



# *ДИАЦЕРЕИН* *(Артродарин)*

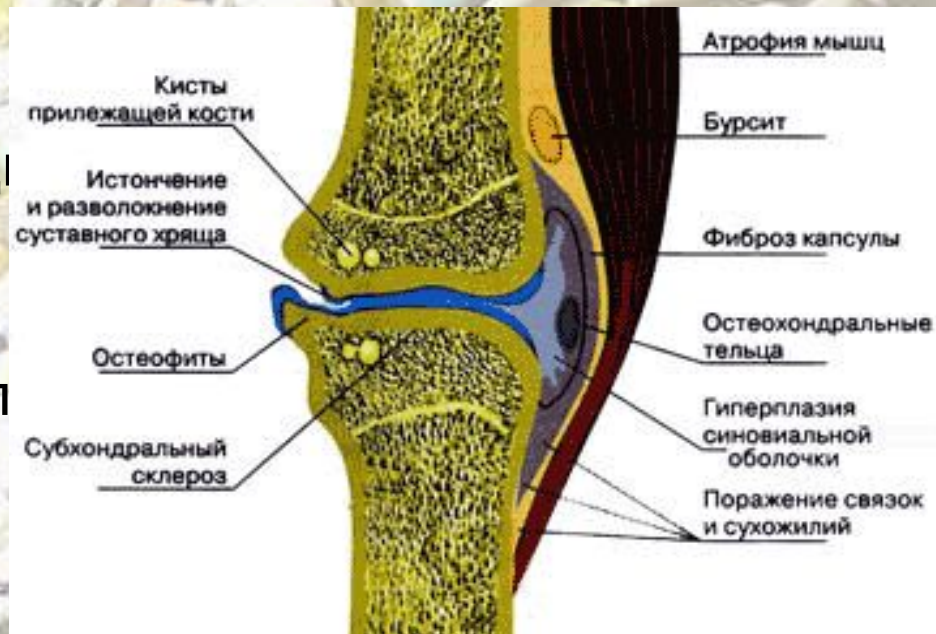
**Препарат, применяемый при  
воспалительных и  
воспалительно-дистрофических  
заболеваниях опорно-  
двигательной системы**

Подготовила: студентка 314 группы 1 мед  
Церковная Анастасия  
Преподаватель: Усеинова А.Н.

# Остеоартроз

Остеоартроз занимает первое место по распространенности среди всех заболеваний опорно-двигательного аппарата, особенно у лиц старшей возрастной группы

- характеризуется, прежде всего, потерей суставного хряща
- наиболее часто развивается в коленных, тазобедренных, суставах кистей и позвоночника.
- поражение коленных и тазобедренных суставов – самые инвалидизирующие локализации болезни.
- в отчете ВОЗ указано, что ОА коленных суставов занимает 4 место по инвалидности среди женщин и 8 – среди мужчин.





# Этиология и основные симптомы

Основными клиническими симптомами ОА являются боль и функциональная недостаточность. Физическая нетрудоспособность, обусловленная болью и ограничением функциональной активности суставов, приводит к снижению качества жизни и повышению риска развития сопутствующей патологии и смертности.



# Процессы, происходящие при ОА

При остеоартрозе развивается преобладание катаболических процессов над анаболическими, связанное с патологией хондроцитов, функциональная активность которых регулируется очень большим количеством биологически активных медиаторов. Одним из ключевых медиаторов является провоспалительный цитокин интерлейкин-1 (ИЛ-1), имеющий важную роль в воспалении, деградации хряща и патофизиологии ОА.



# Процессы, происходящие при ОА

**Синтез протеолитически  
ферментов**

**Хондроцитами:**

**Циклооксигеназа А2**

**Индецируемые формы  
синтетацы оксида азота**

**ИЛ-1**

**Леградация коллагена и протеогликанов  
хряща**

**Апоптоз синовиоцитов**

**Воспаление**



# Препараты для лечения остаоартроза

По современной классификации препараты для лечения ОА подразделяются на:  
**модифицирующие симптомы болезни быстрого** (простые анальгетики и НПВП) и **замедленного действия** (глюкозамин, хондроитин сульфаты, диацереин и др.) и **модифицирующие структуру хряща**.

Для некоторых препаратов с замедленным действием получены доказательства их структурно-модифицирующего влияния на хрящ.

# Сравнения механизмов действия препаратов для лечения ОА



**Рис. 7.** Механизм уменьшения выраженности боли при ОА

# Препараты для лечения остаоартроза

Наиболее изученными препаратами на сегодняшний день, обладающими как симптом-модифицирующими, так и структурно-модифицирующими свойствами являются хондроитин сульфат и глюкозамин сульфат. Новый препарат, обладающий этими свойствами, - **диацереин** представляет собой ацетилированную форму реина и по механизму действия отличается от используемых для лечения ОА лекарственных средств.



# Диацереин (Артродарин)

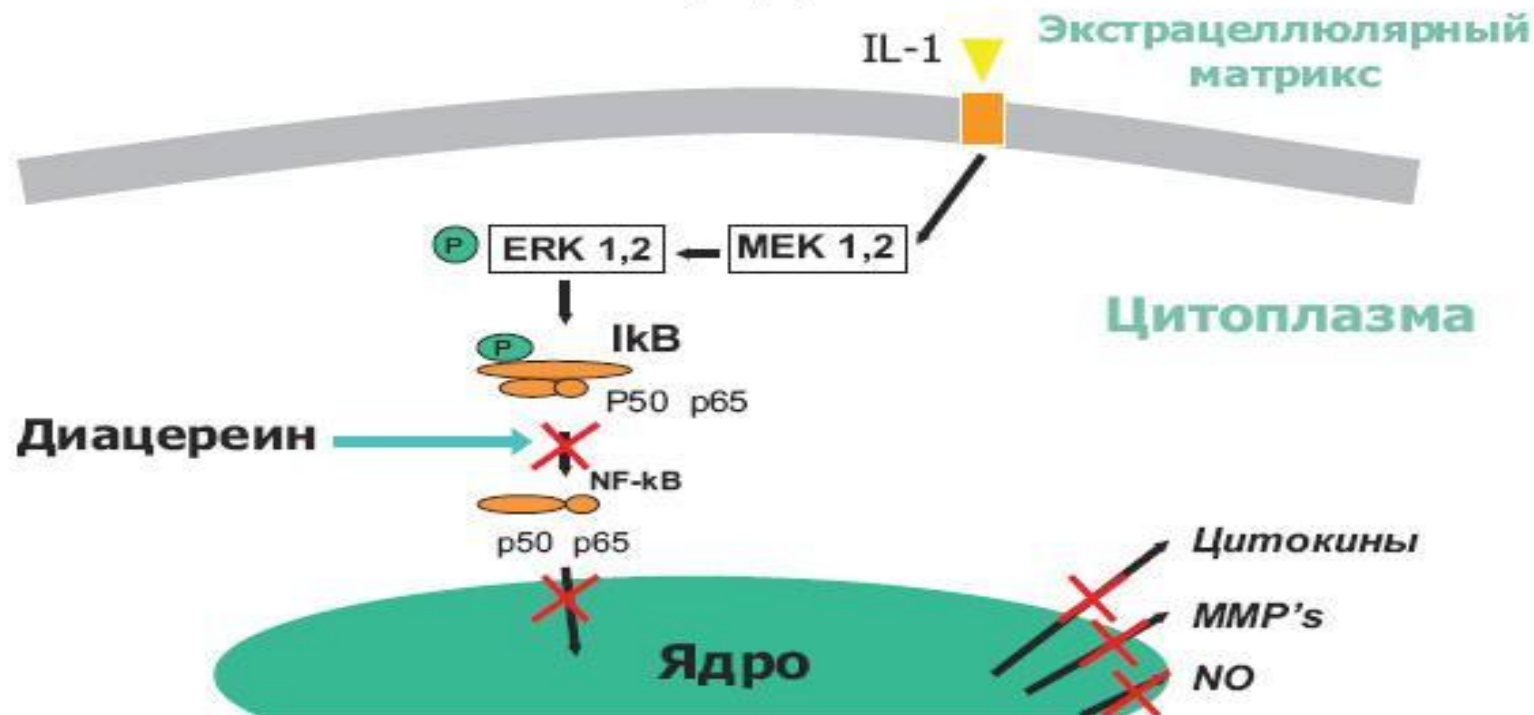


**Диацереин** – международное название перорального препарата для ОА. Механизм его действия связан с ингибцией синтеза ИЛ-1 и блокированием его активности. Препарат принимается по одной капсуле (50 мг) внутрь два раза в день во время еды в течение не менее чем 6 месяцев.

В нашей стране используется дженерик с названием

# Механизм действия диацереина

## Пути внутриклеточной передачи



# Фармакокинетика

После приема внутрь **диацереин** хорошо всасывается, полностью деацетилируется в активный метаболит – реин. Максимальная концентрация реина в плазме достигается через 15-30 минут после приема, 99 % его связывается с белками плазмы. Период полужизни реина в плазме составляет 4.2 часа после первой дозы 50 мг и 7.5 часа после девятой дозы, что позволяет принимать препарат дважды в день, выводится реин, главным образом, через почки (20% в неизменном виде, в виде производных глюкуронида 60% и сульфатов 20 %).

In vitro **диацереин** ингибирует продукцию ИЛ-1 и снижает содержание металлопротеиназ в хряще человека при ОА. С другой стороны, он стимулирует синтез простагландинов, ГАГ и гиалуроновой кислоты.



# Клинические испытания

## диацереина

- В 2000 году проведено РДСПКИ с ранжированием дозы диацереина . Эффективность и безопасность разных доз препарата (50, 100 и 150 мг) оценивались у 484 больных ОА коленных суставов в течение 16-ти недель. Исследуемый препарат в дозе 100 мг/сут (50 мг дважды в день) существенно превосходил эффект плацебо по влиянию на боль и функциональную способность суставов и обладал большей безопасностью по сравнению с более высокой дозой. Результаты этого исследования определили оптимальную дозу препарата.

# Клинические испытания

## диацереина

- ❑ В 2-х месячном исследовании эффективность диацереина была сравнима с напроксеном . Наблюдалось сохранение эффекта диацереина в течение 30 дней после прекращения лечения в отличие от напроксена .
- ❑ Наличие у диацереина эффекта последствия было подтверждено в многоцентровом 8-месячном РДСПКИ на 183 больных с ОА коленных и тазобедренных суставов . В течение последних 2-х месяцев исследования оценивался эффект последствия препаратов. В конце лечебного периода боль в суставах была достоверно ниже на диацереине по сравнению с плацебо.



# Клинические испытания

## диацереина

- ❑ В другом исследовании получены доказательства эффективности и выраженного последствия диацереина по сравнению с пироксикамом, он был в 2 раза больше в группе больных, леченных диацереином (78% и 43%, соответственно).
- ❑ В РДСПКИ, проведенном в Китае, эффективность препаратов была практически одинаковой: улучшение достигнуто у 65.4% больных, получавших диацереин и у 61.6% - диклофенак. Нежелательные явления отмечались у 35.7% больных, на диклофенаке - у 45.1%.



# Клинические испытания

## диацереина

- Rintelen В с соавт. провели систематический мета-анализ, в который вошли 19 контролируемых, рандомизированных исследований из 23 найденных в различных базах данных по оценке симптом-модифицирующего действия диацереина, доказав, что диацереин значительно улучшает симптомы болезни по сравнению с плацебо, имеет примерно равную эффективность с НПВП, но в отличие от них обладает выраженным последствием. Кроме того, обладая сходной переносимостью с НПВП, не вызывает тяжелых побочных явлений, которые часто регистрируются при приеме НПВП.

# Клинические испытания

## диацереина

- Структурно-модифицирующий эффект диацереина изучался в 3-х летнем, Измерение суставной щели тазобедренного сустава осуществлялось при ежегодной рентгенографии.
- Рентгенологическое прогрессирование достоверно реже определялось у пациентов, получавших диацереин по сравнению с группой плацебо (47,3 % и 62,3 % соответственно), что подтверждает структурно-модифицирующий эффект диацереина при ОА тазобедренных суставов.
- Наиболее частым побочным явлением была диарея (46 % на диацереине против 12 % в группе плацебо), что являлось основной причиной прекращения лечения. Дополнительного лечения диарея не требовала.



# Клинические испытания

## диацереина

- В Кохрановском обзоре, опубликованном в 2006 году, обобщены данные 7 рандомизированных контролируемых исследований, опубликованных до 2004 года, включающих 2069 пациентов. Проведенный мета-анализ показал, хотя и небольшую, но постоянную эффективность диацереина при ОА. Диацереин достоверно значительно уменьшал боль по сравнению с плацебо при ОА коленных и тазобедренных суставов. Структурно модифицирующий эффект доказан для ОА тазобедренных суставов. Среди нежелательных явлений наиболее часто отмечена диарея (42%).

**Таким образом, клинические исследования показали, что диацереин является перспективным препаратом для**



# Побочные эффекты диацереина

- При повышенной чувствительности к компонентам препарата возможны аллергические реакции различной степени тяжести.
- *Со стороны пищеварительной системы:* в начальном периоде терапии возможны диарея, тошнота, рвота, боли в животе. В этом случае доза препарата может быть снижена до 1 капсулы/сут.
- Во время приема препарата возможно интенсивное окрашивание мочи от желтого до коричневого цвета (в зависимости от pH), что не требует снижения дозы (отмены) препарата.

# Противопоказания

- беременность;
- период лактации (грудного вскармливания);
- детский и подростковый возраст (до 18 лет);
- индивидуальная непереносимость компонентов препарата или повышенная чувствительность к антрахионовым препаратам (например, к слабительным средствам).

**!С осторожностью** назначают пациентам с раздражением нижних отделов кишечника, при хронической почечной недостаточности.



# Особые указания

Продолжительность терапии в зависимости от достигнутого результата может быть длительной.

До достижения терапевтического эффекта **Диацереин** следует назначать одновременно с анальгетиками и НПВС.

На фоне приема препарата требуется периодический контроль картины периферической крови и активности печеночных ферментов.

При ухудшении функции почек следует снизить дозу препарата.