

# МЕСАЛАЗОЛ суппозитории

## Состав препарата

1 суппозиторий по 250 мг содержит:

*Активное вещество:* месалазин 250 мг.

*Вспомогательные вещества:* полусинтетические глицериды – до 2,08 г.

1 суппозиторий по 500 мг содержит:

*Активное вещество:* месалазин 500 мг.

*Вспомогательные вещества:* цетиловый спирт, докузат натрия, полусинтетические глицериды до 2,2 г.

## Описание препарата

Суппозитории цилиндрической формы, от светло-серого до серого с бежевым или розовым оттенком. На срезе допускается наличие воздушного и пористого стержня, и воронкообразного углубления.

## Фармакотерапевтическая группа и код АТХ

Антибактериальный, противовоспалительный препарат с локализацией действия в кишечнике. Месалазин.

Код АТХ: A07E C02

## Фармакологические свойства

### Фармакодинамика

Месалазин оказывает противовоспалительное действие на уровне слизистой кишечника. Ингибирует активность нейтрофильной липооксигеназы и синтез метаболитов арахидоновой кислоты (простагландинов и лейкотриенов). Тормозит образование цитокинов в слизистой оболочке кишечника, тормозит миграцию, дегрануляцию, фагоцитоз нейтрофилов, секрецию иммуноглобулинов лимфоцитами. Также оказывает антиоксидантное действие: связывает и разрушает свободные радикалы кислорода. Подавляет активность некоторых кишечных бактерий, особенно *Escherichia coli* (антибактериальный эффект проявляется в толстом кишечнике).

### Фармакокинетика

При применении суппозитория происходит высвобождение и распределение месалазина происходит в прямой и дистальной трети толстой кишки, абсорбция препарата в системный кровоток низкая и составляет около 10%. Метаболизируется в слизистой оболочке кишечника и в печени в неактивный метаболит - N-ацетил-5-аминосалициловую кислоту. Связывание месалазина с белками плазмы составляет 43%, N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты – 73-83%. Препарат и его метаболит проникает через плацентарный барьер и проникает в грудное молоко. Период полувыведения месаламина составляет 0,5-2 часа, N-ацетил-5-аминосалициловой кислоты - около 5-10 часов. Месалазин и его метаболиты выводятся почками (50%) с мочой (главным образом в ацетилированной форме) и через кишечник (40%) с калом. При ректальном введении в суточной моче обнаруживается 10-30% дозы. Кумулирует при хронической почечной недостаточности.

## Показания

Воспалительные заболевания прямой кишки и дистального отдела толстого кишечника (неспецифический язвенный колит, проктит, проктосигмоидит; болезнь Крона) в стадии обострения и их профилактика.

## Способ применения и дозы

Ректально.

Взрослые. При легких и среднетяжелых формах в стадии обострения по одному суппозиторию (500 мг) 3 раза в сутки. Максимальная суточная доза - 1,5 г.

Для профилактики рецидивов назначают по одному суппозиторию (250 мг) 3 раза

в сутки, при необходимости в течение нескольких лет.

При тяжелых формах по два суппозитория (500 мг) 3 раза в сутки. Максимальная суточная доза может быть увеличена до 3-4 г (на период не более чем на 8-12 недель).

Дети: при обострении 40-60 мг/кг веса в сутки, для профилактики рецидивов – 20-30 мг/кг веса в сутки (кратность приема -3 раза в сутки).

Длительность лечения определяется индивидуально (в среднем 8-10 недель).

#### **Побочные действия**

Со стороны пищеварительной системы: ощущение дискомфорта и боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм, диарея, снижение аппетита, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит, панкреатит;

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко – сердцебиение, тахикардия, артериальная гипер- или гипотензия, боли за грудиной; одышка, перикардит, миокардит;

Со стороны мочевыделительной системы: протеинурия, гематурия, олигурия, анурия, нефротический синдром, кристаллурия;

Со стороны органов кроветворения: анемия (гемолитическая, мегалобластная, апластическая), лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, нейтропения, метгемоглобинемия;

Со стороны нервной системы: астения, головная боль, головокружение; шум в ушах, полиневропатия, тремор, депрессия;

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, дерматозы, бронхоспазм, фотосенсибилизация;

Прочие: слабость, паротит, алопеция, олигоспермия, волчаночноподобный синдром, уменьшение продукции слезной жидкости.

#### **Противопоказания**

Гиперчувствительность к салицилатам, почечная и/или печеночная недостаточность тяжелой степени, заболевания крови, язва желудка и двенадцатиперстной кишки, геморрагический диатез, возраст до 2 лет, период лактации, последние 2-4 недели беременности.

#### **Противопоказания**

Симптомы: тошнота, рвота, боль в животе, слабость, сонливость.

Лечение: промывание желудка, назначение слабительного, симптоматическая терапия.

#### **Меры предосторожности и особенности применения**

С осторожностью применяют препарат при печеночной и почечной недостаточности легкой и умеренной степени тяжести, дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, пациентам с аллергическими заболеваниями.

Перед применением суппозитория необходимо опорожнить кишечник.

Необходимо проводить контроль картины периферической крови, функции печени и выделительной функции почек (уровень мочевины и креатинина в крови) до лечения, через 14 дней после начала лечения, затем 1 раз в месяц в течение 3 месяцев, после - при нормальных результатах - 1 раз в три месяца, а также по окончании терапии.

На фоне применения препарата может наблюдаться окрашивание мочи и слез в желто-оранжевый цвет, прокрашивание мягких контактных линз.

#### **Беременность и период лактации**

Применение препарата в период беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Препарат противопоказан к применению в последние 2-4 недели беременности и в период лактации.

Женщинам, планирующим беременность, нужно выбрать период, когда можно отказаться от лечения или принимать поддерживающие дозы.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению потенциально опасными механизмами*

Месалазол не оказывает влияния на способность к вождению автотранспорта и управлению потенциально опасными механизмами.

#### **Взаимодействие с другими лекарствами, другие взаимодействия**

При одновременном применении препарат:

- усиливает действие антикоагулянтов (риск развития желудочно-кишечного кровотечения );
- усиливает ульцерогенное действие глюкокортикоидов на слизистую желудка;
- усиливает токсичность метотрексата;
- ослабевает действие рифампицина;
- ослабевает действие фуросемида;
- усиливает гипогликемический эффект сульфонилмочевины,
- замедляет абсорбцию цианокобаламина.

#### **Форма выпуска, упаковка**

По 7 суппозиторий в блистере из ПВХ/ПЭ пленки.

По 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

#### **Условия хранения**

Хранить в сухом и защищенном от света месте, при температуре 15-25°С.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Срок годности**

3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

#### **Условия отпуска**

Отпускать по рецепту врача.