от цялата орално приложена доза Mesalazine преминава в кърмата.

Специфика на Salofalk® пяна:

Разпределение:

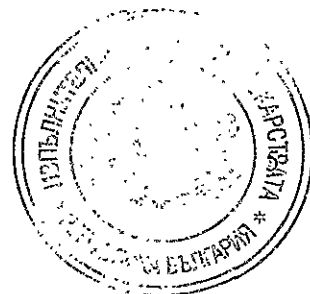
Комбинирано фармакосцинтиграфично/фармакокинетично проучване показва, че разпръскването на Mesafoam® е хомогенно и бързо, и приключва в рамките на един час. Mesafoam® достига ректума, сигмата и колон десценденс в зависимост от размера на възпалението.

Абсорбция:

Абсорбирането на mesalazine е бързо и пика на плазмените концентрации за mesalazine и неговия метаболит N-Ас-5-ASA се достига за около 4 часа. Плазмените концентрации на една доза от 2 g mesalazine пяна са сравними с 250 mg орална доза mesalazine, като се достига максимална концентрация от около 0.4µg/ml. Пресистемния метаболизъм е бърз, и N-Ас-5-ASA достига максимални плазмени концентрации също за около 4 часа както mesalazine, но плазмените му концентрации са около 4-5 пъти по-високи, около 2µg/ml.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Предклинични проучвания със Mesafoam® не са извършвани, освен едно клинично проучване при кучета, което показва добър локален толеранс към Mesafoam®.



Въз основа на конвенционални изследвания на фармакологичната безопасност, генотоксичност, карциногеност (плъхове) или токсичност върху репродуктивността, предклиничните данни показват, че Mesafoam[®] не представлява заплаха за хората. Бъбречна токсичност (бъбречна папиларна некроза и увреждане на епитела в близките бъбречни канали или целия нефрон) е наблюдавано при изследвания за токсичност при повтаряща се доза с високи орални дози на mesalazine. Не е известна клиничната релевантност на това откритие.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Sodium metabisuphite	0.0500 g
Polysorbate 60	0.0364 g
Cetostearyl alcohol	0.0091 g
Disodium edentate	0.0136 g
Propylene glycol	3.4364 g

Пропеланти:

Mixture of Propane, n-Butane, Isobutane 3.0 g

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

3 години

След отваряне на флакона: 12 седмици

6.4. Специални условия на съхранение

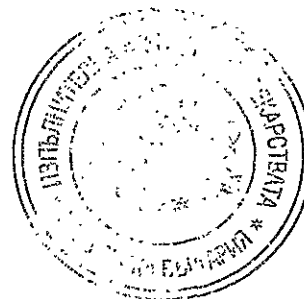
Да се съхранява при температура под 25°C. Да не се замразява или изстудява. Това е контейнер под налягане, съдържащ 3.75% маса от възпламенителен пропелант. Да се съхранява далече от пламъци или искри, включително от цигари. Да се пази от пряка слънчева светлина. Контейнера да не се пробива и изгаря, дори когато е празен.

6.5 Данни за опаковката

Алуминиев контейнер под налягане с метрична клапа, съдържащ 80 g (14 впръсквания) суспензия заедно с 14 PVC апликатори, покрити с бял мек парафин и течен парафин за прилагане на пяната.

6.6 Препоръки при употреба

Няма специфични препоръки



7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Dr. Falk Pharma GmbH
Leinenweberstr. 5
D-79108 Freiburg
Germany

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН № В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ЗЛАХМ

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ (ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО)

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Септември 2003

