

## ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

### СУЛЬФАСАЛАЗИН



**Регистрационный номер:** ЛП-003765

**Торговое наименование:** Сульфасалазин

**Международное непатентованное наименование:** сульфасалазин

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые пленочной оболочкой

**Состав на 1 таблетку:**

**Активное вещество:** сульфасалазин - 500,0 мг.

**Вспомогательные вещества:** крахмал прежелатинизированный - 115,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 29,0 мг, повидон-K25 - 24,0 мг, магния стеарат - 7,0 мг, кремния диоксид коллоидный - 5,0 мг.

**Состав оболочки:** гипромеллоза - 8,4 мг, макрогол-4000 - 2,1 мг, титана диоксид - 4,1 мг, краситель железа оксид желтый - 0,4 мг.

**Описание:** круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от светло-желтого до коричневатого-желтого цвета. На поперечном разрезе таблетки видны два слоя: ядро коричневатого-желтого цвета и пленочная оболочка.

**Фармакотерапевтическая группа:** противомикробное и противовоспалительное кишечное средство.

**Код АТХ:** A07EC01

#### ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

##### Фармакодинамика

Сульфасалазин избирательно накапливается в соединительной ткани кишечника с высвобождением 5-аминосалициловой кислоты (5-АСК), обладающей противовоспалительной активностью, и сульфапиридина, обладающего противомикробной бактериостатической активностью.

##### Фармакокинетика

Около 30% сульфасалазина в таблетках, покрытых пленочной оболочкой, абсорбируются из тонкой кишки, остальные 70% подвергаются расщеплению микрофлорой кишечника с образованием сульфпиридина 60-80% и 25% - 5-АСК. Существуют большие индивидуальные различия в максимальных сывороточных концентрациях ( $C_{max}$ ) сульфасалазина и его метаболитов; у «медленных ацетиляторов» они выше, что увеличивает риск развития нежелательных эффектов. Сульфасалазин достигает максимальной концентрации через 3-12 часов после приема таблеток, покрытых пленочной оболочкой.

Связь с белками плазмы сульфасалазина - 99%, сульфпиридина - 50%, 5-АСК - 43%. Сульфпиридин подвергается метаболизму в печени путем гидроксирования с образованием неактивных метаболитов, 5-АСК - путем ацетилирования. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) сульфасалазина - 5-10 ч, сульфпиридина - 6-14 ч, 5-АСК - 0,6-1,4 ч. Кишечником выводится 5% сульфпиридина и 67% 5-АСК, почками - 75-91% всосавшегося сульфасалазина (в течение 3 дней).

#### ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Язвенный колит (лечение обострений и поддерживающая терапия в фазе ремиссии);
- Болезнь Крона (легкие и среднетяжелые формы в фазе обострения);
- Ревматоидный артрит; ювенильный ревматоидный артрит при неэффективности нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП).

#### ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Повышенная чувствительность к сульфасалазину или другим компонентам препарата, а так же сульфонамидам или салицилатам;

- порфирия;
- гранулоцитопения;
- апластическая анемия;
- врожденный дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (риск развития желтухи);
- печеночная и/или почечная недостаточность;
- дети младше 10 лет и/или массой тела 35 кг и менее, с хроническими воспалительными заболеваниями кишки (для данной лекарственной формы и дозировки);
- обструкция кишечника или мочевыводящих путей;
- дети младше 6 лет с ювенильным ревматоидным артритом (эффективность и безопасность не установлены);
- период грудного вскармливания.

**С ОСТОРОЖНОСТЬЮ:** бронхиальная астма, atopический дерматит, аллергические реакции в анамнезе (возможны перекрестные аллергические реакции к фуросемиду, тиазидным диуретикам, производным сульфонилмочевины, ингибиторам карбоангидразы), системные формы ювенильного ревматоидного артрита (риск развития сывороточной болезни); беременность.

#### Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Во время беременности назначение препарата возможно только по строгим показаниям и в минимально эффективной дозе. Если позволяет течение заболевания, то в последнем триместре беременности прием препарата следует прекратить (сульфасалазин вытесняет билирубин из связи с белками плазмы, тем самым, увеличивая риск развития ядерной желтухи и гипербилирубинемии новорожденных - токсическое поражение нервных центров головного мозга). У новорожденных с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы возможно развитие гемолитической анемии. Сульфасалазин в норме секретруется в материнское молоко в очень небольшом количестве; у недоношенных новорожденных и у детей группы повышенного риска увеличивается риск развития ядерной желтухи. Концентрация же сульфпиридина в материнском молоке составляет 40% концентраций в плазме матери. При необходимости применения сульфасалазина в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

#### СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь, после приема пищи.

Язвенный колит, болезнь Крона.

Взрослым и детям старше 16 лет: в 1-й день — по 500 мг 4 раза в сутки; во 2-й — по 1 г 4 раза в сутки; в 3-й и последующие дни — по 1,5-2 г 4 раза в сутки. После стихания острых клинических симптомов язвенного колита взрослым и подросткам и/или массой тела более 65 кг назначают поддерживающую дозу — по 500 мг 3 — 4 раза в сутки в течение нескольких месяцев.

Детям с 10 до 16 лет и/или массой тела от 35 до 50 кг — по 500 мг 4 раза в сутки.

Поддерживающая терапия для детей и подростков до 16 лет и/или массой тела менее 65 кг не рекомендуется.

Максимальная суточная доза для взрослых — 8 г, для детей до 16 лет — 2 г.

Ревматоидный артрит и ювенильный ревматоидный артрит

Взрослым и детям старше 16 лет: в течение первой недели — по 500 мг 1 раз в сутки, в

течение второй — по 500 мг 2 раза в сутки, третьей и далее — по 500 мг 3 раза в сутки. Терапевтическая доза может составлять от 1,5 до 3 г/сут. Клинический эффект проявляется после 6-10 нед терапии. Курс лечения — 6 мес и более.

Дети от 6 до 8 лет и/или массой тела 20-29 кг: 1 табл. 2 раза в сутки;

Дети от 8 до 12 лет и/или массой тела 30-39 кг: 1 табл. 2-3 раза в сутки;

Дети от 12 до 16 лет и/или массой тела 40-50 кг: 1 табл. 3 раза в сутки или 2 табл. 2 раза в сутки;

Дети старше 16 лет и/или массой тела более 50 кг: 2 табл. 2 раза в сутки.

Максимальная суточная доза для детей составляет 2 г или 40-50 мг/кг массы тела.

#### ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

Побочные эффекты связаны со степенью плазменной концентрации сульфпиридина, особенно у людей с медленным ацетилированием. Чаще побочные эффекты наблюдаются у пациентов с ревматоидным артритом.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головная боль, периферическая нейропатия, головокружение, нарушение сна, галлюцинации, атаксия, судороги, депрессия, асептический менингит.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, диарея, снижение аппетита, панкреатит, стоматит, боль в животе, лекарственный гепатит.

Со стороны органов кроветворения: макроцитоз, лейкопения, нейтропения, мегалобластная анемия, гемолитическая анемия, гемолитическая анемия вследствие ферментных нарушений - при нестабильных молекулах гемоглобина (тельца Гейнца - Эрлиха), метгемоглобинемия, агранулоцитоз, тромбоцитопения, апластическая анемия, гипопротромбинемия.

Со стороны мочеполовой системы: протеинурия, гематурия, кристаллурия, нефротический синдром, преходящие олигоспермия и мужское бесплодие.

Со стороны дыхательной системы: одышка, кашель, интерстициальный пневмонит, фиброзирующий альвеолит, инфильтраты в легочной ткани.

Со стороны органов чувств: шум в ушах.

Лабораторные данные: гипербилирубинемия, повышение активности щелочной фосфатазы, «печеночных» трансаминаз.

Аллергические реакции: генерализованная кожная сыпь, крапивница, эритема, кожный зуд, эксфолиативный дерматит, фотосенсибилизация, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), лихорадка, лимфаденопатия, сывороточная болезнь, периорбитальная отечность, эозинофилия, узелковый периартериит, анафилактический шок.

Прочие: гипертермия, паротит, возможно окрашивание мочи, кожи или мягких контактных линз в желто-оранжевый цвет.

#### ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: тошнота, рвота, боль в животе, головокружение. При применении очень высоких доз могут иметь место: анурия, кристаллурия, гематурия, симптомы токсического поражения центральной нервной системы (судороги).

Лечение: симптоматическое. Необходимо: спровоцировать рвоту, промыть желудок, кишечник; провести защелачивание мочи, форсированный диурез. При анурии и/или

почечной недостаточности следует ограничить потребление жидкости и электролитов.

#### ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Сульфасалазин уменьшает всасывание фолиевой кислоты и дигоксина. Усиливает действие антикоагулянтов, противозипелитических и пероральных гипогликемических средств, а также побочные эффекты цитостатиков, иммунодепрессантов, гепато- и нефротоксичных средств.

Лекарственные средства, угнетающие костномозговое кроветворение, увеличивают риск миелосупрессии.

Антибактериальные средства, в связи с угнетающим действием на кишечную флору, уменьшают эффективность сульфасалазина при язвенном колите.

#### ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

В период лечения рекомендованы: периодический контроль активности «печеночных» ферментов в плазме крови, общего анализа крови (в начале терапии: 1-2 раза в месяц, затем каждые 3-6 месяцев лечения) и анализа мочи (при почечной недостаточности), употребление повышенного количества жидкости. Сульфасалазин рекомендовано с осторожностью назначать пациентам с системными формами ювенильного ревматоидного артрита, т.к. существует риск развития нежелательных эффектов, в т.ч. сывороточной болезни (лихорадка, тошнота, рвота, головная боль, кожная сыпь, нарушение функции печени).

**Влияние на способность управлять транспортными средствами и занятия другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций**

Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и работе со сложными техническими устройствами в связи с возможностью возникновения головокружения.

#### ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 500 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60 или 100 таблеток в банки из полиэтилентерефталата для лекарственных средств, укупоренные крышками навинчиваемыми с контролем первого вскрытия или системой «нажать-вернуть» из полипропилена или полиэтилена или банки полипропиленовые для лекарственных средств, укупоренные крышками натягиваемыми с контролем первого вскрытия из полиэтилена или банки полипропиленовые для лекарственных средств, укупоренные крышками натягиваемыми с контролем первого вскрытия из полиэтилена высокого давления. Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

#### Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

#### Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

**Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11**

**Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий):**

**445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6**

**Тел./факс: (84862) 3-41-09**

**ПРОИЗВОДИТЕЛЬ ООО «Озон»**