

# Asalit®

mesalazina

## FORMAS FARMACÊUTICAS E APRESENTAÇÕES

**Supositório** - Embalagem contendo 10 supositórios.

### USO RETAL - ADULTO

**Enema** - Embalagem contendo um envelope com 3 g de pó e um frasco com 100 ml de solução diluente.

### USO RETAL - ADULTO

**Comprimido revestido** - Embalagem contendo 20 comprimidos revestidos de 400 mg.

### USO ORAL - ADULTO

## COMPOSIÇÃO

### Supositório

**Cada supositório contém:**

mesalazina .... 250 mg

Excipientes: lecitina de soja, triglicerídeos neutros de ácidos graxos vegetais.

### Enema

**Cada envelope com 3 g de pó contém:**

mesalazina ..... 3 g

O diluente contém os seguintes excipientes: água, cloreto de sódio, fosfato de sódio dibásico, fosfato de sódio monobásico, hietelose, metilparabeno, propilparabeno.

### Comprimidos revestidos

**Cada comprimido revestido de 400 mg contém:**

mesalazina .... 400 mg

Excipientes: amidoglicolato de sódio, dibutilftalato, estearato de magnésio, lactose, macrogol, óxido de ferro amarelo, óxido férrico, copolímero de ácido metacrílico, povidona, dióxido de silício, talco.

## INFORMAÇÕES AO PACIENTE

### Ação esperada do medicamento

O produto, em suas diferentes formas de apresentação, é utilizado no tratamento das doenças inflamatórias intestinais.

### Cuidados de armazenamento

**Conservar em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C). Proteger da luz e umidade.**

### Prazo de validade

Ver embalagem externa. Não utilizar os produtos se os prazos de validade estiverem vencidos, pois isso reduz ou anula sua ação.

### Gravidez e lactação

A utilização do produto por gestantes e mulheres que estejam amamentando só deve ser feita em caso de extrema necessidade. Informe seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando.

### Cuidados de administração

O enema é preparado adicionando-se ao frasco com a solução diluente o pó contido no envelope. Uma vez pronto, o enema deve ser usado imediatamente. Não é recomendável guardar enemas

preparados, para posterior utilização. Os comprimidos devem ser ingeridos inteiros (sem mastigar), com um pouco de líquido, longe do horário das refeições. Siga a orientação de seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

### **Interrupção do tratamento**

Não interromper o tratamento sem o conhecimento de seu médico.

### **Reações adversas**

**Em alguns pacientes podem ocorrer durante o tratamento com o produto dores de barriga e cabeça, enjôos, flatulência e vômitos, de pouca intensidade e passageiros. Mais raramente, foram observados mal-estar, cansaço, prisão de ventre, dor nas juntas, garganta irritada, febre, tonteira, coceira, erupções cutâneas, pernas inchadas e perda de cabelo. Além dessas reações, o uso dos supositórios e enemas pode provocar dor, queimação ou coceira no reto e piora de hemorróidas. Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis.**

- **TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.**

### **Ingestão concomitante com outras substâncias**

Os comprimidos não devem ser ingeridos junto com as refeições.

### **Contra-indicações e Precauções**

O uso do produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido está **contraindicado para pessoas com reconhecida hipersensibilidade aos salicilatos ou a qualquer um dos excipientes. A utilização do produto por gestantes e mulheres que estejam amamentando só deve ser feita em caso de extrema necessidade.**

- **NÃO USE MEDICAMENTO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SUA SAÚDE.**

## **INFORMAÇÕES TÉCNICAS**

### **Características**

O produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido contém, em sua fórmula, a mesalazina (ácido 5-aminossalicílico), substância que compõe a molécula da sulfasalazina e é a responsável por sua ação terapêutica em casos de doenças inflamatórias intestinais. É desconhecido o mecanismo de ação da mesalazina (ácido 5-aminossalicílico), que parece, no entanto, ser tópico e não sistêmico. Nos pacientes com doenças inflamatórias intestinais crônicas, observa-se aumento da produção, pela mucosa do intestino, de metabólitos do ácido araquidônico, tanto pela via da ciclooxigenase (prostanóides), quanto pela via da lipoxigenase (leucotrienos e ácidos hidroxiicosatetranoícos). É possível que o ácido 5-aminossalicílico diminua a inflamação bloqueando a ciclooxigenase e inibindo a produção de prostaglandina pela mucosa colônica.

Em seguida à administração oral de formulações convencionais de mesalazina esta é extensivamente absorvida do trato gastrointestinal superior, com pequena quantidade da droga alcançando o cólon. Por isso que os comprimidos de ASALIT®, revestidos com uma resina de base acrílica, são formulados de tal forma a liberar a maior parcela da droga ingerida somente no íleo terminal e cólon. Entre 20 e 50% da mesalazina contida nos comprimidos de ASALIT® são absorvidos após ingestão oral, ficando a quantidade restante disponível para ação tópica e excreção nas fezes; esta absorção encontra-se algo diminuída em pacientes com doença intestinal inflamatória aguda. A mesalazina administrada por via retal (supositórios ou enemas) é muito pouco absorvida do cólon, e a extensão dessa absorção dependente, em grande parte, do tempo de retenção do produto, é considerada uma variável individual, atingindo de 10 a 20% da droga administrada. É excretada principalmente nas fezes durante os subseqüentes movimentos intestinais. A mesalazina absorvida é rápida e quase completamente acetilada na mucosa intestinal e no fígado. Admite-se que seu metabólito, o ácido acetil-5-aminossalicílico tenha, ele próprio, alguma atividade. A mesalazina encontra-se 40 a 50% ligada às proteínas plasmáticas e seu metabólito, 80%. O metabólito acetilado é excretado principalmente na urina por secreção tubular, junto com traços da droga inalterada. A meia-vida de eliminação da mesalazina é de cerca de 1

hora e de seu metabólito, 10 horas. Somente quantidades muito pequenas de mesalazina atravessam a placenta ou estão presentes no leite materno.

### **Indicações**

O produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido está indicado como antiinflamatório para reduzir as reações inflamatórias que acometem a mucosa do cólon e do reto, nas fases agudas da retocolite ulcerativa idiopática. É também utilizado para prevenir ou reduzir as recidivas dessa enfermidade. Na forma de comprimido revestido, está também indicado no tratamento das fases agudas da doença de Crohn.

### **Contra-indicações**

O produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido está contra-indicado para pacientes com reconhecida hipersensibilidade aos salicilatos ou a qualquer um dos excipientes.

### **Precauções e Advertências**

Não está estabelecida a segurança do emprego da mesalazina (ácido 5-aminossalicílico) durante a gravidez. Estudos feitos em animais não revelaram efeitos embriotóxicos ou teratogênicos. Uma vez que os estudos sobre a reprodução em animais não são preditivos da resposta em humanos, o produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido, em princípio não deve ser empregado em gestantes, exceto quando absolutamente indispensável. Ainda que as quantidades de mesalazina detectadas no leite humano sejam muito pequenas, via de regra, mulheres que estejam usando o produto não devem amamentar. Não está estabelecida a segurança de uso do produto em crianças. O produto na forma de supositório, enema e comprimido revestido deve ser usado com extrema cautela em pacientes hepato e nefropatas. Esses últimos, durante a utilização do produto, devem fazer, periodicamente, exames de urina e avaliações de creatininemia.

### **Interações medicamentosas**

São considerados como possíveis o aumento do efeito hipoglicemiante das sulfoniluréias e o da ação ulcerogênica dos corticoesteróides. Não se pode excluir a possibilidade de interações com cumarínicos, metotrexato, probenecide, sulfinpirazona, espironolactona, furosemida e rifampicina. A mesalazina pode inibir o metabolismo de tiopurinas antineoplásicas, tais como a azatioprina e a mercaptopurina.

### **Reações adversas**

Provavelmente porque a taxa de absorção da mesalazina não é absoluta, seja quando administrada por via oral sob a forma de comprimidos com revestimento entérico (de 20 a 50% da dose administrada é absorvida), seja quando administrada por via retal, sob a forma de supositórios ou enemas (somente de 10 a 20% das doses administradas são absorvidas), o produto é, geralmente, bem tolerado, e as reações adversas a ele tendem a ser leves e transitórias. Ocasionalmente podem ocorrer cefaléia, distúrbios gastrointestinais (tais como flatulência, náusea, diarreia e dor abdominal) e reações de hipersensibilidade (prurido, exantema, broncoespasmo, febre medicamentosa). Alguns pacientes podem experimentar exacerbação dos sintomas de colite. Menos comumente podem ocorrer vertigens, dores articulares, astenia, e edema periférico. Raramente podem ocorrer nefrotoxicidade, complicações pulmonares (alveolite), hepatite, anemia aplástica, agranulocitose, leucopenia, neutropenia, trombocitopenia, miocardite, pancreatite, neuropatia periférica e acentuação da queda de cabelos. E muito raramente pode ocorrer síndrome lupóide. O uso dos supositórios e enemas pode determinar dor, prurido ou urência ano-retal e exacerbação de hemorroidas.

### **Posologia**

#### **Supositório - via retal**

Na fase aguda, recomendam-se 2 a 4 supositórios de 250 mg ao dia. Com a remissão da sintomatologia clínica, preconiza-se, como dose de manutenção, na dependência da resposta

individual, um supositório ao dia, em dias alternados ou mais espaçadamente. A literatura especializada relata casos de uso de até 3 g (12 supositórios) ao dia, em doses divididas.

#### **Enema - via retal**

Está indicado no tratamento dos surtos ativos da retocolite ulcerativa idiopática, principalmente nos casos em que há comprometimento de áreas extensas do cólon.

Usualmente recomenda-se a aplicação ao dia de 1 enema de 3 g, até que haja remissão total da doença, tanto clinicamente quanto ao exame proctológico, o que em geral ocorre entre 14 e 21 dias. O enema de 3 g é preparado adicionando-se ao frasco com a solução diluente o pó contido no envelope. Para correta administração do enema, recomenda-se que o paciente se deite sobre seu lado esquerdo, com a perna direita flexionada sobre a esquerda estendida. A administração deve ser realizada lentamente (5 a 10 minutos no mínimo), permanecendo o paciente na posição de decúbito lateral esquerdo durante 30 minutos, a fim de que o fluido se distribua uniformemente pelo cólon esquerdo. Todo esforço deve ser feito no sentido de reter o enema pelo prazo mínimo de 1 hora. Isso pode ser facilitado, administrando-se previamente sedativos e/ou medicação antiespasmódica, especialmente no início do tratamento, quando é maior o impulso para evacuar.

#### **Comprimido revestido - via oral**

Como tratamento de ataque, 1 a 2 comprimidos de 400 mg 3 vezes ao dia, ou a critério médico. Nos casos mais graves, a posologia pode ser aumentada para 10 comprimidos de 400 mg ao dia. Na terapia inicial, recomenda-se atingir a posologia plena após alguns dias de tratamento, aumentando-se gradualmente a dose. Durante a fase ativa da doença, a duração do tratamento é, em média, de 6 a 12 semanas, podendo variar, a critério médico, segundo a evolução clínica do paciente. Para evitar recidivas, é aconselhável a adoção de tratamento a longo prazo, reduzindo-se gradualmente a posologia utilizada na fase ativa da doença. Os comprimidos devem ser ingeridos inteiros, longe do horário das refeições.

#### **Superdose**

Não existem relatos de superdose pela mesalazina (ácido 5-aminossalicílico). No caso de reações adversas intensas, suspender o uso do produto e tratar sintomaticamente. As reações de hipersensibilidade devem ser tratadas com antialérgicos e/ou corticóides. Na ingestão de dose excessiva, realizar lavagem gástrica e infusão de solução eletrolítica. Não se conhece antídoto específico.

#### **Pacientes idosos**

Recomenda-se cautela quando do uso em pacientes idosos.

- **VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA.**

- Nº do lote, data de fabricação e prazo de validade: vide embalagem externa.

M.S. 1.0089.0168

Farm. Resp.: Marcos A. Silveira Jr. - CRF-RJ nº 6403

#### **Comprimidos de 400 mg**

Importado por: **MERCK S.A.**

Fabricado por: GIULIANI S.p.A. Milão - Itália

#### **Enema de 3 g (pó + diluente);**

**MERCK S.A.**

CNPJ 33.069.212/0001-84

Estrada dos Bandeirantes, 1099

Rio de Janeiro - RJ - CEP 22710-571

Indústria Brasileira

#### **Supositório**

**MERCK S.A.**

CNPJ 33.069.212/0001-84

Estrada dos Bandeirantes, 1099

Rio de Janeiro - RJ - CEP 22710-571

Indústria Brasileira

Fabricado por:

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.

Rodovia Presidente Dutra, Km 222,2 - Guarulhos - SP

