

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

Приложение към разрешение за употреба

№/Дата на КЛП

Подпис:

2/26.06.07

11-0547/05.09.07
Мерцел

1. Име на лекарствения продукт

Salofalk® 250 mg suppositories

Салофалк 250 mg супозитории

Активно вещество : месалазин

2. Качествен и количествен състав

1 Салофалк 250 mg супозитория съдържа :

250 mg Mesalazine като терапевтично активно вещество

За помощните вещества виж 6.1

3. Лекарствена форма

Супозитории за ректално приложение.

Външен вид : бял до кремав цвят, с форма на торпедо супозитория.

4. Клинични данни

4.1 Терапевтични показания



- Лечение на остри състояния и профилактика на рецидив на улцерозен колит, ограничен в ректума

4.2 Дозировка и начин на приложение

За лечение на остри епизоди на улцерозен колит:

В зависимост от индивидуалните клинични нужди, Салофалк 250 mg x 2 супозитории или Салофалк 500 mg x 1 супозитория се поставят в ректума три пъти дневно (еквивалентно на 1500 mg mesalazine дневно).

За профилактика на рецидив на улцерозен колит:

Една Салофалк 250 mg супозитория три пъти дневно (еквивалентно на 750 mg mesalazine дневно).

Деца под 6 години

Децата под 6 години не трябва да приемат Salofalk 250 mg супозитории, защото е събран много малък опит с употребата му в тази възрастова група.

Деца на възраст над 6 години и юноши

В зависимост от тежестта на заболяването, по време на остро състояние трябва да се прилагат 30-50 mg месалазин/kg телесно тегло дневно, разделени на 3 дози.

За профилактика на рецидив, 15-30 mg/kg тегло дневно, разделени на 2-3 дози.

Препоръчва се главно половината от дозата за възрастни да се дава при телесно тегло до 40 кг, а нормалната доза за възрастни при телесно тегло над 40 кг.

Така децата с телесно тегло над 40 кг получават :

- За лечение на остро състояние- по 1 супозитория Salofalk 250 mg три пъти дневно



- За предотвратяване на рецидив – по 1 супозитория Salofalk 250 mg 2 пъти дневно / сутрин и вечер/

Децата с телесно тегло над 40 кг получават доза за възрастни.

Когато Salofalk 250 mg супозитории се използват 3 пъти дневно, те трябва да се слагат в ануса сутрин, обед и вечер.

Лечението със Salofalk 250 mg супозитории трябва да се прилага редовно и последователно, защото само по този начин може успешно да се достигне до оздравяване.

Острите състояния на улцерозен колит или болест на Крон обикновено отзвучават за 8 до 12 седмици. Продължителността на употребата се определя от лекар.

4.3 Противопоказания

Салофалк супозитории не трябва да се прилага на пациенти:

- Със съществуваща преди свръхчувствителност към салицилова киселина, нейните производни или към някоя от помощните съставки
- Тежки чернодробни или бъбречни функционални смущения
- Съществуваща стомашна или дуоденална язва
- Хеморагична диатеза

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки за употреба

Кръвни проби / диференциално броене, чернодробни функционални проби като ALT или AST, серумен креатинин / и изследване на урина / тест лентички и седимент/ трябва да се извършват преди и по време на лечението, ако лекуващият лекар прецени, че това е необходимо. По правило се препоръчва изследванията да се правят 14 дни преди началото на лечението и след това 2-3 пъти в интервали от 4 седмици.

Ако находките са нормални, след това са достатъчни изследвания на 3 месеца. Ако се развият допълнителни болестни симптоми, трябва веднага да се направят изследвания.



Трябва да се внимава при пациенти с чернодробно функционално смущение.

Салофалк супозитории не трябва да се прилага при пациенти с бъбречни функционални смущения. Може да се очаква предизвикана от месалазин нефротоксичност, ако бъбречната функция се влошава по време на лечението.

Пациенти с белодробни функционални нарушения, особено астма се нуждаят от много близко проследяване по време на лечението със Салофалк супозитории.

При пациенти с известна свръхчувствителност към продукти, съдържащи сулфасалазин, лечението със Салофалк супозитории може да започне само ако тези пациенти се наблюдават отблизо от лекар. Ако се появят признаци на остра непоносимост, като спазми, остра коремна болка, треска, силни главоболия и кожни обриви лечението трябва да се прекрати веднага.

Салофалк супозитории не трябва да се използва при деца под 6 годишна възраст.

4.5 Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са провеждани специфични изпитвания за взаимодействие.

Взаимодействията могат да се появят при едновременно лечение със Салофалк 250 mg супозитории и следните лекарствени продукти, въпреки, че повечето от тези взаимодействия са от теоретично естество :

- Антикоагуланти от кумаринов тип : възможно потенциране на противосъсирващото действие / увеличен риск от кървене в стомашната област/
- Глюкокортикоиди : възможно потенциране на стомашно-специфичните нежелани реакции
- Сулфонилурея : възможно потенциране на хипогликемичното действие
- Метотрексат : възможно потенциране токсичността на метотрексата
- Пробенецид/сулфинпиразон : възможно отслабване на урикозуричното действие



- Спиринолактон / Фуросемид : възможно отслабване на диуретичното действие
- Рифампицин : възможно отслабване на туберкулостатичното действие

Възможността от потенциране на миелосупресивните ефекти на азатиоприн или 6-меркантопурин трябва да се има предвид при пациенти , които се лекуват едновременно с тези лекарства.

4.6 Бременност и кърмене

Няма достатъчно данни за употребата на Салофалк супозитории от бременни. Все пак при ограничен брой бременни лекувани с месалазин не са наблюдавани отрицателни ефекти върху бременността или върху здравето на плода или новороденото. Няма нови релевантни епидемиологични данни. Има едно изолирано съобщение за остра бъбречна недостатъчност при новородено, родено от жена, която продължително е приемала високи дози месалазин по време на бременността / 2-4 g дневно перорално/.

Опити с животни, при които е прилаган месалазин перорално не показват директни или индиректни ефекти върху гестацията, ембрионално/феталното развитие, раждането или постнаталното развитие.

Салофалк супозитории трябва да се използва по време на бременност, само ако предвижданата полза надвишава възможния риск.

N- ацетил-5-аминосалицилова киселина и малки количества месалазин се секретират в кърмата. Има ограничен опит с месалазин, използван по време на кърмене при хора. Реакциите на свръхчувствителност – например диария при кърмачетата не може да бъдат изключени. Затова Салофалк супозитории може да се използва по време на кърмене само ако предвижданата полза надвишава възможния риск. Ако при кърмачето се появи диария , кърменето трябва да се прекрати.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са наблюдавани ефекти върху способността за шофиране и работа с машини.



4.8 Нежелани реакции

Нежелани реакции, засягащи стомашно-чревната система / редки $\geq 0,01$ - $<0.1\%$ / : коремна болка, диария, подуване на стомаха, гадене и повръщане.

Нежелани реакции, засягащи ЦНС / редки $\geq 0,01$ - $<0.1\%$ / : главоболие и замаяност

Нежелани реакции, засягащи бъбреците / много редки $< 0.01 \%$ / : нарушена бъбречна функция, включително остри и хронични възпалителни промени на съединителната тъкан на бъбреците / интерстициален нефрит/ и бъбречна недостатъчност.

Реакции на свръхчувствителност / много редки $< 0.01\%$ / : алергични кожни обриви /екзантема/, лекарствена треска, спазмолитично стеснение на дихателните пътища / бронхоспазъм/, възпаление на сърдечната обвивка и сърдечния мускул / перикардит, миокардит/, остро възпаление на панкреаса / панкреатит/, алергично възпаление на белодробните мехурчета / алергичен алвеолит/, вълчанка / синдром на lupus erythematosus/, възпаление на цялото дебело черво / панколит/.

Мускулно-скелетни нарушения / много редки $< 0.01\%$ / : мускулна и ставна болка / миалгия, артралгия/.

Нарушения на кръвоносната и лимфна система / много редки $< 0.01\%$ / : промени в кръвната картина /апластична анемия, агранулоцитоза, панцитопения, неутропения, левкопения, тромбоцитопения/.

Хепато-билиарни нарушения / много редки $< 0.01\%$ / : промяна в параметрите на чернодробната функция / повишени трансминази и параметри на холестаза / , възпаление на черния дроб / хепатит / , възпаление на черния дроб свързано със застой на жлъчката / холестатичен хепатит/.

Нарушения на кожата и кожните придатъци / много редки $< 0.01\%$ / : косопад /алопеция / и плешивост.



4.9 Предозиране

Досега, няма съобщения за предозиране, нито има известен специфичен антидот. При необходимост, може да се има предвид интравенозна инфузия с електролити / форсирана диуреза /.

5. Фармакологични свойства

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група / АТС код

Противовъзпалително чревно средство

АТС код : A07EC02

Механизмът на противовъзпалителния ефект е неизвестен. Изпитванията „ин-витро“ показват, че може би играе роля инхибирането на липоксигеназата.

Освен това е показан ефект върху съдържанието на простагландини в чревната лигавица. Месалазин / 5-аминосалицилова киселина – 5ASA/ може да функционира и като улавя реактивните кислородни компоненти.

Когато достигне чревния лумен, ректално приложеният месалазин има продължително локално действие върху чревната лигавица и субмукозната тъкан.

5.2 Фармакокинетични свойства

Основни аспекти на месалазин

Резорбция

Резорбцията на месалазин е най-голяма в проксималните области и най-ниска в дисталните области на червата.

Биотрансформация

Месалазин се метаболизира пре-системно, едновременно в чревната лигавица и в черния дроб до фармакологично неактивния N- ацетил-5-



аминосалицилова киселина /N-AC-5ASA/. Ацетилирането изглежда независимо от ацетилаторния фенотип на пациента. Част от месалазина се ацетилира също от бактериите в дебелото черво. 43 % от месалазина и 78 % от N-AC-5ASA са свързани с протеин.

Елиминиране / екскреция

Месалазин и метаболита му N-AC-5ASA се екскретират в изпражненията / голяма част / , чрез бъбреците / количеството варира между 20-50 % , в зависимост от начина на приложение , лекарствената форма и свързаният с нея начин на освобождаване на месалазин / и чрез жлъчката /малка част/. Бъбречната екскреция е главно под форма на N-AC-5ASA. Около 1 % от перорално приложената доза месалазин преминава в кърмата , главно като N-AC-5ASA.

Специфични аспекти на Салофалк супозитории

Разпределение

Сцинтиграфски изпитвания с белязани с технеций Salofalk 500 mg супозитории показват максимално разпространение на супозиторията , която се е стопила поради телесната температура след 2-3 часа.

Разпространението е ограничено първоначално в ректума и ректосигмоидното съединение. Затова Salofalk супозитории са особено подходящи за лечение на проктит / улцерозен колит на ректума /.

Резорбция

Максимални плазмени концентрации на 5-ASA след единична доза , както и след многократно прилагане в продължение на няколко седмици на 500 mg месалазин три пъти дневно под форма на Salofalk супозитории са от порядъка на 0,1 е 1,0 $\mu\text{g/ml}$, докато тези на основния метаболит N-Ac-5-ASA са между 0,3-1,6 $\mu\text{g/ml}$. В някои случаи , максимални плазмени концентрации на 5-ASA се достигат за около 1 час след прилагането.

Елиминиране

След единична доза 500 mg месалазин под форма на Salofalk супозитории приблизително 11 % / след 72 часа / и след няколко седмично многократно



приложение на 500 mg месалазин три пъти дневно под форма на Salofalk супозитории около 13 % от приложената доза 5-ASA се открива в урината.

Приблизително 10 % от приложената доза се елиминира чрез жлъчката.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни от конвенционалните изпитвания за фармакологична безопасност , генотоксичност , карциногенност /плъх/ и репродуктивна токсичност не показват специален риск за хора. Бъбречна токсичност / бъбречна папиларна некроза и епително увреждане на проксималните извити тубули или на целия нефрон / се наблюдава в изпитванията за токсичност след многократно приложение на високи перорални дози месалазин. Клиничното значение на тези находки е неясно.

6. Фармацевтични данни

6.1 Списък на помощните вещества

Твърда мазнина

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия за съхранение

Съхранявайте в оригиналния контейнер с цел да предпазите съдържанието от светлина. Да се съхранява под 25 ° C.

6.5 Данни за опаковката

Контейнер : PVC/ полиетилен филм

Големина на опаковките:

Опаковка с 10 и 30 супозитории .



6.6 Специални предпазни мерки за изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. Притежател на разрешението за употреба

Dr. Falk Pharma GmbH
Leinelweberstr. 6
Postfach 6529
79041 Freiburg
Germany
Tel : +49 761-1514-0
Fax : +49 761-1514-321
e-mail : zentrale@drfalkpharma.de
http: www.drfalkpharma.de

8. Номер на разрешението за употреба

9. Дата на първо разрешение / подновяване на разрешението

10. Дата на актуализация на текста

Март 2006 г.

11. Статус на отпускане

Отпуска се само по рецепта.

