

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ФЛЕКЦЕРИН
(FLEKSERIN)

Склад:

діюча речовина: діацереїн;

1 капсула містить діацереїну 50 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат, натрію кроскармелоза, повідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

тверда желатинова капсула: желатин, індигокармін (індіготин) (E 132), хіноліновий жовтий (E 104), титану діоксид (E 171).

Лікарська форма. Капсули тверді.

Основні фізико-хімічні властивості: капсули тверді желатинові з кришечкою і корпусом зеленого кольору. Вміст капсул – гранульований порошок жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТХ M01A X21.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Флексерин – це лікарський засіб для лікування остеоартриту та остеоартрозу, який має анагетичні, антипіретичні та протизапальні властивості. Діацереїн класифікується як повільно діючий засіб, ефект якого з'являється 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 метаболіт реїн, інгібує синтез та активність інтерлейкіну-1 (IL-1), що відіграє провідну роль у патогенезі остеоартриту, і водночас підвищує продукування трансформуючого фактора росту- β (TGF- β), який ініціює проліферацію хондроцитів і стимулює продукування колагену II, протеогліканів і гіалурону.

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

Фармакокінетика.

Абсорбція діацереїну уповільнюється при одночасному застосуванні з їжею. Діацереїн повністю конвертується у реїн-метаболіт шляхом деацелювання перед надходженням у центральний кровообіг. Біодоступність реїн-метаболіту становить 35-56 %. Об'єм розподілу – приблизно 13,2 л. Реїн-метаболіт зв'язується з білками плазми майже на 99 %, проте цей зв'язок не є стабільним. Реїн-метаболіт або виводиться нирками у незміненому вигляді (20 %), або кон'югується у печінці до реїн-глюкуроніду (60 %) або реїн-сульфату (20 %), які також виводяться з сечею. Період напіввиведення становить приблизно 7-8 годин.

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

Клінічні характеристики.

Показання.

Ревматичні захворювання суглобів (остеоартрити, остеоартрози).

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу або до похідних антрахінону в анамнезі.
- Хвороби печінки наявні або в анамнезі.
- Запальні кишкові захворювання (неспецифічний виразковий коліт, хвороба Крона).
- Кишкова непрохідність або псевдо непрохідність.
- Біль у животі невизначеного походження.
- Період вагітності або годування груддю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Діацереїн не слід приймати одночасно з препаратами, які змінюють проходження вмісту кишечника або волокнами рослинного походження. Слід уникати одночасного застосування препаратів, які містять гідроксид алюмінію та магнію, тому що це може вплинути на всмоктування діацереїну.

Встановлено синергічну дію діацереїну з нестероїдними протизапальними засобами та ненаркотичними анальгетиками.

Не слід застосовувати Флексерин одночасно з хіміотерапією або антибіотиками, що впливають на кишкову флору, а також із проносними лікарськими засобами.

Особливості застосування.

З огляду на пізній початок дії (через 2-4 тижні) протягом першого місяця лікування Флексерином його можна поєднувати з іншими нестероїдними протизапальними препаратами та анальгетиками.

Під час терапії діацереїном слід періодично (1 раз на 2-3 місяці) робити розгорнутий аналіз крові, визначення ферментів печінки та аналіз сечі.

Слід тимчасово припинити лікування у випадку терапії антибіотиками, оскільки останні можуть вплинути на кишкову флору та кінетику препарату.

Лікування діацереїном може посилити симптоми ентероколіту у хворих, які приймають антибіотики та хіміотерапію, що впливають на кишкову флору. З обережністю призначати пацієнтам із хронічною нирковою недостатністю.

У ході досліджень не відбувалося фармакокінетичних змін діацереїну при помірному і тяжкому цирозі печінки.

При застосуванні діацереїну з їжею зростає всмоктування лікарського засобу (на 24 %); з іншого боку, тривалий дефіцит їжі зменшує біодоступність діацереїну. Як частота виникнення побічних ефектів, так і прискорений транзит через кишечник прямо пропорційно залежать від кількості діацереїну, що всмоктався. Прийом лікарського засобу натщесерце або після дуже невеликої кількості їжі може призвести до розвитку побічної дії.

Лікарський засіб містить лактозу, тому його не слід застосовувати при спадковій непереносимості галактози, дефіциті лактази Лаппа або порушенні мальабсорбції глюкози-галактози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Протипоказано.

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

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

Спосіб застосування та дози.

Протягом перших 2-4 тижнів лікування Флекцерин призначати дорослим по 1 капсулі (50 мг) після прийому їжі на ніч. Починаючи з 2-4-го тижня лікування, дозу лікарського засобу збільшувати до 100 мг на добу за 2 прийоми (по 1 капсулі вранці і ввечері після їди).

Лікарський засіб застосовувати протягом тривалого періоду (не менше 6 місяців). 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 жодних змін до рекомендованої дози не потребується (див. розділ «Фармакологічні властивості»). Тим не менше, необхідно проявляти обережність. При виникненні діареї слід припинити лікування діацереїном.

Пацієнти з хронічною нирковою недостатністю.

При нирковій недостатності може змінюватися фармакокінетика діацереїну. У цих випадках рекомендується знижувати дозу до 1 капсули на добу (кліренс креатиніну < 30 мг/мл).

Діти.

Ефективність і безпека застосування лікарського засобу дітям не встановлені, тому діацереїн протипоказано застосовувати у цій віковій групі.

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.

Можливі диспепсичні явища, діарея, біль у животі, які виникають протягом першого місяця лікування.

Інші побічні ефекти включають підвищення рівня печінкових ферментів, інтенсивне забарвлення сечі в жовтий колір, алергічні шкірні реакції (кропив'янка, свербіж).

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 капсул у блістері; по 1 або 3 блістери в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. АТ «КИЇВСЬКИЙ ВІТАМІННИЙ ЗАВОД».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

04073, Україна, м. Київ, вул. Копилівська, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

ФЛЕКЦЕРИН
(FLEKSERIN)

Состав:

действующее вещество: диацереин;

1 капсула содержит диацереина 50 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат, натрия кроскармеллоза, повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат;

твердая желатиновая капсула: желатин, индигокармин (индиготин) (E 132), хинолиновый желтый (E 104), титана диоксид (E 171).

Лекарственная форма. Капсулы твердые.

Основные физико-химические свойства: капсулы твердые желатиновые с крышечкой и корпусом зеленого цвета. Содержимое капсул – гранулированный порошок желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа. Нестероидные противовоспалительные и противоревматические средства. Код АТХ M01A X21.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Флекцерин – это лекарственное средство для лечения остеоартрита и остеоартроза, которое имеет анальгетические, антипиретические и противовоспалительные свойства. Диацереин классифицируется как медленно действующее средство, эффект которого появляется в течение 2-4 недель лечения и достигает клинической значимости после 4-6 недель. Он имеет оригинальный механизм действия, который отличается от механизма действия нестероидных противовоспалительных средств (НПВС).

Диацереин, как и его активный метаболит реин, ингибирует синтез и активность интерлейкина-1 (IL-1), который играет ведущую роль в патогенезе остеоартрита, и вместе с тем повышает продуцирование трансформирующего фактора роста- β (TGF- β), инициирующего пролиферацию хондроцитов и стимулирующего продуцирование коллагена II, протеогликанов и гиалурона.

В отличие от нестероидных противовоспалительных средств диацереин не ингибирует синтез простагландинов и, следовательно, не имеет гастродуоденальных побочных эффектов.

Фармакокинетика.

Абсорбция диацереина замедляется при одновременном применении с пищей. Диацереин полностью конвертируется в реин-метаболит путем деацилирования перед поступлением в центральное кровообращение. Биодоступность реин-метаболита составляет 35-56 %. Объем распределения – приблизительно 13,2 л. Реин-метаболит связывается с белками плазмы почти на 99 %, но эта связь не является стабильной. Реин-метаболит или выводится почками в неизменном виде (20 %), или конъюгируется в печени до реин-глюкуронида (60 %) или реин-сульфата (20 %), которые также выводятся с мочой. Период полувыведения составляет приблизительно 7-8 часов.

При применении диацереина у пациентов пожилого возраста не отмечалось любых изменений его фармакокинетических свойств.

Клинические характеристики.

Показания.

Ревматические заболевания суставов (остеоартриты, остеоартрозы).

Противопоказания.

- Повышенная чувствительность к компонентам лекарственного средства или к антрахинону в анамнезе.
- Болезни печени явные или в анамнезе.
- Воспалительные кишечные заболевания (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона).
- Кишечная непроходимость или псевдопроходимость.
- Боль в животе неизвестного происхождения.
- Период беременности или кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Диацереин не следует принимать одновременно с препаратами, которые изменяют прохождение содержимого кишечника или волокнами растительного происхождения. Нужно избегать одновременного применения препаратов, которые содержат гидроксид алюминия и магния, так как это может повлиять на всасывание диацереина.

Установлено синергическое действие диацереина с нестероидными противовоспалительными средствами и ненаркотическими анальгетиками.

Не следует применять Флексерин одновременно с химиотерапией или антибиотиками, которые влияют на кишечную флору, а также со слабительными лекарственными средствами.

Особенности применения.

Ввиду позднего начала действия (через 2-4 недели) в течение первого месяца лечения Флексерином его можно комбинировать с другими нестероидными противовоспалительными препаратами и анальгетиками.

Во время терапии диацереином следует периодически (1 раз в 2-3 месяца) делать развернутый анализ крови, определение ферментов печени и анализ мочи.

Следует временно прекратить лечение в случае терапии антибиотиками, поскольку последние могут повлиять на кишечную флору и кинетику препарата. Лечение диацереином может усилить симптомы энтероколита у больных, которые принимают антибиотики и химиотерапию, влияющие на кишечную флору. С осторожностью назначать пациентам с хронической почечной недостаточностью.

В ходе исследований не происходило фармакокинетических изменений диацереина при умеренном и тяжелом циррозе печени.

При применении диацереина с пищей усиливается всасывание лекарственного средства (на 24 %); с другой стороны, длительный дефицит пищи уменьшает биодоступность диацереина. Как частота возникновения побочных эффектов, так и ускоренный транзит через кишечник прямо пропорционально зависят от количества диацереина, который впитался. Прием лекарственного средства натощак или после очень небольшого количества пищи может привести к развитию побочного действия.

Лекарственное средство содержит лактозу, поэтому его не следует применять при наследственной непереносимости галактозы, дефиците лактазы Лаппа или нарушении мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Противопоказано.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

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

Способ применения и дозы.

В течение первых 2-4 недель лечения Флекцерин назначать взрослым по 1 капсуле (50 мг) после приема пищи на ночь. Начиная со 2-4-й недели лечения, дозу лекарственного средства увеличивать до 100 мг в сутки в 2 приема (по 1 капсуле утром и вечером после еды).

Лекарственное средство применять в течение длительного периода (не менее 6 месяцев). Длительность курса лечения устанавливает врач индивидуально.

Пациенты пожилого возраста.

Диацереин не рекомендован пациентам возрастом от 65 лет в связи с тем, что данная категория является наиболее уязвимой к осложнениям, связанных с диареей.

Существенных изменений фармакокинетических параметров при применении диацереина пациентами пожилого возраста не установлено, поэтому никаких изменений к рекомендованной дозе не требуется (см. раздел «Фармакологические особенности»). Тем не менее, необходимо проявлять осторожность. При возникновении диареи следует прекратить лечение диацереином.

Пациенты с хронической почечной недостаточностью.

При почечной недостаточности может изменяться фармакокинетика диацереина. В этих случаях рекомендуется снижать дозу до 1 капсулы в сутки (клиренс креатинина < 30 мг/мл).

Дети.

Эффективность и безопасность применения лекарственного средства детям не установлены, поэтому диацереин противопоказан к применению в этой возрастной группе.

Передозировка.

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

Побочные реакции.

Возможны диспепсические явления, диарея, боль в животе, которые возникают в течение первого месяца лечения.

Другие побочные эффекты включают повышение уровня печеночных ферментов, интенсивное окрашивание мочи в желтый цвет, аллергические кожные реакции (крапивница, зуд).

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 капсул в блистере; по 1 или 3 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. АО «КИЕВСКИЙ ВИТАМИННЫЙ ЗАВОД».

Местонахождение производителя и адрес места осуществления его деятельности.

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.