

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ

МИНЗДРАВ РОССИИ
сер 002476/017 0821
СОГЛАСОВАНО

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Диацереин-Мак

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Диацереин-Мак

Международное непатентованное или группировочное наименование: диацереин

Состав:

Каждая капсула содержит:

Действующее вещество: диацереин 50 мг.

Вспомогательные вещества: бетадекс, натрия лаурилсульфат, лактоза, кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав желатиновых капсул:

Крышечка капсулы: титана диоксид, индигокармин, краситель хинолиновый желтый, краситель пунцовый [Понсо-4R], бронопол, повидон К-30, натрия лаурилсульфат, желатин.

Корпус капсулы: титана диоксид, индигокармин, краситель хинолиновый желтый, бронопол, повидон К-30, натрия лаурилсульфат, желатин.

Описание:

Твердые желатиновые капсулы размером «1» с корпусом голубого с зеленовато-сероватым оттенком цвета и крышечкой синего цвета. Содержимое капсул: порошок ярко-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

Противовоспалительное средство, обладающее симптомно-модифицирующим эффектом замедленного действия.

Код АТХ: M01AX21

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика:

Диацереин – производное антрахинолина, диацетилированное производное реина. Метаболизируясь до активного метаболита – реина, ингибирует активность интерлейкина-1, который играет важную роль в развитии воспаления и дегенерации хряща при остеоартрозе. Диацереин ингибирует действие других цитокинов, вызывающих

воспаление, в том числе интерлейкина-6, фактора некроза опухоли-альфа (ФНО- α). Диацереин замедляет синтез металлопротеиназ (коллагеназы, эластазы), которые способствуют повреждению хрящевой ткани. При длительном применении диацереин стимулирует синтез протеогликанов, не влияет на синтез простагландинов.

Препарат обладает анальгезирующей и противовоспалительной активностью при пероральном приеме. Действие развивается через 2-4 недели.

Фармакокинетика:

Абсорбция

При приеме внутрь диацереин быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Время достижения максимальной концентрации ($T_{C_{max}}$) – 144 мин. При однократном приеме в дозе 50 мг C_{max} – 3,15 мг/л, при многократном приеме в связи с кумуляцией препарата C_{max} повышается. Биодоступность составляет 50-65%. Биодоступность увеличивается на 25% при одновременном приеме с пищей.

Метаболизм и распределение

Полностью метаболизируется (деацетируется) до активного метаболита – реина. Связь реина с белками (альбумином) плазмы крови составляет практически 100%. Реин накапливается в органах и тканях в течение периода до 168 ч после приема внутрь. Наибольшая концентрация реина наблюдается в почках и селезенке. В небольших количествах накапливается в ткани мозга, костном мозге, костной ткани и глазном яблоке. Реин проникает через плацентарный и гематоэнцефалический барьеры. Трансплацентарный перенос составляет около 3% от концентрации реина в плазме крови через 45 мин после приема внутрь.

Выведение

Выводится почками в неизменном виде (20%), в виде глюкуронида (60%), в виде сульфата (20%). Период полувыведения ($T_{1/2}$) – 255 мин.

Показания к применению

Симптоматическое лечение остеоартроза тазобедренных и коленных суставов при отсутствии необходимости достижения быстрого эффекта.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему и/или любому из вспомогательных веществ препарата и к производным антрахинона (например, слабительным средствам).

Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Воспалительные заболевания кишечника (язвенный колит, болезнь Крона).

Непроходимость кишечника или псевдообструкция.

Абдоминальный болевой синдром неопределенной этиологии.

Текущие заболевания печени и/или заболевания печени в анамнезе.

Тяжелая почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин) и заболевания почек в анамнезе.
Детский возраст (до 18 лет).

Беременность и период грудного вскармливания.

С осторожностью

Почечная недостаточность средней степени тяжести (КК 30-60 мл/мин); синдром раздраженной толстой кишки; возраст старше 65 лет.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

В связи с отсутствием клинических данных применение диацереина в период беременности противопоказано.

Период грудного вскармливания

Диацереин, как и другие препараты данной группы, может проникать в грудное молоко. В связи с этим, диацереин противопоказан в период грудного вскармливания.

Способы применения и дозы

Внутрь, во время приема пищи. Капсулу необходимо проглатывать целиком, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Назначать препарат должен специалист с опытом лечения остеоартроза.

Рекомендуется начинать лечение с приема одной капсулы (50 мг) в сутки во время приема пищи (например, ужина) в течение 4 недель, так как в течение первых двух недель приема препарат может вызвать ускорение транзита содержимого кишечника.

Затем дозу увеличивают до 100 мг в сутки – по 1 капсуле (50 мг) 2 раза в сутки (утром и вечером).

Лечение проводится непрерывно длительно или курсами продолжительностью не менее 4 месяцев.

У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК 30-60 мл/мин) доза препарата должна быть снижена до 50 мг в сутки.

Пациенты пожилого возраста

Коррекции дозы у пациентов пожилого возраста старше 65 лет не требуется. Однако следует проявлять осторожность. Поскольку пациенты пожилого возраста более уязвимы для осложнений, связанных с диареей, не рекомендуется применять диацереин пациентам пожилого возраста с диареей в анамнезе. В случае возникновения диареи, необходимо прекратить лечение и обратиться к врачу.

Побочное действие

В соответствии с классификацией ВОЗ нежелательные эффекты классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$); частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось возможным.

Нарушения со стороны иммунной системы:

Нечасто: аллергические реакции, крапивница, бронхоспазм, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Нарушения со стороны ЖКТ:

Редко: диарея, тошнота, рвота, боль в животе.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Нечасто: повышение активности «печеночных» ферментов.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Нечасто: кожный зуд, сыпь.

Общие расстройства:

Редко: недомогание.

Частота неизвестна: интенсивное окрашивание мочи (в зависимости от pH) от желтого до коричневого цвета (не имеет клинического значения и не требует отмены препарата или снижения его дозы).

При появлении нежелательных реакций, не описанных в данной инструкции, следует прекратить прием препарата и сообщить об этом лечащему врачу.

Передозировка

Симптомы: диарея, слабость.

Лечение: симптоматическое. При выраженной диарее необходимо восполнение водно-электролитного баланса.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Диацереин не рекомендуется принимать вместе с веществами, оказывающими влияние на качество содержимого кишечника и скорость его опорожнения (например, большое количество клетчатки). Антациды уменьшают абсорбцию препарата. При одновременном приеме с антибиотиками или химиотерапевтическими препаратами, влияющими на микрофлору кишечника, может повыситься частота нежелательных явлений со стороны кишечника.

Диацереин может вызвать развитие диареи и гипокалиемии. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении с диуретиками (петлевыми и тиазидными)

и/или сердечными гликозидами (дигоксином, дигитоксином) в связи с повышением риска развития аритмии (см. раздел «Особые указания»).

Особые указания

Продолжительность лечения в зависимости от достигнутого результата может быть длительной. В период, предшествующий развитию терапевтического эффекта, диацереин можно принимать одновременно с анальгетиками и нестероидными противовоспалительными препаратами. Необходим периодический контроль показателей крови, печеночных ферментов, мочи. При ухудшении функции почек врач должен снизить дозу препарата.

Не рекомендуется применение диацереина при быстро прогрессирующем остеоартрозе тазобедренного и коленного суставов вследствие медленного развития клинического эффекта лекарственного средства.

Диарея

Прием диацереина часто приводит к развитию диареи (см. раздел «Побочное действие»), что может вызвать обезвоживание и гипокалиемию.

При развитии диареи следует прекратить прием препарата и немедленно связаться с врачом, чтобы обсудить альтернативное лечение.

Необходимо проявлять осторожность, если пациент одновременно получает диуретики, так как могут развиваться обезвоживание и гипокалиемия. Особую осторожность следует соблюдать при гипокалиемии у пациентов, получавших сердечные гликозиды (дигитоксин, дигоксин) (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»).

Следует избегать одновременного применения слабительных лекарственных средств.

Гепатотоксичность

В ходе пострегистрационного мониторинга были выявлены случаи повышения активности печеночных ферментов в сыворотке крови и симптоматическое острое поражение печени (см. раздел «Побочное действие»).

Перед началом лечения пациента следует опросить о сопутствующих, текущих и имеющихся в анамнезе заболеваниях печени, провести обследование для выявления нарушений функционального состояния печени. Заболевания печени являются противопоказанием к применению диацереина (см. раздел «Противопоказания»).

Необходимо выполнять контроль лабораторных и клинических проявлений повреждения печени, соблюдать меры предосторожности при одновременном применении с другими лекарственными средствами с характерным риском развития гепатотоксических реакций.

Пациентам следует рекомендовать ограничить потребление алкоголя во время применения диацереина.

Лечение препаратом диацереина необходимо прекратить, если выявлено повышение активности печеночных ферментов или подозревается развитие симптомов поражения печени. Пациента следует проинформировать о признаках и симптомах гепатотоксичности и рекомендовать немедленно обращаться к врачу в случае появления подозрения на развитие симптомов поражения печени.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Влияние диацереина на концентрацию внимания, быстроту психомоторных реакций при управлении транспортными средствами, механизмами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности не изучалось.

Форма выпуска:

Капсулы, 50 мг.

10 капсул в блистер (алюминий/алюминий). 1, 3, 6 или 10 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Срок годности:

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска:

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения:

Маклеодз Фармасьютикалз Лтд., Индия.

Производитель:

Маклеодз Фармасьютикалз Лтд., Индия

Атланта Аркад, Черч Роуд, Андери (Ист), Мумбай – 400059, Индия

Упаковщик/Выпускающий контроль качества:

Маклеодз Фармасьютикалз Лтд.,

Атланта Аркад, Черч Роуд, Андери (Ист), Мумбай – 400059, Индия

Организация, принимающая претензии от потребителя:

ООО «ЭДВАНСД ТРЕЙДИНГ»

123182, Россия, г. Москва, ул. Щукинская, д. 2, этаж 3.

Тел.+7 (495) 915-84-26 (многоканальный),

+7 (499) 193-71-11; факс: +7 (495) 942-52-81.

E-mail: info@atcl.ru

О развитии нежелательных реакций, связанных с приемом препарата, сообщить

ООО «ЭДВАНСД ТРЕЙДИНГ»

123182, Россия, г. Москва, ул. Щукинская, д. 2, этаж 3

Тел.+7 (495) 915-84-26 (многоканальный),

+7 (499) 193-71-11; факс: +7 (495) 942-52-81.

e-mail: info@atcl.ru

Представитель организации-заявителя



Волкова Н. В.