

Состав

действующее вещество: diacerein;

1 капсула содержит диацереину 50 мг

вспомогательные вещества: циклодекстрины, натрия лаурилсульфат, лактоза, натрия кроскармеллоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат

состав капсулы: бриллиантовый синий (E 133), Понсо 4R (E 124), хинолин желтый (E 104), титана диоксид (E 171), натрия лаурилсульфат, метилпарагидроксибензоат (E 218), пропилпарагидроксибензоат (E 216), желатин.

Лекарственная форма

Капсулы.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы № 1 с корпусом голубого и крышечкой темно-синего цвета, содержащие порошок светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные средства. Код АТХ M01A X21.

Фармакодинамика

Диацереин - это лекарственное средство для лечения остеоартрита, который имеет анальгезирующее, антипиретические и противовоспалительные свойства. Диацереин классифицируется как медленно действующий средство, эффект которого проявляется в течение 2-4 недель лечения и достигает клинической значимости после 4-6 недель. Он имеет оригинальный механизм действия, отличающийся от механизма действия нестероидных противовоспалительных средств (НПВС). Диацереин, как и его активный *rhein* - метаболит, ингибирует синтез и активность интерлейкина-1 (IL-1), что играет ведущую роль в патогенезе остеоартрита и одновременно повышает выработку трансформирующего фактора роста β (TGF- β), который инициирует пролиферацию хондроцитов и стимулирует выработку коллагена II, протеогликанов и гиалурона.

В отличие от НПВС диацереин не ингибируется синтез простагландинов и, следовательно, не имеет гастродуоденальных побочных эффектов.

Фармакокинетика

Абсорбция диацереина замедляется при одновременном применении с пищей, также связано с увеличением количества абсорбированной вещества на 25%. С другой стороны, возникновение побочных эффектов, таких как увеличение времени кишечного транзита, напрямую связано с количеством неабсорбированного диацереина, поэтому применение препарата натощак приводит к повышению риска побочных эффектов. Диацереин полностью конвертируется в rhein-метаболит путем деацелирования перед попаданием в центральное кровообращение. Биодоступность rhein-метаболита составляет 35-56%. Объем распределения - около 13,2 л. Rhein-метаболит связывается с белками плазмы почти на 99%, однако эта связь не является стабильным. Rhein-метаболит или выводится почками в неизмененном виде (20%), или конъюгируется в печени до rhein-глюкуронида (60%) или rhein-сульфата (20%), которые также выводятся с мочой. Период полувыведения составляет примерно 7-8 часов.

У пациентов пожилого возраста не отмечалось каких-либо изменений фармакокинетических свойств диацереина.

Показания

Лечение пациентов с симптомами остеоартрита бедра или колена, с отложенным эффектом.

Лечение диацереина не рекомендуется пациентам с быстро прогрессирующим остеоартритом тазобедренного сустава, поскольку они могут иметь слабую реакцию к диацереину.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к компонентам препарата или к производным антрахинона в анамнезе.
- Болезни печени, имеющиеся или в анамнезе.
- воспалительные кишечные заболевания (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона).
- Кишечная непроходимость или псевдонепроходимость.
- Боль в животе неопределенного происхождения.
- период беременности и кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Прием диацереина может привести к возникновению диареи и гипокалиемии. При одновременном применении диацереину диуретики (петлевые и тиазидные) и / или сердечными гликозидами (дигитоксин, дигоксин) увеличивается риск возникновения аритмии.

Одновременный прием с антацидами (алюминий, соли кальция и магния, такие как оксиды и гидроксиды) значительно уменьшает всасывание диацереина из пищеварительного тракта. Таким образом, между приемом антацидов и диацереина должно быть интервал 1-2 часа.

Не наблюдалось взаимодействий на связывание белков плазмы крови Реино (активный метаболит диацереина) с варфарином, парацетамолом, салициловой кислотой, индометацином, ибупрофеном, диклофенаком, фенбуфеном, флурбипрофен, напроксен, фенилбутазоном, пироксикамом, сулиндаком, теноксикамом, вальпроатом натрия, фенитоином, тольбутамидом, глибенкламидом или хлорпропрамидом.

Одновременное применение диацереина и блокатора H₂-рецепторов (циметидина) не приводит к модификации фармакокинетических параметров реину в плазме крови и мочи.

Особенности применения

Диарея. Длительный прием диацереина приводит к диарее, которая может привести к обезвоживанию и гипокалиемии. В случае возникновения диареи следует прекратить лечение диацереина и проконсультироваться с врачом относительно альтернативных вариантов лечения.

Следует с осторожностью применять пациентам, которые принимают диуретики, в связи с возможным возникновением обезвоживания и гипокалиемии. Особую осторожность следует также проявлять при гипокалиемии у больных, получавших сердечные гликозиды (дигитоксин, дигоксин) (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Следует избегать одновременного приема с слабительными лекарственными средствами.

Гепатотоксичность. При применении диацереина возможно повышение уровня печеночных ферментов в сыворотке крови и симптоматическое острое

поражение печени (см раздел «Побочные реакции»).

Перед началом лечения диацереину пациента следует расспросить о возможных сопутствующие заболевания, заболевания печени наличные или в анамнезе) и обследовать. Диагностирована болезнь печени является противопоказанием к применению диацереину (см. Раздел «Противопоказания»).

Необходим контроль признаков повреждения печени в течение первых 2 месяцев лечения. Также следует проявлять осторожность при применении диацереину одновременно с другими лекарственными средствами, ассоциируется с возможными поражениями печени. Пациентам следует рекомендовать ограничить употребление алкоголя во время лечения диацереина.

Лечение диацереина нужно прекратить в случае повышения уровня печеночных ферментов или выявления признаков поражения печени, включая неврологические симптомы. В случае появления симптомов поражения печени следует немедленно обратиться к врачу.

В связи с поздним началом действия (через 2-4 недели) препарата в течение первого месяца лечения диацереину можно сочетать с применением нестероидных противовоспалительных препаратов и анальгетиков.

Метаболиты диацереина могут оказывать мочи от коричневого до красного цвета в зависимости от pH это изменение цвета не имеет клинического значения, но может влиять на результаты диагностических тестов на основе колориметрии (глюкозные мочевые палочки).

Поскольку окраски мочи может маскировать микрогематурию, лабораторный анализ функции почек, в том числе исследования осадка мочи, следует проводить регулярно, особенно если Орцерин применять в течение длительных периодов.

Орцерин, капсулы, содержащие лактозу. Пациентам с редкой наследственной чувствительностью к галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует принимать Орцерин.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Нет сообщений о влиянии диацереина на способность управлять автотранспортом или работе с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Из-за отсутствия данных применять Орцерин в период беременности противопоказано.

Диацереин не следует принимать кормящим грудью, поскольку незначительное количество препарата обнаруживается в грудном молоке.

Способ применения и дозы

Лечение должны начинать только врачи, имеющие опыт лечения остеоартрита.

В течение первых 2-4 недель лечения взрослые принимают по 1 капсуле (50 мг) вместе с вечерним приемом пищи, запивая водой. С 2-4-й недели лечения дозу препарата увеличивают до 100 мг в сутки в 2 приема (по 1 капсуле утром и вечером во время еды). Диацереин имеет медленную с задержкой начальную активность и эффект остаточного действия после прекращения лечения, в результате чего Орцерин следует применять в течение как минимум 2-4 недель до появления первого положительного эффекта. Положительная симптоматическая действие сохраняется в течение 3-х месяцев после периода применения. Учитывая природу заболевания, рекомендуется длительный курс лечения - не менее 3 месяцев, который можно повторить, если появляются симптомы.

Продолжительность курса лечения устанавливает врач индивидуально.

Пациенты пожилого возраста

Диацереин не рекомендуется пациентам в возрасте от 65 лет в связи с тем, что эта категория является более уязвимой к осложнениям, связанных с диареей.

Существенных изменений фармакокинетических параметров при применении диацереина пациентов пожилого возраста не выявлено, поэтому не нуждается в применении рекомендуемой дозы (см раздел «Фармакодинамика»). Однако необходима осторожность при назначении Орцерину пациентам пожилого возраста. При возникновении диареи следует прекратить лечение диацереина.

Пациенты с хронической почечной недостаточностью

Пациентам с легкой и умеренной почечной недостаточностью нет необходимости изменять обычную рекомендованную дозу. Однако для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <30 мг / мл) суточную дозу следует уменьшить на 50% от рекомендованной дозы (что соответствует 50 мг в сутки).

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата у детей в возрасте до 18 лет не были установлены.

Передозировка

При случайном или преднамеренном приеме больших доз диацереина может возникнуть диарея. Специфического антидота не существует. Неотложное лечение заключается в восстановлении электролитного баланса.

Побочные реакции

Обычно препарат переносится хорошо, однако иногда возможны диспепсические нарушения (частые опорожнения, мягкие стул, метеоризм), диарея, боль в животе, обычно стихают с продолжением лечения. В некоторых случаях длительная диарея может вызвать осложнения, такие как обезвоживание и нарушение водно-электролитного баланса.

Отмечалась также изменение окраски мочи, не имеет клинического значения. В отличие от нестероидных противовоспалительных препаратов, диацереин не оказывает ulcerогенного действия на пищеварительный тракт.

Со стороны пищеварительного тракта: часто - диарея, боль в животе часто - частый стул, метеоризм редко - пигментация слизистой оболочки кишечника (псевдомеланоз).

Со стороны пищеварительной системы: редко - случаи повышения уровня печеночных ферментов в сыворотке крови.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - изменение окраски мочи.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: часто - зуд, сыпь, экзема.

Общие нарушения: неизвестно - головная боль.

Существуют данные о расстройствах пищеварительной системы

При применении диацереину сообщалось о случаях острого поражения печени, в том числе повышение уровня печеночных ферментов в сыворотке крови и гепатит. Большинство из них наблюдались в течение первых месяцев лечения. Пациенты должны контролировать симптомы поражения печени (см. Раздел «Особенности применения»).

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 30 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 капсул в блистере, по 3 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Маклеодс ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛИМИТЕД.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Плот № 25-27, Сюрвей №366, Премьер Индастриал Истейт, Качигам Даман 396210, (Фаза II), Индия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).