

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия  
месалазин

Salofalk 4 g/60 ml rectal suspension  
Mesalazine

РЕПУБЛИКАНСКА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Ид. Ред. №	9600070
Регистрация №	B61MK/MP-61686
Дата на издаване	21-02-2023

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една Салофалк 4 g/60 ml клизма (= 60 g суспензия) съдържа 4 g месалазин (mesalazine) като терапевтично активно вещество.

#### Помощни вещества с известно действие

Една Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия съдържа 280,8 mg калиев метабисулфит (E 224) и 60 mg натриев бензоат (E 211).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Суспензия за ректално приложение

Външен вид: кремаво-оцветена до бледокафява хомогенна суспензия, несъдържаща чужди частици

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1 Терапевтични показания

Лечение на остри състояния на улцерозен колит (хронично възпалително заболяване на дебелото черво)

#### 4.2 Дозировка и начин на приложение

##### Дозировка

##### Възрастни

Принципно се прилагат следните дози:

При пациенти със симптоми на остро възпаление, съдържанието на един флакон (60 g суспензия) се прилага в червото като клизма веднъж дневно преди лягане.

##### Деца на възраст под 6 години

Салофалк ректална суспензия не трябва да се прилага при деца на възраст под 6 години поради много ограничения опит при тази възрастова група.

##### Деца на възраст над 6 години и юноши

Салофалк ректална суспензия е налична в дози от 2 g/30 ml и 4 g/60 ml.



Подходящата доза на клизмата трябва да бъде избрана въз основа на тежестта и разпространението на заболяването в дебелото черво и телесното тегло на детето/юношата.

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 прилага Салофалк 2 g/30 ml ректална суспензия веднъж дневно преди лягане.

Деца с тегло над 40 kg трябва да бъдат лекуват или със Салофалк 2 g/30 ml или Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия, в зависимост от степента на възпалението.

#### Общи инструкции за употреба

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия се прилага веднъж дневно преди лягане.

Лечението със Салофалк 4g/60ml ректална суспензия трябва да се прилага редовно и последователно, защото само по този начин може да се постигне желаните терапевтичен ефект.

Продължителността на употребата се определя от лекаря

#### Начин на приложение

За ректално приложение

Най-добри резултати се постигат, ако червото е изпразнено преди приложението на Салофалк 4g/60ml ректална суспензия.

Подготовка:

- Разклатете флакона за 30 секунди.
- Отстранете предпазната капачка от апликатора.
- Дръжте флакона вертикално.

Правилна позиция за приложение на клизмите:

- Пациентът трябва да легне на лявата си страна с изпънат ляв крак и свит нагоре десен крак. Тази позиция на тялото улеснява приложението на клизмата и нейната ефективност.

Приложение на клизмата:

- Вкарайте върха на апликатора дълбоко в ректума.
- Наклонете леко надолу флакона и след това изстискайте бавно съдържанието.
- След изпразването на флакона, извадете бавно върха на апликатора от ректума.
- Пациентът трябва да остане да лежи в същото положение за най-малко 30 минути, за да може съдържанието на клизмата да се разпространи в правото черво.
- Ако е възможно, течността на клизмата трябва да се остави да действа през нощта.

#### **4.3 Противопоказания**

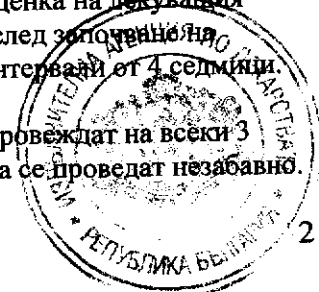
Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия е противопоказана при пациенти с:

- известна свръхчувствителност към салицилати или към някои от помощните вещества посочени в точка 6.1
- 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 започването 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.

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия 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.

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).

Пациентите с белодробно заболяване, по-специално астма, трябва да бъдат много внимателно проследявани в хода на лечението със Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия.

#### 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.

Пациентите с анамнеза за нежелани лекарствени реакции към лекарствени продукти, съдържащи сулфасалазин, трябва да бъдат под строго лекарско наблюдение при започване на лечебен курс със Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия. Ако Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия предизвика остри реакции на непоносимост, като коремни спазми, остра коремна болка, треска, тежко главоболие и обрив, лечението трябва незабавно да се преустанови.

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия съдържа калиев метабисулфит, който в редки случаи може да причини тежки реакции на свръхчувствителност и бронхоспазм.

Този лекарствен продукт съдържа 60 mg натриев бензоат във всяка Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия. Натриевият бензоат може да причини локално дразнене.

#### 4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са провеждани проучвания за специфични взаимодействия.

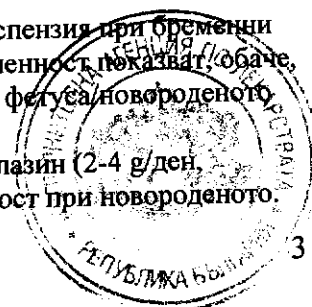
При пациенти на съпътстващо лечение с азатиоприн, 6-меркаптопурин или тиогуанин, трябва да се има предвид възможно усилване на миелосупресивните ефекти на азатиоприн, 6-меркаптопурин или тиогуанин.

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 Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия 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/ден, перорално) по време на бременността, е съобщена бъбречна недостатъчност при новороденото.



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

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия трябва да бъде използвана 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 4 g/60 ml ректална суспензия трябва да бъде използвана 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

Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия 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		
	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	
Сърдечни нарушения	Миокардит, перикардит		
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения		Алергични и фибротични белодробни реакции (включително диспнея, кашлица, бронхоспазъм, 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	Фоточувствителност	Алопеция	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](http://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

##### Механизъм на действие

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.

##### Фармакодинамични ефекти

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*

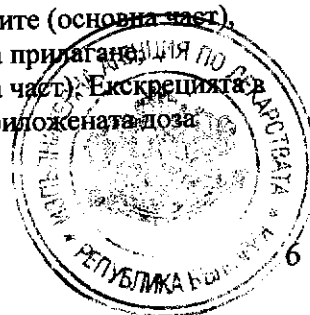
Абсорбцията на мезалазин е най-висока в проксималните и най-ниска в дисталните чревни участъци.

##### *Биотрансформация*

Мезалазин се метаболизира пред-системно както в чревната лигавица, така и в черния дроб, до 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.

##### *Елиминиране*

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



## Специфични аспекти на Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия:

### *Разпределение*

Образно диагностично проучване при пациенти с лек до умерено тежък остър улцерозен колит е показало, че в началото на лечението и при ремисията след 12 седмици ректалната суспензия се е разпространила основно в ректума и сигмоидната част на колона и до по-малка степен в низходящата част на колона.

### *Абсорбция и елиминиране*

В проучване на улцерозен колит при пациенти в ремисия, максимални плазмени концентрации от 0,92 µg/ml за 5-ASA и 1,62 µg/ml за N-Ас-5-ASA са достигнати след около 11-12 часа при условия на равновесно състояние. Елиминираният дял е бил приблизително 13% (45-часова стойност), с най-голям процент (приблизително 85%) на елиминиране под формата на метаболита N-Ас-5-ASA.

Плазмените концентрации в равновесното състояние на 5-ASA и на N-Ас-5-ASA при деца с хронично възпаление на дебелото черво на лечение със Салофалк 4 g/60 ml ректална суспензия са били, съответно, 0,5-2,8 µg/ml и 0,9-4,1 µg/ml.

## **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Неклиничните данни не показват особен риск за хора на базата 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**

Карбомер 974Р;  
Калиев ацетат;  
Калиев метабисулфит (Е 224, макс. 0,28 g, еквивалентни на макс. 0,16 g SO<sub>2</sub>);  
Натриев бензоат (Е 211);  
Натриев едетат;  
Пречистена вода;  
Ксантанова гума.

### **6.2 Несъвместимости**

Не са известни.

### **6.3 Срок на годност**

2 години

### **6.4 Специални условия на съхранение**

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.  
Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина.



## **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

Опаковка:

Кръгла, бяла бутилка от LPDL, със зелена защитна капачка от LDPE

Големина на опаковките:

Опаковка, съдържаща 7 бутилки с ректална суспензия

## **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

факс: +49(0) 761 / 1514-321

e-mail: zentrale@drfalkpharma.de

## **8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Per. № 9600070

## **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**

01/2023

