



디아세레인(diacerein)

요약

디아세레인은 골관절염의 염증과 통증을 관리하기 위해 사용하는 약물이다. 연골과 뼈의 조직 손상 시 연골 세포에서 나타나는 관절염 병변 과정에 복합적으로 작용하여 연골을 보호하고 연골 조직 신진대사를 촉진시킨다. 골관절염의 악화 속도를 늦추고 통증을 개선하여 염증과 통증을 관리한다.

외국어 표기	diacerein(영어)
CAS 등록번호	13739-02-1
ATC 코드	M01AX21
분자식	$C_{19}H_{12}O_8$
분자량	368.296 g/mol

동의어:

유의어·관련어: 질병 완화 골관절염 치료제, DMOADs: Disease modifying anti-osteoarthritis drugs, 골관절염 증상 발현 지연 약물, Symptomatic slow-acting drugs for osteoarthritis, 구조개선 골관절염 치료제, STMOADs: Structure-modifying osteoarthritis drugs, 아트로다, Atroda

약리작용

골관절염은 연골과 뼈에서 발생하여 통증과 운동 제한, 관절의 변형과 같은 만성 장애를 유발하는 질환이다. 생활습관이나 직업적 활동에 따라 반복되는 관절 사용에 의한 손상, 퇴행성 변화, 외상, 선천적 기형, 생화학

적 이상은 연골과 뼈의 조직 손상을 일으킨다. 조직 손상이 발생하면 골관절에서는 손상에 따른 염증 반응과 이를 보상하기 위한 연골 재생반응이 동시에 일어나게 된다. 이때 관절의 재생 속도가 손상 속도를 따라잡지 못하면서 관절연골의 손상은 점점 심화된다. 또한, 재생된 관절의 뼈와 연골의 질이 이전과 달라 구조상 변화가 나타난다. 그 결과 관절의 통증 및 운동기능 감소, 국소부위의 염증, 관절의 강직 등이 나타나게 된다.

디아세레인은 간에서 레인(Rhein)으로 대사되어 대사체인 레인에 의해 약리작용이 나타난다. 골관절에서 기질금속 단백질 분해효소*, 인터루킨-1[†]의 생산과 분비를 저해시켜 연골의 구성성분인 콜라겐과 다당단백질의 분해를 막아 연골 손상의 진행을 억제한다. 또한, 전환성장인자-베타[‡]의 발현을 촉진시켜 연골 세포 재생반응을 활성화시키고 인터루킨-1의 연골파괴 작용은 억제시킨다. 디아세레인은 연골 세포의 조직 손상 반응 및 재생반응에 관여하는 생리활성물질들의 발현을 조절하여 연골의 파괴 및 염증 반응을 저해시켜 골관절염의 악화 속도를 늦추고 통증을 개선시키고 염증을 관리한다. 프로스타글란딘[§]의 합성에 영향을 미치지 않아 위점막의 궤양이나 프로스타글란딘에 의해 조절되는 신장 혈류에 영향을 미치지 않아 신장기능 장애를 일으키지 않는다.

* 기질금속 단백질 분해효소(MMPs; Matrix MetalloProteinases): 세포의 기질을 분해하는 금속단백질 분해효소이다.

† 인터루킨-1(Interleukin-1): 백혈구에서 분비되어 다른 백혈구에 작용해 선천면역반응을 조절하는 생리활성물질이다. 면역 반응 시 가장 먼저 분비되어 염증을 유발한다.

‡ 전환성장인자 베타(Transforming growth factor-beta, TGF-β): 백혈구에서 분비되어 면역 세포와 줄기세포의 조절, 분화에 관여하는 생리활성물질이다.

§ 프로스타글란딘: 생체 내에서 합성된 생리활성물질로, 환상구조를 지닌 20개의 탄소를 포함하고 있는 불포화 지방산 유도체이다. 장이나 체액 속에 널리 분포하면서 극히 미량으로 생리작용을 한다.

효능·효과

골관절에서 나타나는 퇴행성 관절 질환과 관절증 같은 관절염에 사용한다. 골관절염의 악화 속도를 늦추고 염증과 통증을 관리한다. 고관절과 무릎관절의 관절염 증상 치료에만 이용한다. 약효가 나타나는데 수 주의 시간이 걸리기 때문에 급속도로 진행되는 고관절 관절염에는 사용하지 않는다. 경구용 캡슐로 25 mg, 50 mg 두 가지 용량으로 시판 중이다

용법

캡슐을 열어 내용물만 복용하지 않고 캡슐 통째로, 식후 복용한다. 2~4주간의 꾸준한 투약 이후 약효가 나타나기 시작한다. 성인에게 초회 용량으로 1일 50 mg을 1회 복용하며, 유지 용량으로 1일 50~100 mg을 1~2회 분할하여 복용한다. 묽은 변 또는 설사 경험이 있는 환자에게는 첫 2~4주간은 1일 1회 50 mg(저녁 식후)을 초기 용량으로 투여한다. 그 후 1일 2회 50 mg을 투여하는 것이 권장된다. 상세 내용은 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

금기

- 크론병, 과민성 대장병과 같은 염증성 대장 질환을 가진 환자, 장폐색 환자와 원인을 알 수 없는 복통을 가진 환자는 복용하지 않는다.
- 간질환을 가지고 있거나 경력이 있는 환자는 복용하지 않는다.
- 15세 미만의 소아 환자는 복용하지 않는다.

주의사항

- 디아세레인은 장 상피세포를 자극하여 때때로 설사를 유발할 수 있다. 따라서 소장, 결장 질환의 병력이 있는 환자의 경우 신중히 투여해야 하며 경우에 따라 투여하지 않는다. 과량 투여 시 심한 설사가 나타날 수 있다. 설사가 발생할 경우 투약을 중단하고 필요한 경우 전해질 공급 등의 대증요법을 실시한다. 완하제와의 병용은 피하도록 한다.
- 혈청 내 간 효소의 상승이 흔하지 않게 나타날 수 있다. 따라서 복용 시 알코올 섭취를 제한해야 한다. 간 손상과 관련된 다른 의약품과 같이 복용하는 경우 주의가 필요하다. 간 손상의 징후 또는 증상이 발견되면 투약을 중단하고 의사의 지시를 따른다.

부작용

- 디아세레인 투여 시 발생 가능한 주요 부작용은 다음과 같다. 그 외 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다. 부작용이 발생하면 의사, 약사 등 전문가에게 알려 적절한 조치를 취할 수 있도록 한다.
- 빈도는 확인되지 않았으나 피부 발진, 습진, 가려움증 등이 발생할 수 있다.
- 설사, 묽은 변, 복통 등이 나타날 수 있다. 복용을 시작하고 2주 이내에 자주 발생하며, 장기 복용 시에는 발생 빈도가 줄어든다. 단, 장기 복용 시에는 출혈, 궤양 및 천공과 같은 위장장애가 나타날 수 있으며 드물게 직장 점막의 색소 침착이 나타나기도 한다. 설사가 발생할 때 심한 경우 탈수와 저칼륨혈증으로 이어질 수 있다.
- 드물게 간 기능 이상을 유발할 수 있다. 혈청 내 간 효소 수치의 상승이 흔하지 않게 나타날 수 있다.

상호작용

디아세레인과 함께 투여 시 상호작용을 일으킬 수 있는 약물은 다음과 같다.

상호작용	약물
디아세레인의 효과를 감소시키는 약물	칼슘, 마그네슘, 알루미늄 함유 제산제 및 소금
디아세레인에 의해 부작용이 증가되는 약물	강심배당체(디기톡신, 디곡신), 이노제

소아, 청소년 사용

디아세레인은 15세 미만의 소아 환자에게는 투여하지 않는다.

고령자 사용

65세 이상 노인의 경우 설사 등의 이상반응이 발생할 우려가 높아 사용을 피하거나 감량 사용을 권장한다.
감량하여 투여하는 경우 일반 성인 용량의 1/2로 감량한다.

임부·수유부 사용

동물실험 시 태자의 골형성 지연이 보고 되었고, 모유로 소량 이행하기 때문에 임부 또는 임신하고 있을 가능성이 있는 여성 및 수유부에는 투여하지 않는 것이 바람직하다.