



## ТИББИЁТДА ҚЎЛЛАНИЛИШИГА ДОИР ЙЎРИҚНОМА СОГЕЛЕН®

**Препаратнинг савдо номи:** Согелен®

**Таъсир этувчи модда (ХПН):** месалазин

**Дори шакли:** ректал суппозиторийлар

**Таркиби:**

Ҳар бир ректал суппозиторий куйидагиларни саклайди:

*фаол модда:* месалазин 1000 мг;

*ёрдамчи модда:* каттик ёғ.

**Таърифи:** оч пушти ёки оч жигарранг рангдан кулранг-жигарранг ранггача ёки кулранг-пушти ранггача бўлган торпеда шаклидаги суппозиторийлар.

**Фармакотерапевтик гуруҳи:** Аминосалицил кислотаси ва шунга ўхшаш воситалар. Месалазин.

**АТХ коди:** A07EC02

### Фармакологик хусусиятлари

#### Фармакодинамикаси

Яллиғланишга қарши таъсир механизми номаълум. *In vitro* тадқиқотлар натижалари шуни кўрсатадики, липоксигеназанинг ингибиция бўлиши таъсир механизмида роль ўйнаши мумкин. Шунингдек, ичак шиллик қаватидаги простагландин концентрациясига таъсири намойиш этилган. Месалазин (5-аминосалицил кислотаси/5-ASA) кислород фаол бирикмалари радикалларининг ютувчи моддаси сифатида ҳам таъсир қилиши мумкин. Ректал йўл билан қўлланиладиган месалазин, ичак йўлига етиб бориб, ичак шиллик қавати ва шиллик ости тўқимасига сезиларли даражада маҳаллий таъсир кўрсатади.

#### Фармакокинетикаси

##### Сўрилиши

Месалазиннинг энг жадал сўрилиши ичакнинг проксимал қисмларида, энг кам сўрилиши эса дистал қисмларда содир бўлади.

##### Метаболизми

Месалазин дастлабки босқичда ичакнинг шиллик қавати орқали, ҳамда жигарда фармакологик жиҳатдан нофаол N-ацетил-5-аминосалицил кислотасига (N-Ас-5-ASA) метаболизмга учрайди. Ацетил гуруҳини бирикиши беморнинг ацетилатор фенотипига боғлиқ эмас, деб тахмин қилинади. Кам даражадаги ацетилланиш ҳам йўғон ичакдаги бактериялар таъсири остида содир бўлади. Месалазин оксилларининг N-Ас-5-ASA билан боғланиши мувофиқ равишда 43% ва 78% ни ташкил қилади.

##### Чиқарилиши

Месалазин ва унинг метаболити N-Ас-5-ASA нажас билан (катта қисми), буйраклар орқали (месалазиннинг қўлланилиш турига, дори шаклига ва чиқиш йўлига қараб 20 дан 50% гача ўзгариб туради) ва ўт-сафро (иккинчи даражали қисми) билан чиқарилади. Буйрак экскрецияси асосан N-Ас-5-ASA кўринишида рўй беради. Перорал қабул қилинган месалазин умумий дозасининг тахминан 1% она сути билан, асосан N-Ас-5-ASA кўринишида чиқарилади.

##### Месалазин 1 г, специфик суппозиторийлар

##### Тақсимланиши

Шунга ўхшаш дори воситаси билан ўтказилган сцинтиграфик тадқиқотлар, технеций билан нишонланган 500 мг месалазин шамчалари, тана ҳароратида 2-3 соатдан кейин эриган шамчанинг чўкки тақсимланишини кўрсатди. Тақсимланиши асосан тўғри ичак ва

ичакнинг ректосигмоидал бўлими билан чегараланган. Согелен® 1 г суппозиторийлари худди шундай таъсир килади, деб тахмин қилинади, ва шунинг учун проктитни (тўғри ичакнинг ярали колитини) даволаш учун жуда мос келади.

#### *Сўрилиши*

Соглом одамларда 1 г месалазиннинг (1 г Согелен® суппозиторийси) бир марталик ректал дозасидан сўнг плазмадаги 5-ASA ўртача чўкки концентрацияси  $192 \pm 125$  нг/мл (19-557 нг/мл чегарасида), асосий метаболит N-Ac-5-ASA нинг концентрацияси  $402 \pm 211$  нг/мл ни (57-1070 нг/мл чегарасида) ташкил килади. 5-ASA нинг плазмадаги максимал концентрацияга эришиш вақти  $7,1 \pm 4,9$  соатни ташкил этади (0,3-24 соат чегарасида).

#### *Чиқарилиши*

Соглом одамларда 1 г месалазинни (суппозиторийни) бир марта тўғри ичакка (ректал) юборгандан кейин, 5-ASA юборилган дозасининг тахминан 14% сийдикда 48 соат давомида аниқланади.

### **Қўлланилиши**

Тўғри ичак билан чегараланган, енгил ва ўрта даражали ўткир ярали колит (ярали проктит) ни даволашда қўлланилади.

### **Қўллаш усули ва дозалари**

#### *Катталар ва кекса ёшдаги беморлар*

Согелен® 1 г суппозиторийсини кунига бир марта (кунига 1 г месалазинга эквивалент) тўғри ичакка (ректал) юборилади.

#### *Кичик ёшдаги беморлар*

Болаларда қўллаш бўйича кам тажриба ва чекланган маълумотлар мавжуд.

#### *Қўллаш усули*

Факат ректал (тўғри ичакка) юбориш учун.

Согелен® 1 г суппозиторийни асосан кечки уйқудан олдин қўллаш лозим.

Муваффақиятли даволаш мақсадида Согелен® 1 г суппозиторийларни мунтазам ва кетма-кет равишда қўллаш зарур.

#### *Даволашнинг давомийлиги*

Қўллашнинг давомийлиги шифокор томонидан белгиланади.

### **Ножўя таъсирлари**

Клиник тадқиқотларда синовдан ўтувчиларнинг тахминан 3% месалазин 1 г суппозиторийсини қўллаганда ножўя реакцияларни бошдан кечирганлар. Энг кўп учрайдиган ножўя реакциялар: бош оғриғи – тахминан 0,8% одамларда, ва ошқозон-ичаклардаги ножўя таъсирлари (тахминан 0,8% да - қабзият; 0,4% холларда – хар бирида кўнгил айнаши, қусиш ва қорин оғриғи.).

*Месалазинни қўллашда қуйидаги ножўя таъсирлар қайд этилган:*

<i>Органларнинг тизимли синфи</i>	<i>MedDRA конвенциясига мувофиқ частота</i>	
	<i>Кам ҳолларда (<math>\geq 1/10,000</math>; <math>&lt;1/1,000</math>)</i>	<i>Жуда кам ҳолларда (<math>&lt; 1/10,000</math>)</i>
Қон ва лимфа тизимининг бузилишлари		Қон кўрсаткичларининг бузилишлари (анемия, агранулоцитоз, панцитопения, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения)
Нерв тизимининг бузилишлари	Бош оғриғи, бош айланиши	Периферик нейропатия
Юрак бузилишлари	Миокардит, перикардит	

Нафас олиш, кўкрак қафаси ва кўкс оралигининг аъзолари томнидан бузилишлари		Ўпканинг аллергия ва фибротик реакциялари (шу жумладан, нафас қисилиши, йўтал, бронхоспазм, алвеолит, ўпка эозинофилияси, ўпка инфильтрацияси, пневмонит)
Меъда-ичак трактининг бузилишлари	Қорин оғриғи, диарея, метеоризм, кўнгил айниш, қусиш, қабзият	Ўткир панкреатит
Буйрак ва сийдик йўллариининг бузилишлари		Буйрак дисфункцияси, шу жумладан ўткир ва сурункали интерстициал нефрит ва буйрак етишмовчилиги
Тери ва тери ости ёғ қаватининг бузилишлари	Фотосенсибилизация	Алопеция
Мушак, скелет ва бириктирувчи тўқима бузилишлари		Миалгия, артралгия
Иммун тизимининг бузилишлари		Аллергик экзантема, доридан иситмалаш, тизимли кизил югириги синдроми, панколит каби ўта юқори сезувчанлик реакциялари
Жигар ва ўт чиқариш йўллариининг бузилишлари		Жигар функцияси кўрсаткичларининг ўзгариши (трансаминазалар ва холестаза кўрсаткичларининг ошиши), гепатит, холестатик гепатит
Репродуктив тизим ва кўкрак безининг бузилишлари		Олигоспермия (қайта тикланадиган ҳолат)

#### *Фотосенсибилизация*

Атопик дерматит ва атопик экзема каби тери касалликлари мавжуд бўлган беморларда янада жиддий реакциялар қайд этилгани ҳақида маълумотлар бор.

#### **Қўллаш мумкин бўлмаган ҳолатлар**

Согелен® 1 г суппозиторийлари қуйидаги беморларга қарши кўрсатилган:

- салицилатлар ёки дори таркибидаги ёрдамчи моддаларга маълум бўлган ўта юқори сезувчанлик;
- жигар ёки буйрак функцияларининг оғир бузилишларида қўллаш мумкин эмас.

#### **Дориларнинг ўзаро таъсири**

Ўзаро таъсири ўрганиш бўйича аниқ тадқиқотлар ўтказилмаган. Бир вақтнинг ўзида азатиоприн, 6-меркаптопурин ёки тиогуанин қабул қилаётган беморларда азатиоприн, 6-меркаптопурин ёки тиогуаниннинг миелосупрессив таъсирининг кучайиш эҳтимolini хисобга олиш керак. Месалазин варфариннинг антикоагулянт таъсирини камайтириши мумкинлиги ҳақида заиф далиллар мавжуд.

#### **Махсус кўрсатмалар**

Қон таҳлиллари (қоннинг дифференциал таҳлили; АЛТ ёки АСТ каби жигар функциясининг кўрсаткичлари; қон зардобининг креатинини) ва сийдик ҳолатини (сатҳини ўлчайдиган таёқчалар) даволовчи шифокорнинг қарорига биноан даволашдан

олдин ва даволаш пайтида аниклаш керак. Йўл-йўрик сифатида даволаш бошланганидан 14 кун ўтгач назорат текширувларини ўтказиш, сўнгра 4 ҳафта оралиги билан яна икки-учта синовни ўтказиш тавсия этилади.

Агар натижалар меъерий бўлса, кейинги синовлар ҳар 3 ойда ўтказилиши лозим. Агар кўшимча белгилар пайдо бўлса, ушбу синовларни дарҳол ўтказиш зарур. Жигар функциясининг бузилишлари бўлган беморлар эҳтиёткор бўлишлари керак. Согелен® 1 г суппозиторийларини буйрак функцияси бузилган беморларда қўллаш мумкин эмас.

Агар даволаш пайтида буйрак функцияси ёмонлашса, месалазин билан индуцирланадиган буйрак токсиклигини ҳисобга олиш лозим.

Ўпка касаллиги, хусусан, астмаси бўлган беморларни Согелен® 1 г суппозиторийлари билан даволаш курси давомида диққат билан кузатиб бориш зарур.

Анамнезида сульфасалазин таркибли препаратларга ножўя реакциялари бўлган беморлар Согелен® 1 г суппозиторийлари билан даволаш курси бошланганидан кейин жиддий тиббий назорат остида бўлишлари керак. Агар Согелен® 1 г суппозиторийлари, қориндаги спазмлар, қоринда ўткир оғрик, иситмалаш, кучли бош оғриғи ва тери тошмаси каби ўткир чидаб бўлмайдиган реакцияларни чақирса, даволаниш дарҳол тўхтатилиши лозим.

#### ***Ҳомиладорлик ва лактация даврида қўлланилиши***

##### ***Ҳомиладорлик***

Ҳомиладор аёлларда Согелен® 1 г суппозиторийлар қўлланилиши ҳақида ишончли маълумотлар йўқ. Бирок, таъсирига дучор бўлган ҳомиладорларнинг чекланган сони тўғрисидаги маълумотлар месалазиннинг ҳомиладорлик ёки ҳомила/янги туғилган чакалок саломатлигига салбий таъсир қилишини кўрсатмайди. Бугунги кунга қадар бошқа шунга мувофиқ бўлган эпидемиологик маълумотлар мавжуд эмас.

Бир ҳолатда, ҳомиладорлик вақтида месалазиннинг юқори дозасини (перорал 2-4 г) узок муддат қўлаганидан кейин, янги туғилган чакалоқда буйрак етишмовчилиги қайд қилинган.

Перорал месалазин қўлланганда хайвонларда ўтказилган тадқиқотларда ҳомиладорлик, эмбрионал/ҳомила ривожланиши, туғруқ ёки туғруқдан кейинги ривожланишга бевосита ёки билвосита салбий таъсир кўрсатиши қайд этилмаган.

Согелен® 1 г суппозиторийларини ҳомиладорлик вақтида, фақат потенциал фойда бўлиши мумкин бўлган хавфдан юқори бўлган тақдирда, қўллаш керак.

##### ***Лактация***

N-ацетил-5-аминосалицил кислотаси ва озроқ даражада месалазин она сути билан чиқарилади. Бугунги кунда эмизувчи аёлларда месалазин қўлланилишининг фақат чекланган тажрибаси мавжуд.

Гўдақда учрайдиган диарея сингари ўта юқори сезувчанлик реакцияларини истисно қилиш мумкин эмас. Шунинг учун, Согелен® 1 г суппозиторийларини эмизиш пайтида фақат потенциал фойда мумкин бўлган хавфдан юқори бўлган тақдирда қўллаш керак. Агар болада диарея кузатилса, эмизишни тўхтатиш лозим.

#### ***Автомобилни ва мураккаб механизмларни бошқариш қобилиятига таъсири***

Согелен® 1 г суппозиторийлари автотранспортни ҳайдаш ва механизмларни бошқариш қобилиятига таъсир кўрсатмайди ёки биров таъсир кўрсатади.

#### ***Дозанинг ошириб юборилиши***

Дозани ошириб юбориш тўғрисидаги чекланган маълумотлар мавжуд (масалан, месалазиннинг юқори перорал дозалари билан ўз жонига қасд қилиш), ва улар буйрак ёки жигарнинг токсиклигини кўрсатмайди. Махсус антидот йўқ, симптоматик ва тутиб турувчи даволаш.

**Чикарилиш шакли**

5 та суппозиторий ПВХ/ПЭ дан тайёрланган стрипда жойланган. 2 та стрипдан тиббиётда қўлланилишига доир йўриқномаси билан бирга картон ўрамда.

**Сақлаш шароити**

Қурук, ёруғликдан химояланган жойда, 25°C дан юқори бўлмаган ҳароратда сақлансин. Болалар ололмайдиган жойда сақлансин.

**Яроқлилиқ муддати**

2 йил.

Препарат яроқлилиқ муддати тугагандан сўнг қўлланилмасин.

**Дорихоналардан бериш тартиби**

Рецепт бўйича.

**Ишлаб чиқарувчи**

Kusum Healthcare Pvt. Ltd.

**Манзили**

SP-289(A), RIICO Industrial Area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), Ҳиндистон.

**Ўзбекистон Республикаси ҳудудида дори воситаларининг сифати бўйича эътирозларни (таклифлар) ни қабул қилувчи ташкилот номи ва манзили**

“BARAKA DORI FARM” МЧЖ ХК

Ўзбекистон Республикаси, 100100, Тошкент ш., Яккасарой тумани, Бобур кўчаси, 16 А уй.

Тел.: + (99878) 150-97-97, + (99878) 150-97-87

Уяли тел.: + (99893) 388 87 82

E-mail: [pv@kusum.uz](mailto:pv@kusum.uz)

Web-сайт: [kusum.uz](http://kusum.uz)