5-ASA 500
MESALAZINA 500 mg

Comprimidos de liberación retardada

Industria Argentina **Venta bajo receta**

Fórmula
Cada comprimido de liberación retardada contiene:
Principio activo: Mesalazina 500 mg.
Excipientes: Lactosa, Almidón de maíz, Polivinilpirrolidona K 30, Glicolato sódico de almidón, Estearato de magnesio, Trietilcitrato, Dióxido de titanio, Polimetacrilato tipo B, PEG 6000, Talco, Laca alumínica amarilla D&C#10, Laca alumínica azul FD&C#2.

Acción terapéutica
Antiinflamatorio intestinal.

Indicaciones
Tratamiento de la fase activa de la colitis ulcerosa, enfermedad de Crohn y rectocolitis hemorrágica y mantenimiento de la remisión.

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 lipoxigenasa, disminuyendo de este modo la producción de prostaglandinas y de leucotrienos y ácidos hidroxieicosa-tetraenoicos (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 ó 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
Colitis ulcerosa y/o rectocolitis hemorrágica en fase aguda: 4 a 8 comprimidos (2 a 4 g) en 4 tomas por día durante 4 a 8 semanas, dependiendo de la respuesta terapéutica.
Mantenimiento: 2-4 comprimidos (1-2 g) dividido en 2 tomas por día, durante el tiempo necesario hasta la desaparición de los síntomas.
Enfermedad de Crohn, fase aguda: se sugieren 8 comprimidos repartidos en 2 a 4 tomas en el día, durante 4 a 16 semanas.
Mantenimiento: 4 comprimidos (2 g) repartidos en 2 tomas diarias.

Contraindicaciones
Hipersensibilidad a los salicilatos o algún componente de la fórmula, trastornos serios de la función hepática y renal. Embarazo y lactancia. Niños menores de 12 años. Ulcera gástrica o duodenal activa. Diátesis hemorrágica.

Advertencias
Ingerir el comprimido entero, sin masticar. La administración concomitante de alimentos puede disminuir la concentración de mesalazina, probablemente debido a la disminución de su absorción.
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.
Algunos pacientes con hipersensibilidad a la sulfasalazina pueden presentar una reacción similar a la mesalazina.
Usar con precaución en pacientes con disfunción renal o hepática y en ancianos. No se ha demostrado la eficacia y seguridad del tratamiento en niños.
Se ha informado insuficiencia renal, incluyendo nefropatía mínima y nefritis intersticial aguda y crónica en pacientes que fueron tratados con mesalazina en comprimidos. En dosis de 15-20 veces la dosis recomendada, la mesalazina produce necrosis papilar. Se aconseja evaluar la función renal del paciente antes de comenzar el tratamiento y periódicamente luego.

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 realizados 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, sulfinpirazona, espironolactona, furosemida 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. La mesalazina puede reducir la absorción de la digoxina.
La administración concomitante de heparinas de bajo peso molecular puede aumentar el riesgo de sangrado debido al componente salicilato de la mesalazina por lo que se debe monitorear al paciente clínicamente y con estudios de laboratorio.
La administración concomitante de warfarina puede producir disminución de su eficacia por lo que conviene monitorear el tiempo de protrombina.
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
Las reacciones más comunes incluyen diarrea, vómitos, mareos, náuseas, meteorismo, cefalea, constipación. Estos efectos habitualmente son transitorios y reversibles.
Raramente se han observado exantema alérgico, fiebre medicamentosa, broncoespasmos, síndrome lúpico o elevación de la metahemoglobinemia.
Hay algunos informes de discracias sanguíneas o depresión de la médula ósea y anemia aplástica, leucopenia, neutropenia, trombocitopenia, pancreatitis, hepatitis, pericarditis y miocarditis, agranulocitosis, neuropatía periférica, 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
Envases conteniendo 30, 60, 100, 500 y 1000 comprimidos de liberación retardada, siendo los dos últimos para uso exclusivo de hospitales.
Conservar a una temperatura menor a 30°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.
Fecha última revisión: septiembre 2008.

Sin T.A.C.C.
Medicamento libre de Gluten

2196-3

LABORATORIO DOMINGUEZ S.A.
Avda. La Plata 2552, (1437) Buenos Aires