

Suprimal[®]

Mesalazina 500 mg

**COMPRESOS CON
CUBIERTA ENTÉRICA**
MESALAZINA

COMPOSICION:

Cada comprimido recubierto contiene:

Mesalazina..... 500 mg
Excipientes..... c.s.

ACCION TERAPEUTICA:

Antiinflamatorio de acción específica sobre la pared intestinal, tanto para situaciones en fase aguda como profilaxis de recidiva.



INDICACIONES:

Colitis ulcerativa

Colitis microscópica

Colitis inespecífica (idiopática)

Enfermedad de Crohn

Rectocolitis hemorrágica

Enfermedad diverticular y diverticulitis

POSOLOGIA Y FORMA DE ADMINISTRACION:

Colitis Ulcerativa y/o rectocolitis hemorrágica en fase aguda: 4 - 8 comprimidos repartidos en cuatro tomas por día, durante 4 - 8 semanas, dependiendo de la respuesta terapéutica. Mantenimiento: 2 - 4 comprimidos divididos en dos tomas al día, durante el tiempo necesario hasta la desaparición de los síntomas.

Igual posología para la fase aguda de la diverticulitis.

Enfermedad de Crohn, fase aguda: Ocho (8) comprimidos repartidos en dos a cuatro tomas en el día, durante 4 - 16 semanas. Mantenimiento: 4 comprimidos repartidos en dos tomas por día.

CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS:

La mesalazina (conocida también como mesalamina o 5-ASA) constituye la parte terapéuticamente activa de la sulfasalazina. La sulfasalazina se convierte, por acción bacteriana, en sulfapiridina y mesalazina, en el colon. Químicamente corresponde al ácido 5 - amino salicílico.

El mecanismo de acción de la mesalazina no es bien conocido, pero impresiona más como tópico que como sistémico. En los pacientes con inflamación intestinal crónica, la mucosa produce una mayor cantidad de metabolitos del ácido araquidónico, tanto a través de la ciclooxigenasa (prostanoides) como de la lipooxigenasa (leucotrienos y ácido hidroxi-eicosa-tetraenoico) y podría ser posible que la mesalazina reduzca la inflamación mediante un bloqueo de la ciclooxigenasa y su ulterior inhibición en la producción de prostaglandinas pro-inflamatorias en el colon.

La liberación de la molécula 5-ASA en el territorio intestinal lesionado ejerce su función antiinflamatoria por su acción sobre diversos sistemas:

- a) inhibición de la síntesis de eicosanoides (prostaglandinas y leucotrienos)
- b) funciones inmunológicas
- c) eliminación de radicales libres y metabolitos de oxígeno.

FARMACOCINETICA:

Se presenta en tabletas con cubierta entérica con la propiedad de liberación tardía del principio activo, que tiene una elevada acción en las porciones distales del intestino delgado y en el colon. Esto es logrado por tener la cubierta resistente al jugo gástrico.

In vitro las tabletas de mesalazina recubiertas con capa entérica, se mantienen inalteradas en el jugo gástrico (pH 1) a 37° C por dos horas, y en el jugo intestinal simulado (pH 6,8) correspondiente a la primera porción del duodeno, por una hora. La disolución se produce en el jugo intestinal simulado a un pH de 7,2 correspondiente a la parte distal del intestino delgado e intestino grueso. Es en este sitio donde ejerce su actividad terapéutica.

Alrededor del 75% de la mesalazina (ácido 5-aminosalicílico) es excretada por las heces. La fracción absorbida es excretada bajo la forma acetilada a través de la orina (16-20%). Aproximadamente el 5% es eliminado por la vía biliar.

CONTRAINDICACIONES:

Insuficiencia hepática o renal severas; úlcera gastroduodenal en actividad, alergia a los salicilatos o a algún componente de la fórmula.

Lactantes y niños menores de 2 años. Embarazo y lactancia.

ADVERTENCIAS:

En algunas ocasiones, al iniciar el tratamiento con mesalazina, puede haber una exacerbación de la sintomatología, caracterizada por calambres, dolor abdominal, diarrea sanguinolenta, fiebre, cefaleas, prurito y erupción cutánea. Estos síntomas por lo general se revierten al suspender la medicación.

Algunos pacientes con hipersensibilidad a la sulfasalazina pueden presentar una reacción similar con la mesalazina.

Debido a que el uso de mesalazina en pacientes con alteración renal, puede empeorar dicha función, se recomienda solicitar a todos los pacientes una evaluación funcional renal antes de comenzar el tratamiento con mesalazina y repetirlo en forma periódica.

PRECAUCIONES:

Insuficiencia renal. Alteraciones de la coagulación. Reacciones adversas previas a la sulfasalazina. Estenosis pilórica. Exacerbación de síntomas de colitis.

INTERACCIONES:

Alimentos: La administración concomitante puede provocar descenso de la concentración de mesalazina y el mecanismo probable es la disminución de la absorción.

Heparinas de bajo peso molecular: La administración concomitante puede aumentar el riesgo de sangrado por el componente de salicilato de la mesalazina. Por lo que se debe monitorear al paciente clínicamente y con estudios de laboratorio. El mecanismo probable es el descenso de la función plaquetaria y de la coagulación.

Mercaptopurina: Debido a que la sulfasalazina es un inhibidor débil de la tiopurina metil transferasa (enzima que cataboliza las tiopurinas: azatioprina, mercaptopurina y tioguanina) la administración de la sulfonamida y una tiopurina produce acumulación de esta última e incrementa notablemente el riesgo de mielotoxicidad. Monitorear al paciente mediante hemogramas seriados.

Vacuna contra la varicela: En los pacientes vacunados para el virus de la varicela, debe evitarse el uso de salicilatos por un intervalo de seis semanas, después de recibir la vacunación ya que se ha descrito mayor riesgo de síndrome de Reye.

Así mismo se debe evitar su administración si se sospecha de dengue.

Warfarina: La administración concomitante puede provocar descenso de la eficacia de la warfarina por lo que conviene monitorear el tiempo de protrombina. Se desconoce el mecanismo involucrado.

CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, TRASTORNOS DE LA FERTILIDAD:

No se han efectuado estudios en animales a largo plazo para evaluar el potencial de carcinogenicidad de la mesalazina.

La sustancia no resultó mutagénica en ensayos realizados en *K. pneumoniae* y *S. typhimurium*.

En dosis orales hasta de 480 mg/kg/día, mesalazina no tuvo efectos adversos sobre la fertilidad ni la reproducción de ratas machos y hembras.

REACCIONES ADVERSAS:

Las reacciones más comunes reportadas incluyen: diarrea, vómitos, mareo, náusea, meteorismo, cefalea, artralgias, envejecimiento cutáneo, constipación.

Estos efectos son usualmente transitorios y reversibles.

Puede presentarse síntomas de intolerancia aguda en pacientes con antecedentes de hipersensibilidad a los salicilatos y/o a la sulfasalazina, por lo que deben ser advertidos de discontinuar el tratamiento y contactar al médico en caso de presentar, por ejemplo: fiebre, enrojecimiento cutáneo y/o diarrea, durante el uso de mesalazina.

Muy raramente también pueden presentarse pericarditis, miocarditis, hepatitis, agranulocitosis, anemia aplásica, neuropatía periférica.

En forma excepcional, se pueden observar trastornos renales, incluyendo nefritis intersticial aguda y crónica, leucopenia, trombocitopenia, neutropenia.

SOBREDOSIFICACION:

Dadas las características farmacocinéticas específicas de la mesalazina, es factible la difusión de dosis activas por vía sistémica. Esto no ocasiona necesariamente una intoxicación, aún después de la absorción de dosis elevadas.

En principio, los síntomas serían los mismos que los de una intoxicación por salicilatos, es decir: alcalo-acidosis, hiperventilación, edema pulmonar, deshidratación por transpiración y vómitos, hipoglucemia.

Ante esta eventualidad concurrir al hospital más cercano y comunicarse con un centro de toxicología.

PRESENTACION:

Caja de tabletas con cubierta entérica, con 30 tabletas

Elaborado por Laboratorios TEMIS-LOSTALÓ de Argentina, para Laboratorios EUROSTAGA S. A. Quito-Ecuador

www.eurostaga.com