

# 5-ASA 400

## Mesalazina 400 mg

### Comprimidos de liberación retardada Supositorios

#### Industria Argentina Venta bajo receta

#### FÓRMULA

Cada comprimido de liberación retardada contiene:

**Principio activo:** Mesalazina 400 mg;

**Excipientes:** Lactosa, Polimetacrilato tipo B, Polivinilpirrolidona, Talco, Estearato de magnesio, Amarillo ocazo, Dióxido de titanio, Almidón, Polietilenglicol 6000, Glicolato de almidón, Trietilcitrate.

Cada supositorio contiene:

**Principio activo:** Mesalazina 400 mg;

**Excipientes:** Triglicéridos de ácidos grasos saturados.

#### Acción terapéutica

Antiinflamatorio intestinal.

#### Indicaciones

**Comprimidos:** tratamiento de la fase activa de la colitis ulcerosa leve a moderada y mantenimiento de la remisión.

**Supositorios:** tratamiento de sigmoiditis distal activa.

#### Acción farmacológica

El mecanismo de la acción supresora de las enfermedades intestinales inflamatorias es incierto. En pacientes con enfermedades inflamatorias intestinales está aumentada la producción de metabolitos del ácido araquidónico por la mucosa, tanto por el camino de la ciclooxigenasa como de la lipasa. Parece que la mesalazina disminuye la inflamación inhibiendo la ciclooxigenasa y la lipasa, disminuyendo de este modo la producción de prostaglandinas y de leucotrienos y ácidos hidroxieicosatetraenoicos (HETEs), respectivamente.

#### Farmacocinética

Absorción: después de la administración de mesalazina por vía oral se absorbe un 20-30% de la dosis. Por su formulación, comprimidos recubiertos por una resina de base acrílica, se disuelven a pH 7 o más, liberando la mesalazina en el íleo distal y el colon. Biotransformación - Eliminación: la mesalazina absorbida es rápidamente acetilada a ácido N-acetil-5-aminosalicílico (acetil-5-ASA) en la pared de la mucosa intestinal y el

hígado. Las concentraciones pico se alcanzan en 4 a 12 horas. La mesalazina se elimina en aproximadamente 3 horas mientras que su acetilderivado requiere alrededor de 10 horas.

Aproximadamente el 80% de la dosis administrada se recupera en las heces y en la orina se excreta como acetil-5-ASA metabolito.

Además, los niveles plasmáticos en estado estacionario demostraron una falta de acumulación de la droga libre o metabolizada durante la administración repetida en el día.

La mesalazina administrada rectalmente es pobremente absorbida. La extensión de la absorción depende del tiempo de retención del producto y hay una considerable variación individual. En el estado estacionario puede recuperarse aproximadamente alrededor del 10 al 30% de una dosis diaria de 4 g, en la orina de 24 horas.

#### Posología

##### Comprimidos

**Tratamiento agudo:** dos comprimidos (800 mg) 3 veces por día. En formas graves: hasta una dosis máxima de 4,8 g por día.

**Mantenimiento de la remisión:** se recomienda comenzar con un comprimido (400 mg) 3 veces por día.

##### Supositorios

Un supositorio (400 mg) 3 veces por día durante un mes.

#### Contraindicaciones

Hipersensibilidad a los salicilatos, trastornos serios de la función hepática y renal. Embarazo y lactancia. Niños menores de 12 años. Úlcera gástrica o duodenal activa.

#### Advertencias

Ingerir el comprimido entero, sin masticar. Después del tratamiento inicial o de ataque, la presencia de recidivas debe controlarse mediante una adecuada posología de mantenimiento. Los pacientes con estenosis pilórica pueden presentar una retención gástrica prolongada de los comprimidos que puede retardar la liberación de mesalazina en el colon.

Ocasionalmente puede producirse una exacerbación de los síntomas de la colitis caracterizada por calambres, dolor abdominal, diarrea sanguinolenta y ocasionalmente por fiebre, dolor de cabeza, malestar, prurito, rash y conjuntivitis, que desaparecen al interrumpir la administración del medicamento.

Usar con precaución en pacientes con disfunción renal o hepática, en ancianos y en diátesis hemorrágica. En embarazo y lactancia utilizar sólo en caso de real necesidad y bajo estricto control médico. No se ha demostrado la eficacia y seguridad del tratamiento en niños.

Los supositorios deben ser conservados en lugar fresco.

#### Precauciones

**Sensibilidad cruzada:** los pacientes sensibles a olsalazina, sulfasalazina o salicilatos, también pueden ser sensibles a mesalazina.

**Carcinogenicidad:** no se han realizado estudios a largo plazo para evaluar el potencial carcinogénico de la mesalazina.

**Mutagenicidad:** no se han observado evidencias de mutagenicidad.

**Embarazo-Reproducción-Fertilidad:** con mesalazina no se han visto oligospermia e infertilidad en el hombre que han sido informados en asociación con sulfasalazina. Tampoco tiene efecto sobre la fertilidad y la capacidad reproductora de ratas hembra y macho cuando se administró oralmente a dosis correspondientes a 7 veces la dosis máxima humana. La mesalazina atraviesa la placenta. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos. No se ha demostrado que dosis de 1000 y 800 mg por kilo de peso y por día, administrados a ratas y conejos respectivamente, produzcan efectos adversos en el feto.

**Lactancia:** la mesalazina y su metabolito, ácido N-acetil-5-aminosalicílico, se distribuyen en la leche materna, por lo que se desaconseja durante la lactancia.

**Pediatría:** no se han realizado estudios apropiados en la población pediátrica que relacionen la edad con los efectos de la mesalazina. No se ha establecido la seguridad y efectividad del uso en niños.

**Geriatría:** no se dispone de información que relacione la edad con los efectos de la mesalazina en la población geriátrica. No obstante, es más probable que los ancianos padezcan alteraciones de la función renal relacionadas con la edad que pueden requerir precaución en los pacientes que reciben mesalazina.

**Interacciones medicamentosas:** evitar la administración simultánea de preparaciones que bajen el pH del colon, como la lactulosa. No se pueden descartar eventuales interacciones con cumarínicos, metotrexato, probenecid, sulfonpirazona, espironolactona, furosema y rifampicina.

La mesalazina puede potenciar el efecto de las sulfonilureas (antidiabéticos orales). La administración concomitante de corticoides aumenta el riesgo de efectos colaterales gástricos.

**Alteración de valores de laboratorio:** los valores de alanino-aminotransferasa, fosfatasa alcalina, aspartato-aminotransferasa y bilirrubina sérica, pueden estar aumentados pero vuelven a sus valores normales con la continuación o interrupción del tratamiento.

#### Reacciones adversas

Raramente se han observado alteraciones gastrointestinales (náuseas, diarrea y dolor abdominal) y cefalea. En raras ocasiones puede producirse exantema alérgico, fiebre medicamentosa, broncoespasmos, síndrome lúpico o elevación de la metahemoglobinemia.

Hay algunos informes de discrasias sanguíneas o depresión de la médula ósea y anemia aplásica, leucopenia, neutropenia, trombocitopenia, pancreatitis, hepatitis, pericarditis y miocarditis, nefritis intersticial, síndrome nefrótico, alteraciones renales producidas durante el tratamiento oral que generalmente son reversibles.

#### Sobredosificación

En caso de ingestión accidental de dosis muy elevadas y luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, se llevarán a cabo los tratamientos sintomáticos que se consideren oportunos.

Ante la eventualidad de una sobredosificación concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los centros de toxicología:

**Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666 / 2247**

**Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777**

#### Presentación

**Comprimidos:** envase conteniendo 30 y 60 comprimidos entericos.

**Supositorios:** envase conteniendo 10 y 30 supositorios.

**Conservar a 15 - 25 °C.**

**Mantener fuera del alcance de los niños.**

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado n.º 40.133.

Directora Técnica: Sandra Carina Rismondo, Farmacéutica.  
**LABORATORIO DOMINGUEZ S.A.**  
Av. La Plata 2552, (1437) C.A.B.A., Argentina

Fecha de la última revisión: 26/10/98



**D**  
**DOMINGUEZ**

MAP 2696