

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОРЦЕРИН
(ORCERIN)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: diacerein; (4,5-біс(ацетилокси)-9,10-діоксо-2- антрацен карбоксильна кислота);

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

склад: 1 тверда желатинова капсула містить діацерейну 50 мг;

допоміжні речовини: бетациклодекстрин, натрію лаурилсульфат, лактоза, натрію кроскармелоза, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, желатин, титану діоксид, індиго кармін, Понсо 4R, хіноліновий жовтий, брнопол, полінілвінілпіролідон К 30.

Форма випуску. Капсули.

Фармакотерапевтична група. Не стероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТС M01A X21.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Діацерейн – це лікарський засіб, розроблений для лікування остеоартриту, який має анальгетичні, антипиретичні і протизапальні властивості. Діацерейн класифікується як повільно діючий засіб, ефект якого з'являється протягом 2 - 4 тижня лікування і досягає клінічної значущості після 4 - 6 тижнів. Він має оригінальний механізм дії, що відрізняється від механізму дії нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ). Діацерейн, як і його активний *rhein* – метаболіт, інгібує синтез і активність інтерлейкіну-1 (IL-1), що відіграє провідну роль у патогенезі остеоартриту, і водночас підвищує продукцію трансформуючого фактору росту – b (TGF-b), який ініціює проліферацію хондроцитів і стимулює продукцію колагену II, протеогліканів і гіалурону.

На відміну від нестероїдних протизапальних засобів діацерейн не інгібує синтез простагландинів і, отже, не має гастроудоденальних побічних ефектів.

Фармакокінетика. Абсорбція діацерейну уповільнюється при одночасному застосуванні з їжею, що водночас 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 діацерейну, тому застосування препарату натщесерце сприяє підвищенню ризику побічних ефектів. Діацерейн повністю конвертується в *rhein*-метаболіт шляхом деацелювання перед потраплянням у центральний кровообіг. Біодоступність *rhein*-метаболіту становить 35 - 56%. Об'єм розподілу – приблизно 13,2л. *Rhein*-метаболіт зв'язується з білками плазми майже на 99%, проте цей зв'язок не є стабільним. *Rhein*-метаболіт або виводиться нирками в незміненому вигляді (20%), або кон'югується в печінці до *rhein*-глюкуроніду (60%) або *rhein*-сульфату (20%), які також виводяться з сечею. Період напіввиведення становить приблизно 7 - 8 год.

При застосуванні діацерейну у пацієнтів літнього віку не відзначалося будь-яких змін його фармакокінетичних властивостей.

Показання для застосування. Ревматичні захворювання суглобів (остеоартрити, остеоартрози, включаючи коксартроз і гонартроз).

Спосіб застосування та дози. Препарат застосовують протягом тривалого періоду (не менше 6 місяців). Протягом перших 2 - 4 тижнів лікування Орцерин призначають дорослим і дітям старше 15 років по 1 капсулі (50 мг) після прийому їжі на ніч. Починаючи з 2 – 4-го тижня лікування дозу препарату збільшують до 100 мг на добу в 2 прийоми (по 1 капсулі вранці і ввечері після їди). Тривалість курсу лікування встановлюється індивідуально лікарем.

Побічна дія. Зазвичай препарат переноситься добре, проте інколи можливі диспепсичні порушення, діарея, біль у животі, які виникають протягом першого місяця лікування.

Інші побічні ефекти включають підвищення рівня печінкових ферментів, знебарвлення сечі, алергічні шкірні реакції (кропив'янка, свербіж).

Протипоказання. Підвищена чутливість до діацереїну; вагітність, лактація; дитячий вік до 15 років.

Передозування. Нині немає даних про передозування діацереїну. У разі передозування слід призначити симптоматичну терапію, специфічного антидоту не існує.

Особливості застосування. Внаслідок пізнього початку дії (через 2 - 4 тижні) протягом першого місяця лікування Орцерин може поєднуватися із застосуванням нестероїдних протизапальних препаратів та анагетиків. У разі необхідності призначення терапії антибіотиками, що впливають на кишкову флору, на початку лікування препаратом слід зробити перерву в лікуванні, тому що Орцерин впливає на кінетику кишечника і підвищення ризику ентероколіту.

Як і в разі будь-якого тривалого лікування іншими лікарськими засобами, під час терапії Орцерином слід періодично (1 раз на 2 - 3 місяці) проводити аналізи крові, визначення печінкових ферментів і аналізи сечі.

У пацієнтів з тяжкою нирковою патологією (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) необхідне зменшення дози Орцерину. В клінічних дослідженнях не відбувалося фармакокінетичних змін діацереїну при помірному і тяжкому цирозі печінки.

Вагітність і лактація

Немає даних про канцерогенні чи тератогенні ефекти діацереїну, проте застосування препарату під час вагітності недоцільне. У разі необхідності призначення діацереїну під час годування груддю слід вирішити питання про штучне годування дитини.

Немає повідомлень про вплив діацереїну на здатність керувати транспортом і працювати зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Встановлено синергічну дію діацереїну з нестероїдними протизапальними засобами та ненаркотичними анагетиками.

Не слід застосовувати Орцерин одночасно з хіміотерапією або антибіотиками, що впливають на кишкову флору, а також проносними лікарськими засобами, або препаратами, що змінюють перистальтику кишечника.

Слід уникати одночасного застосування з діацереїном лікарських засобів, що містять гідроксид алюмінію або гідроксид магнію через підвищення біодоступності діацереїну.

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей, захищеному від світла, місці при температурі не вище 25 С. Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 капсул у блістері; 1 блістер у картонній упаковці.

Виробник. МАКЛЕОДС ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛІМІТЕД.

Адреса. 304-310, Atlanta Arcade, Marol Church Road, Andheri (East), Mumbai – 400059, India.