

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

MESALAZINA (ÁCIDO 5-AMINOSALICÍLICO)

Sinónimos:	Mesalamina. Fisalamina.
Formula Molecular:	$C_7H_7NO_3$
Peso Molecular:	153,14
Datos Físico-Químicos:	Polvo o cristales de color casi blanco, gris claro o rosa claro. Muy poco soluble en agua, prácticamente insoluble en etanol al 96 %. Se disuelve en disoluciones diluidas de hidróxidos alcalinos y en HCl diluido. Punto de fusión: aprox. 280 °C.
Propiedades y usos:	<p>La mesalazina es un fármaco antiinflamatorio relacionado desde un punto de vista estructural con los salicilatos y activo en la enfermedad inflamatoria intestinal. Se considera que es la mitad de activa que la sulfasalazina. De hecho es la parte activa de la molécula de sulfasalazina. Su mecanismo de acción es dudoso, pero se debería, como mínimo en parte, a su capacidad para inhibir la síntesis de prostaglandinas y leucotrienos locales en la mucosa gastrointestinal.</p> <p>Se absorbe ampliamente en el tubo digestivo superior, por lo que el fármaco prácticamente no alcanza el colon. La porción absorbida se acetila casi por completo en la pared intestinal y en el hígado a acetil-5-aminosalicílico. El metabolito acetilado se excreta principalmente por la orina. La semivida de eliminación es de aprox. 1 h. Se une en un 40 – 50 % a proteínas plasmáticas. Sólo atraviesan la barrera placentaria y pasan a leche materna cantidades insignificantes de mesalazina.</p> <p>La mesalazina se administra por vía oral o rectal (supositorios, enemas) en el tratamiento de los episodios agudos de la colitis ulcerosa aguda de leve a moderada, o para el mantenimiento de la remisión de la colitis ulcerosa o de la enfermedad de Crohn.</p> <p>Aplicado en la mucosa bucal, tiene acción contra las úlceras aftosas.</p>
Dosificación:	Vía oral o rectal, a la dosis de 0,75 – 4 g/día. Vía bucal, al 4 – 5 %.
Efectos secundarios:	<p>Produce cefalea y alteraciones digestivas como náuseas, diarrea, y dolor abdominal.</p> <p>En ocasiones se producen reacciones de hipersensibilidad.</p> <p>Algunos pacientes experimentan una exacerbación de los síntomas de colitis.</p> <p>Se han publicado casos de miocarditis, pericarditis, pancreatitis, nefritis intersticial, síndrome nefrótico, reacciones pulmonares alérgicas, aumento de los valores de las enzimas hepáticas, hepatitis, síndrome de tipo lúpico, alopecia, mialgias, y artralgias.</p> <p>Rara vez se han descrito alteraciones hemáticas, como anemia</p>

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

aplasica, agranulocitosis, leucopenia, neutropenia, trombopenia, y metahemoglobinemia.

Contraindicaciones: Pacientes con insuficiencia renal o hepática grave, o hipersensibilidad a los salicilatos.

Precauciones: Debe utilizarse con precaución en individuos de edad avanzada y en caso de insuficiencia renal o hepática de leve a moderada, úlcera péptica activa, o alergia a la sulfasalazina. Si se sospecha una discrasia sanguínea, debe interrumpirse de inmediato el tratamiento y realizar un hemograma completo. Los pacientes o sus cuidadores han de reconocer los signos de toxicidad hemática, y se les aconseja que soliciten atención médica inmediata si aparecen síntomas como fiebre, faringitis, úlceras bucales, equimosis o hemorragia. Se ha recomendado controlar la función renal durante el tratamiento.

Interacciones: Los preparados formulados para liberar mesalazina en el colon no deben administrarse con fármacos como la lactulosa, que disminuye el pH, ya que impiden la liberación de mesalazina.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Excipiente adhesivo oral para úlceras aftosas

Mesalazina 5 %
Excipiente Acofar adhesivo oral c.s.p. 20 g

Mesalazina suspensión oral 100 mg/ml

Mesalazina 10 g
Acido cítrico monohidrato 0,63 g
Sodio citrato dihidrato 4,7 g
Sodio ascorbato 0,05 g
Carboximetilcelulosa sódica 0,54 g
Veegum HV 0,54 g
Nipagín 0,07 g
Sacarosa 30 g
Saborizante c.s
Agua purificada c.s.p..... 100 ml

Modus operandi:

Calentar el agua purificada a unos 80 °C y disolver el Nipagín, ácido cítrico, sodio citrato, y sacarosa. Dispensar la carboximetilcelulosa sódica y el Veegum HV. Incorporar la mesalazina en cantidades suficientes de la mezcla anterior hasta formar una pasta fina. Ajustar a volumen final con agua purificada.

Conservación: aprox. 14 días a temperatura ambiente.

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Formulación magistral de medicamentos*, COF de Vizkaia, 5ª ed. (2004).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).
- *Formulario médico farmacéutico*, PharmaBooks, 2010.
- *Preparações Oraís Líquidas*, Anderson de Oliveira Ferreira y Gilberto Fernandes de Souza. 3ª edição. 2011.