

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

РЕПУБЛИКАНСКА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Рег. №	9600068
Разрешение №	67818 / 07-02-2025
BG/MA/MP -	/
Общностен №	/

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Салофалк 500 mg супозитории
мезалазин

Salofalk 500 mg suppositories
Mesalazine

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една Салофалк 500 mg супозитория съдържа 500 mg мезалазин (mesalazine) като терапевтично активно вещество.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Супозитория за ректално приложение

Външен вид: бяла до кремаво оцветена, с форма на торпедо супозитория

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лечение на остър улцерозен колит, който е ограничен в ректума.

4.2 Дозировка и начин на приложение

В зависимост от индивидуалните клинични нужди, една Салофалк 500 mg супозитория се поставя в ректума три пъти дневно (еквивалентно на 1 500 mg мезалазин дневно).

След настъпването на ремисия, дозата трябва се редуцира до една супозитория с 250 mg мезалазин (напр. Салофалк 250 mg супозитории) три пъти дневно за профилактика на рецидив.

Педиатрична популация

Деца на възраст под 6 години

Салофалк 500 mg супозитории не трябва да се прилагат при деца на възраст под 6 години поради много ограничения опит при 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 мезалазин/kg телесно тегло дневно, разделени на 3 дози.

За профилактика на рецидив, трябва да се прилагат 15-30 mg мезалазин/kg телесно тегло дневно, разделени на 2 до 3 дози.

Най-общо се препоръчва при телесно тегло до 40 kg да се прилага половината от дозата за възрастни, а при телесно тегло над 40 kg – нормалната доза за възрастни.

Така, при деца с телесно тегло до 40 kg се прилагат:



- за лечение на остро състояние: 1 супозитория с 250 mg мезалазин три пъти дневно (напр. Салофалк 250 mg супозитории)
- за предотвратяване на рецидив: 1 супозитория с 250 mg мезалазин два пъти дневно (сутрин и вечер) (напр. Салофалк 250 mg супозитории)

При деца с телесно тегло над 40 kg се прилага дозата за възрастни.

Продължителност на лечението

Продължителността на употребата се определя от лекаря.

Метод на приложение

Когато Салофалк 500 mg супозитории се използват 3 пъти дневно, те трябва да се поставят в ануса сутрин, по обяд и вечер.

Лечението със Салофалк 500 mg супозитории трябва да се прилага редовно и постоянно, тъй като само по този начин може да се постигне успешно възстановяване.

4.3 Противопоказания

Салофалк 500 mg супозитории са противопоказани при пациенти с:

- известна свръхчувствителност към салицилати или към някои от помощните вещества
- тежко увреждане на чернодробната или бъбречна функция

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Изследванията на кръвта (диференциална кръвна картина, чернодробни функционални изследвания, като АЛАТ или АСАТ; серумен креатинин) и изследването на урината чрез тест ленти трябва да бъдат извършени преди и по време на лечението, по преценка на лекуващия лекар. Като правило, проследяващи изследвания се препоръчват 14 дни след започване на лечението, последвани от допълнителни две или три изследвания през интервали от 4 седмици.

Ако находките са нормални, проследяващите изследвания трябва да се провеждат на всеки 3 месеца. Ако възникнат допълнителни симптоми, изследванията трябва да се проведат незабавно.

При пациенти с увредена чернодробна функция се препоръчва повишено внимание.

Мезалазин не трябва да се употребява при пациенти с увредена бъбречна функция. Ако по време на лечението бъбречната функция се влоши, трябва да се има предвид вероятността за мезалазин-индуцирана бъбречна токсичност. Ако случаят е такъв, приемът на Салофалк 500 mg супозитории трябва незабавно да се прекрати.

Съобщавани са случаи на нефролитиаза при употреба на мезалазин, включително камъни със съдържание на 100 % мезалазин. Препоръчва се по време на лечението да се осигури достатъчен прием на течности.

Мезалазин може да доведе до червеникаво-кафяво оцветяване на урината след контакт с натриев хипохлорит (напр. в тоалетни, почиствани с натриев хипохлорит, съдържащ се в някои видове белина).

Има много редки съобщения за сериозни кръвни дискразии с мезалазин. Трябва да се направят хематологични изследвания, ако пациентите страдат от необясними кръвоизливи, образуване на синини, пурпура, анемия, повишена температура или фаринголарингеална болка. Приемът на Салофалк 500 mg супозитории трябва да се прекрати в случай на подозрана или потвърдена кръвна дискразия.



Има редки съобщения за реакции на сърдечна свръхчувствителност (миокардит и перикардит), предизвикана от мезалазин. В такъв случай приемът на Салофалк 500 mg супозитории трябва незабавно да се прекрати.

Пациентите с белодробно заболяване, по-специално астма, трябва да бъдат много внимателно проследявани в хода на лечението с мезалазин.

Тежки кожни нежелани реакции

Съобщавани са тежки кожни нежелани реакции (SCARs), включително лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (DRESS), синдром на Stevens-Johnson (SJS) и токсична епидермална некролиза (TEN), свързани с лечението с мезалазин. Мезалазин трябва да се прекрати при първата поява на признаци и симптоми на тежки кожни реакции като обрив по кожата, лезии на лигавицата или друг признак на свръхчувствителност

Идиопатична вътречерепна хипертензия

Съобщава се за идиопатична вътречерепна хипертензия (*pseudotumor cerebri*) при пациенти, получаващи мезалазин. Пациентите трябва да бъдат предупредени за признаците и симптомите на идиопатична вътречерепна хипертензия, включително тежко или повтарящо се главоболие, зрителни нарушения или шум в ушите. Ако възникне идиопатична вътречерепна хипертензия, трябва да се обмисли спиране приема на мезалазин.

Пациентите с анамнеза за нежелани лекарствени реакции към лекарствени продукти, съдържащи сулфасалазин, трябва да бъдат под строго лекарско наблюдение при започване на лечебен курс с мезалазин. Ако Салофалк 500 mg супозитории предизвикат остри реакции на непоносимост, като коремни спазми, остра коремна болка, треска, тежко главоболие и обрив, лечението трябва незабавно да се преустанови.

Цетиловият алкохол, помощно вещество в състава на Салофалк 500 mg, може да предизвика локално дразнене на кожата (напр. контактен дерматит).

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са провеждани проучвания за специфични взаимодействия.

При пациенти на съпътстващо лечение с азатиоприн, 6-меркаптопурин или тиогуанин, трябва да се има предвид възможно усилване на миелосупресивните ефекти на азатиоприн, 6-меркаптопурин или тиогуанин.

Налице са незначителни доказателства, че мезалазин може да понижи антикоагулантния ефект на варфарин.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

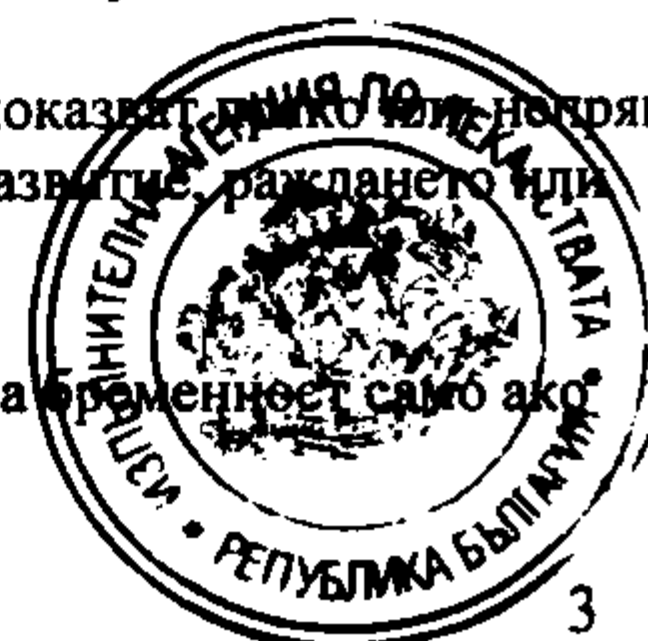
Бременност

Няма достатъчно данни за употребата на мезалазин при бременни жени. Данните от ограничен брой случаи на експозиция по време на бременност показват, обаче, че мезалазин няма нежелани ефекти върху бременността или здравето на фетуса/новороденото дете. До момента няма други значими епидемиологични данни.

В един единствен случай след дългосрочна употреба на висока доза мезалазин (2-4 g, перорално) по време на бременността, е съобщена бъбречна недостатъчност при новороденото.

Проучванията при животни върху перорално прилаган мезалазин не показват никакво или непряко вредно въздействие върху бременността, ембрионалното/феталното развитие, раждането или постнаталното развитие.

Салофалк 500 mg супозитории трябва да бъдат използвани по време на бременност само ако потенциалната полза надвишава възможния риск.



Кърмене

N-ацетил-5-аминосалициловата киселина и в по-малка степен мезалазин се отделят в майчината кърма. До момента е налице само ограничен опит при жени в периода на лактация. Реакции на свръхчувствителност, като диария при кърмачето, не могат да бъдат изключени. Ето защо, Салофалк 500 mg супозитории трябва да бъдат използвани по време на кърмене само ако потенциалната полза надвишава възможния риск. Ако кърмачето развие диария, кърменето трябва да се преустанови.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Мезалазин няма или има незначително влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Следните нежелани лекарствени реакции са били съобщени при употребата на мезалазин:

Системо-органични класове	Честота по MedDRA конвенцията			
	Чести ($\geq 1/100$ до $<1/10$)	Редки ($\geq 1/10\ 000$ до $<1/1\ 000$)	Много редки ($< 1/10\ 000$)	С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка)
Нарушения на кръвта и лимфната система			Промени в кръвната картина (апластична анемия, агранулоцитоза, панцитопения, неутропения, левкопения, тромбоцитопения)	
Нарушения на нервната система		Главоболие, замаяност	Периферна невропатия	Идиопатична вътречерепна хипертензия (вж. точка 4.4)
Сърдечни нарушения		Миокардит, перикардит		
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения			Алергични и фибротични белодробни реакции (включително диспнея, кашлица, бронхоспазм, алвеолит, пулмонална еозинофилия, белодробна инфилтрация, пневмонит)	



Стомашно-чревни нарушения		Болка в корема, диария, флатуленция, гадене, повръщане	Остър панкреатит	
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища			Увреждане на бъбречната функция, включително остър и хроничен интерстициален нефрит и бъбречна недостатъчност	Нефролитиоза*
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	Обрив, сърбеж	Фоточувствителност	Алоpecia	Лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (DRESS), синдром на Stevens-Johnson (SJS), токсична епидермална некролиза (TEN)
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан			Миалгия, артралгия	
Нарушения на имунната система			Реакции на свръхчувствителност като алергична екзантема, лекарствена треска, синдром на лупус еритематодес, панколит	
Хепато-билиарни нарушения			Промени в показателите на чернодробната функция (повишение на трансаминазите и показателите за холестаза), хепатит, холестатичен хепатит	
Нарушения на възпроизводителната система			Олигоспермия (обратима)	



* за допълнителна информация вж. точка 4.4

Съобщавани са тежки кожни нежелани реакции (SCARs), включително лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (DRESS), синдром на Stevens-Johnson (SJS) и токсична епидермална некролиза (TEN), свързани с лечението с мезалазин (вж. точка 4.4).

Фоточувствителност

По-тежки реакции се съобщават при пациенти със съществуващи заболявания на кожата, като атопичен дерматит и атопична екзема.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев” № 8

1303 София

Тел.: +359 2 8903417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Налични са ограничени данни за предозиране (напр. при възнамерявано самоубийство с високи перорални дози на мезалазин), които не показват бъбречна или чернодробна токсичност. Няма специфичен антидот и лечението е симптоматично и поддържащо.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Аминосалицилова киселина и подобни средства,
АТС код: A07EC02

Механизмът на противовъзпалително действие е неизвестен. Резултатите от *in vitro* проучвания показват, че инхибирането на липоксигеназата вероятно играе роля.

Установени са и ефекти върху концентрацията на простагландин в чревната мукоза. Мезалазин (5-аминосалицилова киселина / 5-ASA) може също напълно да отстранява реактивните кислородни съединения.

Когато достигне чревния лумен, ректално приложеният мезалазин оказва предимно локално въздействие върху чревната мукоза и субмукозна тъкан.

5.2 Фармакокинетични свойства

Основни аспекти на мезалазин:

Абсорбция

Абсорбцията на мезалазин е най-висока в проксималните и най-ниска в дисталните чревни участъци.

Биотрансформация

Мезалазин се метаболизира пред-системно както в чревната лигавица, така и в черния дроб, фармакологично неактивната N-ацетил-5-аминосалицилова киселина (N-Ас-5-ASA). Ацетилирането изглежда независимо от ацетилаторния фенотип на пациента. Известно количество мезалазин се ацетилира и от чревните бактерии. Свързването с плазмените протеини на мезалазин и N-Ас-5-ASA е 43% и 78%, съответно.



Елиминирани

Мезалазин и неговият метаболит N-Ас-5-АSА се елиминират чрез фекалиите (основна част), урината (количеството варира между 20 и 50%, в зависимост от начина на прилагане, лекарствената форма и освобождаването на мезалазин) и жлъчката (малка част). Екскрецията в урината е главно под формата на N-Ас-5-АSА. Около 1% от перорално приложената доза мезалазин се екскретира в кърмата като N-Ас-5-АSА.

Специфични аспекти на Салофалк супозитории:

Разпределение

Сцинтиграфски проучвания с белязани с технеций Salofalk 500 mg супозитории, са показали пиково разпространение на супозитория, която се е разтопила след 2 – 3 часа в резултат на телесната температура. Разпространението е било ограничено най-вече в ректума и ректосигмоидната свързка. Ето защо, Салофалк супозитории са особено подходящи за лечение на проктит (улцерозен колит на ректума).

Абсорбция

Максималните плазмени концентрации на 5-АSА след еднократна доза, както и след няколко седмично, многократно прилагане на 500 mg мезалазин 3 пъти дневно под формата на Салофалк супозитории, са били само между 0.1 и 1,0 микрограма/мл, докато тези на основния метаболит N-Ас-5-АSА са били между 0,3 и 1,6 микрограма/мл. В някои случаи максималните плазмени концентрации на 5-АSА са били достигнати в рамките на един час след прилагането.

Елиминирани

След еднократна доза на 500 mg мезалазин под формата на Салофалк супозитории, приблизително 11% (в рамките на 72 часа), както и след няколко седмично, многократно прилагане на 500 mg мезалазин 3 пъти дневно под формата на Салофалк супозитории, приблизително 13% от приложената 5-АSА доза са били открити в урината. Приблизително 10% от приложената доза се елиминира чрез жлъчката.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Неклиничните данни не показват особен риск за хора на базата на конвенционалните фармакологични проучвания за безопасност, генотоксичност, карциногенен потенциал (плъхове) или репродуктивна токсичност.

Бъбречна токсичност (бъбречна папиларна некроза и епително увреждане в проксималните извити тубули или в целия нефрон) е било наблюдавано след многократно прилагане на високи перорални дози мезалазин. Клиничната релевантност на тази находка е неизвестна.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Твърда мас
Натриев докузат
Хексадекан-1-ол.

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 години



6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина.
Да не се съхранява над 25°C.

6.5 Данни за опаковката

Опаковка (лента): PVC/полиетиленов филм

Големина на опаковките:
Опаковки по 10 и 30 супозитории

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати на пазара.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Dr. FALK PHARMA GmbH
Leinenweberstr. 5
79108 Freiburg
Германия
тел.: +49 (0) 761 / 1514-0
факс: +49(0) 761 / 1514-321
e-mail: zentrale@drfalkpharma.de

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg. № 9600068

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 16 април 1996 г.
Дата на последно подновяване: 05 септември 2007 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

01/2025

