

FOLLETO PARA EL PROFESIONAL
MECOLZINE COMPRIMIDOS CON RECUBRIMIENTO ENTÉRICO 500 mg

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

MECOLZINE COMPRIMIDOS CON RECUBRIMIENTO ENTÉRICO 500mg

2. COMPOSICION CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Mecolzine 500 mg comprimidos con recubrimiento entérico.

Excipientes con efecto conocido

Mecolzine 500 mg comprimidos con recubrimiento entérico:
Cada comprimido contiene 2,13 mmoles de sodio (49 mg).

Para consultar la lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Mecolzine se presenta en forma de comprimidos con recubrimiento entérico.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

Mecolzine Comprimidos con recubrimiento entérico 500 mg está indicado en:

- Tratamiento de procesos inflamatorios del intestino (colitis ulcerativa, Enfermedad de Crohn) de carácter ligero a moderado.

4.2. Posología y forma de administración

Posología

Durante la fase inflamatoria aguda y en la terapia de mantenimiento a largo plazo, el paciente debe seguir rigurosamente el tratamiento establecido por el médico para asegurar el efecto terapéutico deseado.

La dosificación deberá ajustarse en función de la respuesta del paciente. Se recomienda la siguiente dosificación:

Tratamiento de los procesos agudos.

Adultos: Vía oral Mecolzine comprimidos con recubrimiento entérico 500mg.

Durante la fase aguda 1,5 a 2g (3 a 4 comprimidos por día) divididos en 3 tomas (cada 8 horas).

Niños desde 6 años en adelante: 20-30 mg/kg diarios divididos en 3 tomas diarias (cada 8 horas).

Tratamiento profiláctico de las recidivas

Adultos: Por lo general 1,5 a 2g (3 a 4 comprimidos) divididos en dos o tres tomas diarias.

Niños de 6 años en adelante: 20-30 mg/kg de peso divididos en tres tomas diarias (cada 8 horas).

Población de edad avanzada

La administración de Mecolzine en pacientes de edad avanzada debe realizarse con precaución y siempre limitada a aquellos pacientes con la función renal normal.

Población pediátrica

Mecolzine no está recomendado para uso en niños menores de 6 años debido a la ausencia de datos sobre seguridad y eficacia.

Forma de administración

Mecolzine 500 mg comprimidos con recubrimiento entérico:

Los comprimidos deben administrarse antes de las comidas y deben ingerirse enteros con ayuda de líquido.

4.3. Contraindicaciones

- Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes.
- Antecedentes de hipersensibilidad a los salicilatos.
- Úlcera duodenal o gástrica.
- Diátesis hemorrágica.
- Insuficiencia hepática o renal grave
- Niños menores de 6 años de edad

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo

La administración de Mecolzine debe efectuarse con precaución en los siguientes casos:

- Pacientes con insuficiencia hepática o renal grave. Dado que el 5-ASA se elimina fundamentalmente mediante acetilación y posterior excreción urinaria, los pacientes con función renal alterada o insuficiencia renal deben ser vigilados estrechamente, por lo que es conveniente realizar pruebas de función hepática y renal antes de la instauración del tratamiento y periódicamente durante el mismo.
- Pacientes con historia de hipersensibilidad a sulfasalazina; si bien, en general, parece que las reacciones de hipersensibilidad a mesalazina son menos frecuentes que las observadas con sulfasalazina.
- No debe administrarse Mecolzine comprimidos concomitantemente con laxantes del tipo de la lactulosa o similares, ya que disminuye el pH de las heces y pueden impedir la liberación del principio activo.
- Se han notificado casos de nefrolitiasis con el uso de mesalazina, lo que incluye la aparición de cálculos con un contenido de mesalazina del 100%. Se recomienda garantizar una ingesta suficiente de líquidos durante el tratamiento.

Advertencias sobre excipientes

- Mecolzine comprimidos contiene 2,13 mmoles (49 mg) de sodio por comprimido, lo que deberá tenerse en cuenta en el tratamiento de pacientes con dietas pobres en sodio.

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

En común con otros salicilatos, mesalazina puede:

- Potenciar el efecto de los anticoagulantes cumarínicos.
- Potenciar el efecto reductor de la glucemia de las sulfonilureas.
- Antagonizar los efectos uricosúricos de probenecid y sulfinpirona.
- Manifestar la toxicidad de los salicilatos a dosis más bajas de las habituales cuando se administra simultáneamente con furosemida debido a la competencia por los lugares de excreción renal.
- Disminuir el efecto natriurético de espironolactona.
- Mesalazina puede retrasar la excreción de metotrexato.
- Los laxantes del tipo lactulosa o similares pueden impedir la liberación de mesalazina desde el comprimido lo que reduciría su efecto (ver apartado 4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo).

4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia

No existen datos suficientes sobre la utilización de Mecolzine durante el embarazo o la lactancia. Dado que mesalazina es un salicilato, Mecolzine no debería utilizarse durante el embarazo ni la lactancia, excepto si fuese claramente necesario.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No hay indicios de que Mecolzine tenga efecto sobre la capacidad para conducir vehículos o utilizar maquinaria.

4.8 Reacciones adversas

Se enumeran a continuación las reacciones adversas notificadas con mesalazina, clasificadas por órganos o sistemas y frecuencias de presentación. Las frecuencias se definen como: muy frecuentes ($\geq 1/10$), frecuentes ($\geq 1/100$ y $< 1/10$), poco frecuentes ($\geq 1/1.000$ y $< 1/100$), raras ($\geq 1/10.000$ y $< 1/1.000$), muy raras ($< 1/10.000$) y frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

En raras ocasiones, se han descrito las siguientes reacciones adversas:

Trastornos gastrointestinales: náuseas, dolor abdominal, diarrea, pancreatitis.

Trastornos del sistema nervioso: cefalea, neuropatía.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo: enrojecimiento (incluyendo prurito y urticaria), irritación local, (formas rectales), fotosensibilidad*.

Con frecuencia desconocida se ha descrito la aparición de eritema multiforme, síndrome de Stevens Johnson y necrólisis epidérmica tóxica.

Trastornos renales y urinarios: trastornos renales, nefritis intersticial aguda y crónica, insuficiencia renal.

Con frecuencia no conocida: nefrolitiasis (véase la sección 4.4 si desea más información).

Trastornos hepatobiliares: elevaciones transitorias de las enzimas hepáticas, hepatitis.

Trastornos de la sangre y del sistema linfático: leucopenia, neutropenia, trombocitopenia, anemia aplásica.

Trastornos del sistema inmunitario: reacciones de hipersensibilidad incluyendo cambios pulmonares y cardíacos: fiebre, mialgia, artralgia, alveolitis, miocarditis, pericarditis.

En muy raras ocasiones, se ha observado exacerbación de los síntomas de colitis.

*Fotosensibilidad

Se han notificado reacciones más graves en pacientes con afecciones cutáneas preexistentes, como dermatitis atópica y eccema atópico.

Notificación de sospechas de reacciones adversas

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento

4.9 Sobredosis

En caso de ingestión masiva de los comprimidos, el tratamiento consiste en lavado gástrico, inducción al vómito, junto con medidas sintomáticas y de apoyo. No existe antídoto específico.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Ácido aminosalicílico y similares, código ATC: A07EC02

Mesalazina es uno de los dos componentes de la sulfasalazina, siendo el otro la sulfapiridina. Mientras que la mesalazina es la fracción activa, la sulfapiridina es la responsable de la mayoría de los efectos adversos asociados con la terapia con sulfasalazina.

Mecanismo de acción

Aunque se desconoce el mecanismo de la acción antiinflamatoria del 5-ASA se esgrimen varias posibilidades:

- Inhibición de la síntesis de prostaglandinas (vía inhibición de la ciclooxigenasa), reduciendo la producción de prostaglandinas inflamatorias.
- Inhibición de la síntesis de leucotrienos quimiotácticos (vía inhibición de la lipooxigenasa), reduciendo por tanto la inflamación.
- Inhibición de la quimiotaxis de macrófagos y neutrófilos en el tejido inflamado.

Los datos más recientes sugieren que el 5-ASA es un antioxidante biológico y su actividad está basada en la captación de radicales libres del oxígeno. En esta actividad, el 5-ASA se diferencia de la sulfasalazina, sulfapiridina, N-acetil-5-ASA (Ac-5-ASA) y otros salicilatos.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Absorción

Administración oral. Tras la administración de dosis orales de 500 mg de mesalazina tres veces al día a pacientes con colitis ulcerosa o enfermedad de Crohn, las concentraciones plasmáticas medias en el estado estacionario de 5-ASA y Ac-5-ASA (metabolito mayoritario) son de 0,7µg/ml y 1,2 µg/ml, respectivamente. Los niveles máximos en plasma con las formas de liberación retardada se obtienen a

las 5 horas de la ingesta. La recuperación (a la dosis más elevada) en orina (44%) y en heces (35%) indica que el 5-ASA está disponible para su acción local y sistémica. En sujetos sanos en ayunas, el pico de concentración plasmática de 1,3 µg/ml y 2,3 µg/ml de 5-ASA y Ac-5-ASA respectivamente, se obtuvo a las 6 horas de su administración.

Acetilación

La acetilación de 5-ASA ocurre en el hígado y en la pared del colon, independientemente del estado del acetilador. Parece que el proceso de acetilación es saturable; sin embargo, a dosis terapéuticas (250-500 mg) ni la concentración plasmática máxima, ni el área bajo la curva de concentración plasmática frente al tiempo para 5-ASA mostraron ninguna desviación de la linealidad de la dosis en estado de equilibrio.

Eliminación

Tras la administración oral, el 5-ASA se elimina en un alto porcentaje como Ac-5-ASA, tanto en orina como en heces. De hecho, más del 90% del fármaco detectado en la orina está en forma de metabolito.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Los datos de los estudios preclínicos no muestran riesgos especiales para los seres humanos según los estudios convencionales de farmacología de seguridad, toxicidad a dosis repetidas, genotoxicidad, potencial carcinogénico, toxicidad para la reproducción.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Mecolzine 500 mg comprimidos:

Carbonato de sodio,

Glicina,

Celulosa microcristalina,

Croscarmelosa de sodio

Dióxido de silicio coloidal,

estearato de calcio,

Povidona,

Dibutilsebacato

Talco

Dióxido de titanio (E-171),

Polietilenglicol 6000,

Óxido de hierro amarillo (E-172),

Óxido de hierro rojo (E-172),

Alcohol isopropílico.

Mezcla de copolímero ácido metacrílico y acrilato de etilo (1:1) (Eudragit L-30D)

Mezcla de Copolímero ácido metacrílico y metacrilato de metilo (1:1) (Eudragit L-12,5P) Mezcla de

Copolímero ácido metacrílico y metacrilato de metilo (1:2) (Eudragit S-12,5P), c.s.

6.2. Incompatibilidades

No aplicable

6.3. Periodo de validez

Mecolzine 500 mg comprimidos: 4 años.

6.4. Precauciones especiales de conservación

Mecolzine 500 mg comprimidos

No requiere condiciones especiales de conservación.

6.5. Naturaleza y contenido del envase

Mecolzine 500 mg comprimidos. Envase con 100 comprimidos recubiertos.

6.6. Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local.