ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ОРЦЕРИН

(ORCERIN)

Склад:

діюча речовина: diacerein;

1 капсула містить діацереїну 50 мг;

допоміжні речовини: циклодекстрини, натрію лаурилсульфат, лактози моногідрат, натрію кроскармелоза, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

склад капсули: діамантовий синій (Е 133), понсо 4R (Е 124), хіноліновий жовтий (Е 104), титану діоксид (Е 171), натрію лаурилсульфат, метилпарагідроксибензоат (Е 218), пропілпарагідроксибензоат (Е 216), желатин.

Лікарська форма. Капсули.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули № 1 з корпусом блакитного та кришечкою темно-синього кольору, що містять порошок світло-жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби. Код АТХ М01А Х21.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Діацереїн – це лікарський засіб для лікування остеоартриту, який має аналгетичні, антипіретичні і протизапальні властивості. Діацереїн класифікується як повільно діючий засіб, ефект якого проявляється протягом 2-4 тижнів лікування і досягає клінічної значущості після 4-6 тижнів. Він має оригінальний механізм дії, що відрізняється від механізму дії нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ). Діацереїн, як і його активний rhein – метаболіт, інгібує синтез та активність інтерлейкіну-1 (IL-1), що відіграє провідну роль у патогенезі остеоартриту і водночас підвищує продукування трансформуючого фактора росту b (TGF-b), який ініціює проліферацію хондроцитів і стимулює вироблення колагену II, протеогліканів і гіалурону.

На відміну від НПЗЗ діацереїн не інгібує синтез простагландинів і, отже, не має

гастродуоденальних побічних ефектів.

Фармакокінетика.

Абсорбція діацереїну уповільнюється при одночасному застосуванні з їжею, що також пов’язано зі збільшенням кількості абсорбованої речовини на 25 %. З іншого боку, виникнення побічних ефектів, таких як збільшення часу кишкового транзиту, безпосередньо пов’язане з кількістю неабсорбованого діацереїну, тому застосування препарату натще призводить до підвищення ризику побічних ефектів. Діацереїн повністю конвертується у rhein-метаболіт шляхом деацелювання перед потраплянням у центральний кровообіг. Біодоступність rhein-метаболіту становить 35-56 %. Об’єм розподілу – приблизно 13,2 л. Rhein-метаболіт зв’язується з білками плазми майже на 99 %, проте цей зв’язок не є стабільним. Rhein-метаболіт або виводиться нирками у незміненому вигляді (20 %), або кон’югується у печінці до rhein-глюкуроніду (60 %) або rhein-сульфату (20 %), які також виводяться із сечею. Період напіввиведення становить приблизно 7-8 годин.

У пацієнтів літнього віку не відзначалося будь-яких змін фармакокінетичних властивостей діацереїну.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування пацієнтів із симптомами остеоартриту стегна або коліна, з відкладеним ефектом.

Лікування діацереїном не рекомендується пацієнтам із швидко прогресуючим остеоартритом тазостегнового суглоба, оскільки вони можуть мати слабку реакцію до діацереїну.

Протипоказання.

– Підвищена чутливість до компонентів препарату або до похідних антрахінону в анамнезі.

– Хвороби печінки, наявні або в анамнезі.

– Запальні кишкові захворювання (неспецифічний виразковий коліт, хвороба Крона).

– Кишкова непрохідність або псевдонепрохідність.

– Біль у животі невизначеного походження.

– Період вагітності або годування груддю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Прийом діацереїну може призвести до виникнення діареї і гіпокаліємії. При одночасному застосуванні діацереїну з діуретиками (петльові і тіазидні) та/або серцевими глікозидами (дигітоксин, дигоксин) збільшується ризик виникнення аритмії.

Одночасний прийом з антацидами (алюміній, солі кальцію та магнію, такі як оксиди та гідроксиди) значно зменшує всмоктування діацереїну з травного тракту. Таким чином, між прийомом антацидів і діацереїну має бути інтервал 1-2 години.

Не спостерігалося взаємодій на зв'язування білків плазми крові реїном (активний метаболіт діацереїну) з варфарином, парацетамолом, саліциловою кислотою, індометацином, ібупрофеном, диклофенаком, фенбуфеном, флурбіпрофеном, напроксеном, фенілбутазоном, піроксикамом, суліндаком, теноксикамом, вальпроатом натрію, фенітоїном, толбутамідом, глібенкламідом або хлорпропрамідом.

Одночасне застосування діацереїну і блокатора H_2-гістамінових рецепторів (циметидину) не призводить до модифікації фармакокінетичних параметрів реїну у плазмі крові і сечі.

Особливості застосування.

Діарея. Довготривалий прийом діацереїну призводить до діареї, яка може спричинити зневоднення і гіпокаліємію. У разі виникнення діареї слід припинити лікування діацереїном і проконсультуватися з лікарем щодо альтернативних варіантів лікування.

Слід з обережністю застосовувати пацієнтам, які приймають діуретики, у зв'язку з можливим виникненням зневоднення і гіпокаліємії. Особливу обережність слід також проявляти в разі гіпокаліємії у хворих, які отримували серцеві глікозиди (дигітоксин, дигоксин) (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Слід уникати одночасного прийому з проносними лікарськими засобами.

Гепатотоксичність. При застосуванні діацереїну можливе підвищення рівня печінкових ферментів у сироватці крові та симптоматичне гостре ураження печінки (див розділ «Побічні реакції»).

Перед початком лікування діацереїном пацієнта слід розпитати про можливі супутні захворювання, захворювання печінки наявні або в анамнезі) та обстежити. Діагностована хвороба печінки є протипоказанням до застосування діацереїну (див. розділ «Протипоказання»).

Необхідний контроль ознак ушкодження печінки протягом перших 2 місяців лікування. Також слід проявляти обережність при застосуванні діацереїну одночасно з іншими лікарськими засобами, що асоціюється з можливими ураженнями печінки. Пацієнтам слід рекомендувати обмежити вживання алкоголю під час лікування діацереїном.

Лікування діацереїном потрібно припинити у разі підвищення рівня печінкових ферментів або виявлення ознак ураження печінки, включаючи неврологічні симптоми. У разі появи симптомів ураження печінки слід негайно звернутися до лікаря.

У зв'язку з пізнім початком дії (через 2-4 тижні) препарату протягом першого місяця лікування діацереїном можна поєднувати із застосуванням нестероїдних протизапальних препаратів та анальгетиків.

Метаболіти діацереїну можуть надавати сечі від коричневого до червоного забарвлення залежно від pH; ця зміна кольору не має клінічного значення, але може впливати на результати діагностичних тестів, на основі колориметрії (глюкозні сечові палички).

Оскільки забарвлення сечі може маскувати мікрогематурію, лабораторний аналіз функції нирок, у тому числі дослідження осаду сечі, слід проводити регулярно, особливо якщо Орцерин застосовувати протягом тривалих періодів.

Орцерин, капсули, містять лактозу. Пацієнтам з рідкісною спадковою чутливістю до галактози, дефіцитом лактази Лаппа або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід приймати Орцерин.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Через відсутність даних застосовувати Орцерин у період вагітності протипоказано.

Діацереїн не слід приймати жінкам, які годують груддю, оскільки незначна кількість препарату виявляється у грудному молоці.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Немає повідомлень про вплив діацереїну на здатність керувати автотранспортом або на роботу з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Лікування повинні розпочинати тільки лікарі, які мають досвід лікування остеоартриту.

Протягом перших 2-4 тижнів лікування дорослі приймають по 1 капсулі (50 мг) разом з вечірнім прийомом їжі, запиваючи водою. З 2-4-го тижня лікування дозу препарату збільшують до 100 мг на добу за 2 прийоми (по 1 капсулі вранці і ввечері під час їди). Діацереїн має повільну із затримкою початкову активність та ефект залишкової дії після припинення лікування, внаслідок чого Орцерин слід застосовувати протягом як мінімум 2-4 тижнів до появи першого позитивного ефекту. Позитивна симптоматична дія зберігається протягом 3-х місяців після періоду застосування. Враховуючи природу захворювання, рекомендовано тривалий курс лікування – не менше 3 місяців, який можна повторити, якщо з’являються симптоми.

Тривалість курсу лікування встановлює лікар індивідуально.

Пацієнти літнього віку.

Діацереїн не рекомендований пацієнтам віком від 65 років у зв’язку з тим, що ця категорія є більш вразливою до ускладнень, пов’язаних з діареєю.

Істотних змін фармакокінетичних параметрів при застосуванні діацереїну пацієнтами літнього віку не виявлено, тому не має потреби у застосуванні рекомендованої дози (див розділ «Фармакологічні властивості»). Однак необхідна обережність при призначенні Орцерину пацієнтам літнього віку. При виникненні діареї слід припинити лікування діацереїном.

Пацієнти з хронічною нирковою недостатністю.

Пацієнтам з легкою та помірною нирковою недостатністю немає потреби змінювати звичайну рекомендовану дозу. Проте для пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 30 мг/мл) добову дозу слід зменшити на 50 % від рекомендованої дози (що відповідає 50 мг на добу).

Діти.

Безпека та ефективність застосування препарату дітям віком до 18 років не були встановлені.

Передозування.

При випадковому або навмисному прийомі великих доз діацереїну може виникнути діарея. Специфічного антидоту не існує. Невідкладне лікування полягає у відновленні електролітного балансу.

Побічні реакції.

Зазвичай препарат переноситься добре, проте інколи можливі диспептичні порушення (часті випорожнення, м'які випорожнення, метеоризм), діарея, біль у животі, які зазвичай стихають з продовженням лікування. У деяких випадках тривала діарея може спричинити ускладнення, такі як зневоднення і порушення водно-електролітного балансу.

Відзначалася також зміна забарвлення сечі, що не має клінічного значення. На відміну від нестероїдних протизапальних препаратів, діацереїн не чинить ульцерогенної дії на травний тракт.

З боку травного тракту: дуже часто – діарея, біль у животі; часто – часті випорожнення, метеоризм; рідко – пігментація слизової оболонки кишечнику (псевдомеланоз).

З боку гепатобіліарної системи: нечасто – випадки підвищення рівня печінкових ферментів у сироватці крові.

З боку нирок і сечовивідних шляхів: дуже часто – зміна забарвлення сечі.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: часто – свербіж, висипи, екзема.

Загальні порушення: невідомо – головний біль.

Існують дані про розлади гепатобіліарної системи.

При застосуванні діацереїну повідомлялося про випадки гострого ураження печінки, у тому числі підвищення рівня печінкових ферментів у сироватці крові та гепатит. Більшість із них спостерігалися протягом перших місяців лікування. Пацієнти повинні контролювати симптоми ураження печінки (див. розділ «Особливості застосування»).

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у захищеному від світла місці при температурі не вище 30 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 капсул у блістері; по 1 або 3 блістери у картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

МАКЛЕОДС ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛІМІТЕД.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Фаза II, Плот № 12, 15, 21, 23, 24, 25, 26, 27, 28 і 30, Сюрвей № 366, Прем’єр Індастріал Істейт, Качигам, Даман, 396210, Індія.