

## ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

### ОРЦЕРІН (ORCERIN)

#### **Склад:**

*діюча речовина:* diacerein ;

1 капсула містить діацерейну 50 мг;

*допоміжні речовини:* циклодекстрини, натрію лаурилсульфат , лактози моногідрат, натрію кроскармелоза , кремнію діоксид колоїдний безводний, магніюстеарат ;

*склад капсули:* діамантовий синій (Е 133), поносо 4R (Е 124), хіноліновий жовтий (Е 104), титану діоксид (Е 171), натрію лаурилсульфат , метилпарагідроксibenзоат (Е 218), пропілпарагідроксibenзоат (Е 216), желатин.

**Лікарська форма.** Капсули.

#### **Фармакотерапевтична група.**

Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби. Код АТС М 01А Х21.

#### **Клінічні характеристики.**

##### **Показання.**

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

##### **Протипоказання.**

Підвищена чутливість до діацерейну , інших компонентів препарату або до антрахінону в анамнезі.

##### **Спосіб застосування та дози.**

Препарат застосовувати протягом тривалого періоду (не менше 6 місяців). Протягом перших 2-4 тижнів лікування Орцерин призначають дорослим 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.

*Пацієнти з хронічною нирковою недостатністю.*

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

##### **Побічні реакції.**

Зазвичай препарат переноситься добре, проте інколи можливе виникнення побічних реакцій:

*з боку травного тракту:* диспептичні порушення, нудота, блювання, діарея ( може виникати протягом перших кількох днів лікування) , біль в епігастрії/животі (може виникати протягом першого місяця лікування);

*з боку гепатобілярної системи:* підвищення рівня печінкових ферментів;

*з боку шкіри та підшкірної клітковини:* шкірні висипання, кропив'янка, свербіж;

*інші:* зміна кольору сечі, інтенсивне забарвлення сечі в жовтий колір.

При індивідуальній непереносимості до будь-якого компонента препарату, у тому числі і до поносо 4R, можливе виникнення алергічних реакцій.

##### **Передозування.**

При випадковому або навмисному прийомі великих доз діацерейну може виникнути діарея чи посилення проявів інших побічних реакцій.

*Лікування.* Специфічного антидоту не існує. Невідкладне лікування полягає у відновленні електролітного балансу.

##### **Застосування у період вагітності або годування груддю.**

Препарат протипоказаний вагітним і жінкам, які годують груддю.

На час лікування препаратом годування груддю слід припинити.

##### **Діти.**

Ефективність і безпека застосування препарату дітям не встановлені, тому діацерейн не слід призначати дітям.

##### **Особливості застосування.**

Унаслідок лізного початку дії (через 2-4 тижні) протягом першого місяця лікування Орцерин можна поєднувати із застосуванням інших нестероїдних протизапальних препаратів та анальгетиків.

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

Слід тимчасово припинити лікування у випадку терапії антибіотиками, оскільки останні можуть вплинути на кишкову флору та кінетику препарату. Лікування діацерейном може посилити симптоми ентероколіту у хворих, які приймають антибіотики та хіміотерапію, що впливають на кишкову флору.

Слід враховувати співвідношення користь/ризик при призначенні Орцерину хворим із попередніми випадками ентероколіту, особливо пацієнтам з подразненням товстого кишечника.

З обережністю призначати пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю. Для пацієнтів з тяжкою нирковою патологією (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) необхідне зменшення дози Орцерину .

У клінічних дослідженнях не відбувалося фармакокінетичних змін діацерейну при помірному і тяжкому цирозі печінки.

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

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

##### **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.**

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

##### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

Діацерейн не слід приймати одночасно з препаратами, які змінюють проходження вмісту кишечника (наприклад волокна або продукти рослинного походження). Слід уникати одночасного застосування препаратів,

які вміщують гідроксид алюмінію та магнію, тому що це може вплинути на всмоктування діацерейну .

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

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.

##### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.* Діацерейн – це лікарський засіб, розроблений для лікування остеоартриту , який має анальгетичні, антипіретичні 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 та активність

інтерлейкіну-1 ( IL-1), що відіграє провідну роль у патогенезі остеоартриту і водночас підвищує продукцію трансформуючого фактора росту – b (TGF-b), який ініціює проліферацію хондроцитів і стимулює продукцію колагену II, протеогліканів і гіалурону .

На відміну від НПЗЗ діацерейн не інгібує синтез простагландинів і, отже, не має гастроуденальних 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 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.

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

##### **Фармацевтичні характеристики.**

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

**Термін придатності.** 3 роки.

##### **Умови зберігання.**

Зберігати у захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °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.**

Плот № 25-27, Сурвей № 366, Прем'єр Індустріал Істейт , Канчигам, Даман – 396210 (Фаза II), Індія.