

ΠΕΡΙΛΗΨΗ ΤΩΝ ΧΑΡΑΚΤΗΡΙΣΤΙΚΩΝ ΤΟΥ ΠΡΟΪΟΝΤΟΣ (SPC)

MYOBLOC**Diacerein**

Όνομασία του φαρμακευτικού προϊόντος: Myobloc

Ποιοτική & ποσοτική σύνθεση σε δραστικά συστατικά: Diacerein 50mg/cap

Φαρμακοτεχνική μορφή: Καψάκιο σκληρό

ΚΛΙΝΙΚΑ ΣΤΟΙΧΕΙΑ

Θεραπευτικές ενδείξεις: χρόνια εκφυλιστική οστεοαρθροπάθεια. Επειδή το θεραπευτικό αποτέλεσμα εκδηλώνεται με μία χρονική υστέρηση 30 περίπου ημερών από την έναρξη της αγωγής, η χορήγηση του Myobloc μπορεί να συνδυαστεί για το χρονικό αυτό διάστημα, με αναλγητικά/ αντιφλεγμονώδη αμέσου δράσεως.

Δοσολογία & τρόπος χορήγησης: λαμβάνεται από το στόμα. Προορίζεται για ενήλικες. Οι κάψουλες πρέπει να καταπίνονται όπως είναι, χωρίς να ανοιχτούν, με ένα ποτήρι νερό, κατά προτίμηση στη μέση των γευμάτων. Η συνιστώμενη δοσολογία είναι 2 κάψουλες την ημέρα, καταμεμημένες σε δύο λήψεις, 1 το πρωί και 1 το βράδυ. Στα ηλικιωμένα άτομα και σε ασθενείς με μέτριου βαθμού ηπατική ή νεφρική ανεπάρκεια, δεν υπάρχει λόγος τροποποίησης της δοσολογίας. Σε ασθενείς με νεφρική ανεπάρκεια (κάθαρση κρεατινίνης κατώτερη των 30 mL/min), η ημερήσια δοσολογία πρέπει να μειώνεται στο μισό. Η διάρκεια της θεραπευτικής αγωγής περιορίζεται στους 6 μήνες. Σε κάθε περίπτωση ο ασθενής πρέπει να συμμορφώνεται αυστηρά με τις οδηγίες του γιατρού.

Οι ανεπιθύμητες ενέργειες μπορεί να ελαχιστοποιηθούν, εφόσον χρησιμοποιούνται για την πλέον μικρή διάρκεια θεραπείας που απαιτείται για τον έλεγχο των συμπτωμάτων (βλ. παράγραφο "Ειδικές προειδοποιήσεις & ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά τη χρήση").

Αντενδείξεις: επιβεβαιωμένη δυσανεξία στη δραστική ουσία ή τα άλλα συστατικά του φαρμάκου. Βαριά καρδιακή ανεπάρκεια.

Ειδικές προειδοποιήσεις & ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά τη χρήση: το Myobloc δεν πρέπει να χορηγείται σε παιδιά ηλικίας κάτω των 15 ετών. Οι ανεπιθύμητες ενέργειες μπορούν να ελαχιστοποιηθούν, χρησιμοποιώντας την κατώτατη αποτελεσματική δόση για την πλέον μικρή διάρκεια θεραπείας που απαιτείται για τον έλεγχο των συμπτωμάτων (βλ. παράγραφο "Δοσολογία & τρόπος χορήγησης" και "Κινδύνους από το γαστρεντερικό και καρδιοαγγειακό").

Καρδιαγγειακές και αγγειακές εγκεφαλικές επιδράσεις: απαιτείται η σωστή παρακολούθησή και η παροχή συμβουλών σε ασθενείς με ιστορικό υπέρτασης και/ ή με ελαφρά έως μέτρια συμφορητική καρδιακή ανεπάρκεια, καθώς έχει αναφερθεί κατακράτηση υγρών και οίδημα σε σχέση με τη θεραπεία με ΜΣΑΦ.

Δεδομένα από κλινικές δοκιμές και επιδημιολογικές μελέτες υποδεικνύουν ότι η χρήση μερικών ΜΣΑΦ (ιδιαίτερα σε υψηλές δόσεις και σε μακροχρόνιες θεραπείες), μπορεί να συσχετίζεται με μια μικρή αύξηση του κινδύνου για εμφάνιση θρομβωτικών αρτηριακών συμβάντων (για παράδειγμα έμφραγμα του μυοκαρδίου ή εγκεφαλικό επεισόδιο). Υπάρχουν ανεπαρκείς πληροφορίες για να αποκλειστεί ένας τέτοιος κίνδυνος για το Diacerein.

Ασθενείς με μη ρυθμισμένη υπέρταση, συμφορητική καρδιακή ανεπάρκεια, εγκατεστημένη ισχαιμική καρδιακή νόσο, περιφερική αρτηριακή νόσο και/ ή αγγειακή εγκεφαλική νόσο θα πρέπει να υποβληθούν σε θεραπεία με Diacerein μόνο μετά από προσεκτική θεώρηση του θέματος. Παρόμοια θεώρηση θα πρέπει να γίνεται πριν την έναρξη μεγαλύτερης διάρκειας θεραπείας σε ασθενείς με παράγοντες κινδύνου για εμφάνιση καρδιαγγειακής νόσου (π.χ υπέρταση, υπερχοληστερόλαια, σακχαρώδης διαβήτης, κάπνισμα).

Αλληλεπιδράσεις με άλλα φάρμακα & άλλες μορφές αλληλεπιδράσεων: η δέσμευση της ρεΐνης (δραστικός μεταβολίτης της διακετυλρεΐνης) με τις πρωτεΐνες του πλάσματος δεν τροποποιείται με την παρουσία βαρφαρίνης, σαλικυλικού οξέος, ινδομεθακίνης, βαλπροϊκού νατρίου, φαινοτοΐνης, τολβουταμίδης και

χλωροπροπαμίδης.

Εξάλλου, οι κλινικές μελέτες δεν αποκάλυψαν αρνητική αλληλεπίδραση με τα μη στεροειδή αντιφλεγμονώδη, στα πλαίσια της ανοχής και της αποτελεσματικότητας.

Κύηση & γαλουχία:

Κύηση: μελέτες σε πειραματόζωα δεν αποκάλυψαν ούτε αλλοίωση της γονιμότητας ούτε δυσπλασία του εμβρύου. Εν τούτοις συνιστάται να μη χορηγείται το φάρμακο κατά την κύηση επειδή δεν υπάρχει εμπειρία από τη χρήση του σε ανθρώπους.

Γαλουχία: το φάρμακο δεν πρέπει να χορηγείται στις θηλάζουσες, αφού στη βιβλιογραφία αναφέρεται ότι διαπιστώθηκε η παρουσία μέσα στο μητρικό γάλα, σε μικρές αναλογίες, ανθρακινονικών παραγώγων.

Επίδραση στην ικανότητα οδήγησης & χειρισμού μηχανημάτων: καμιά μεταβολή ως προς την ικανότητα οδήγησης και χειρισμού μηχανημάτων δεν παρατηρείται από τη χρήση του προϊόντος.

Ανεπιθύμητες ενέργειες: η ανεπιθύμητη ενέργεια που παρατηρήθηκε πιο συχνά στη διάρκεια κλινικών δοκιμασιών, ήταν διάρροια, ελεγχόμενη γενικά, στην περίπτωση συνεχίσσεως της αγωγής. Λιγότεροι του 3% των ασθενών αναγκάστηκαν να διακόψουν την αγωγή τους εξαιτίας αυτής της ανεπιθύμητης ενέργειας, στη διάρκεια κλινικών δοκιμών. Σημειώνεται ότι το προϊόν δεν προκαλεί συνήθως γαστρική τοξικότητα. Αντίθετα η διεγερτική δράση του στη σύνθεση των προσταγλανδινών μοιάζει να μην επηρεάζει την ακεραιότητα του γαστροδωδεκαδακτυλικού βλεννογόνου. Οίδημα, υπέρταση και καρδιακή ανεπάρκεια, έχουν αναφερθεί σε σχέση με τη θεραπεία με ΜΣΑΦ. Δεδομένα από κλινικές δοκιμές και επιδημιολογικές μελέτες υποδεικνύουν ότι η χρήση κάποιων ΜΣΑΦ (ιδιαίτερα σε υψηλές δόσεις και σε μακροχρόνιες θεραπείες), μπορεί να συσχετίζεται με αυξημένο κίνδυνο για εμφάνιση θρομβωτικών αρτηριακών συμβάντων (π.χ έμφραγμα του μυοκαρδίου ή εγκεφαλικό επεισόδιο, βλ. παράγραφο "Ειδικές προειδοποιήσεις & ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά τη χρήση").

Υπερδοσολογία – Αντιμετώπιση: σε περίπτωση υπεροδοσολογίας, μπορεί να επισυμβεί έντονη διάρροια. Η επείγουσα παρέμβαση συνίσταται στη διόρθωση των υδρο-ηλεκτρολυτικών διαταραχών, εάν είναι αναγκαίο.

ΦΑΡΜΑΚΟΛΟΓΙΚΕΣ ΙΔΙΟΤΗΤΕΣ

Φαρμακοδυναμικές ιδιότητες: η διασερεΐνη παρουσιάζει μία μετρίου βαθμού αντιφλεγμονώδη δράση. Σε ισχυρές δόσεις είναι αντιφλεγμονώδες, χωρίς ιδιαίτερη ερεθιστική δράση στο στομάχι. Διαφοροποιείται από τη γνωστή κατηγορία των ΑΜΣ (αντιφλεγμονώδη μη στεροειδή) από το μηχανισμό δράσεως της που δεν έχει ακόμα επαρκώς ερμηνευθεί. Η δράση της είναι βραδεία και εκδηλώνεται γύρω στην 30^η ημέρα της αγωγής και είναι σημαντική γύρω στη 45^η ημέρα. Το αποτέλεσμα είναι αθροιστικό σε συνδυασμό με ΑΜΣ. In vitro, η διακετυλρεΐνη έδειξε τις ακόλουθες ιδιότητες: αναστολή της φαγοκυττώσεως και μεταναστεύσεων των μακροφάγων, αναστολή της παραγωγής της ιντερλευκίνης 1, μείωση της κολλαγενολυτικής δραστηριότητας.

Σε μερικά πρότυπα, η διακετυλρεΐνη διεγείρει τη σύνθεση των πρωτεογλυκανών, των γλυκοζαμινογλυκανών και του υαλουρονικού οξέος.

Ευνοϊκή δράση πάνω στους χόνδρους αναφέρθηκε σε πολλά πρότυπα πειραματόζωων.

Φαρμακοκινητικές ιδιότητες: η διακετυλρεΐνη μετά από του στόματος χορήγηση υφίσταται μεταβολισμό πρώτης διόδου και αποκετυλιούται ολικά. Η ρεΐνη περαιτέρω συζεύγνυται με θειικές ρίζες και σχηματίζεται ο θειικός της εστέρας (σουλφοσυζευγμένη).

Μετά την εφάπαξ χορήγηση 50 mg διακετυλρεΐνης η μέγιστη συγκέντρωση στο πλάσμα παρατηρείται σε 2,5 ώρες και η C_{max} είναι της τάξεως των 3 mg/L.

Η λήψη Myobloc κατά την διάρκεια των γευμάτων, αυξάνει τη βιοδιαθεσιμότητα (το εμβαδόν κάτω από την καμπύλη συγκέντρωσης στο πλάσμα/χρόνος αυξάνει

περίπου 25%) και η απορρόφηση επιβραδύνεται. Όλες οι φαρμακοκινητικές παράμετροι που παρατηρήθηκαν μετά από απλή χορήγηση είναι ανεξάρτητες της δόσεως για εύρος δόσεων 50 – 200 mg Myobloc.

Η σύνδεση με τις πρωτεΐνες είναι πολύ υψηλή (99%). Ουσιαστικά πρόκειται για μία σύνδεση ισχυρής συγγένειας με την αλβουμίνη. Η ημιπερίοδος ζωής απομάκρυνσης της ρεΐνης είναι κατά προσέγγιση 4,5 ώρες. Η συνολικά απεκκρινόμενη δια των ούρων ποσότητα είναι 30%. Η ρεΐνη απεκκρίνεται με τα ούρα κατά 80% υπό μορφή σουλφο- και γλυκουροσυζευγμένης και κατά 20% σε αμεταβόλιστη μορφή.

Σε επαναλαμβανόμενες δόσεις (50 mg X 2 την ημέρα) το Myobloc παρουσιάζει μία ασθενή συσσώρευση.

Στους ασθενείς με σοβαρή νεφρική ανεπάρκεια (κάθαρση κρεατινίνης κατώτερη των 30 ml/min), τα εμβαδά κάτω από την καμπύλη (βιοδιαθεσιμότητα) και η ημιπερίοδος ζωής απεκκρίσεως, διπλασιάζονται και η ουρική απέκκριση μειώνεται στο ήμισυ (βλέπε “Ειδικές προειδοποιήσεις & ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά τη χρήση”).

Στα ηλικιωμένα άτομα, λαμβανομένης υπ’όψιν της καλής ανοχής του προϊόντος, δεν είναι απαραίτητη η τροποποίηση της δόσεως, παρά τη βραδύτερη απέκκριση.

Προκλινικά στοιχεία για την ασφάλεια: πολυάριθμες μελέτες σε πειραματόζωα απέδειξαν την ασφάλεια της χρήσης του ιδιοσκευάσματος.

ΦΑΡΜΑΚΕΥΤΙΚΑ ΣΤΟΙΧΕΙΑ

Κατάλογος εκδόχων: Lactose monohydrate, Magnesium stearate, Gelatine, Titanium dioxide E171, Iron oxide yellow E172, Quinoline yellow E104, patent blue E131.

Ασυμβατότητες: καμία γνωστή.

Διάρκεια ζωής: 36 μήνες

Ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά τη φύλαξη του προϊόντος: να φυλάσσεται σε θερμοκρασία $\leq 25^{\circ}\text{C}$.

Φύση & συστατικά του περιέκτη: κουτί που περιέχει 3 blister των 10 καψουλών.

Οδηγίες χρήσης & χειρισμού: δεν είναι απαραίτητες.

Κάτοχος άδειας κυκλοφορίας:

Δικαιούχος: Genepharm A.E.
18ο χιλ.Λ.Μαραθώνος
153 51Παλλήνη
Αττική

Υπεύθυνος κυκλοφορίας στην Ελλάδα: Genepharm A.E.
18ο χιλ.Λ.Μαραθώνος
153 51Παλλήνη
Αττική

Αριθμός άδειας κυκλοφορίας: 39100/11-06-2007

Ημερομηνία τελευταίας αναθεώρησης του κειμένου: 12-02-2007