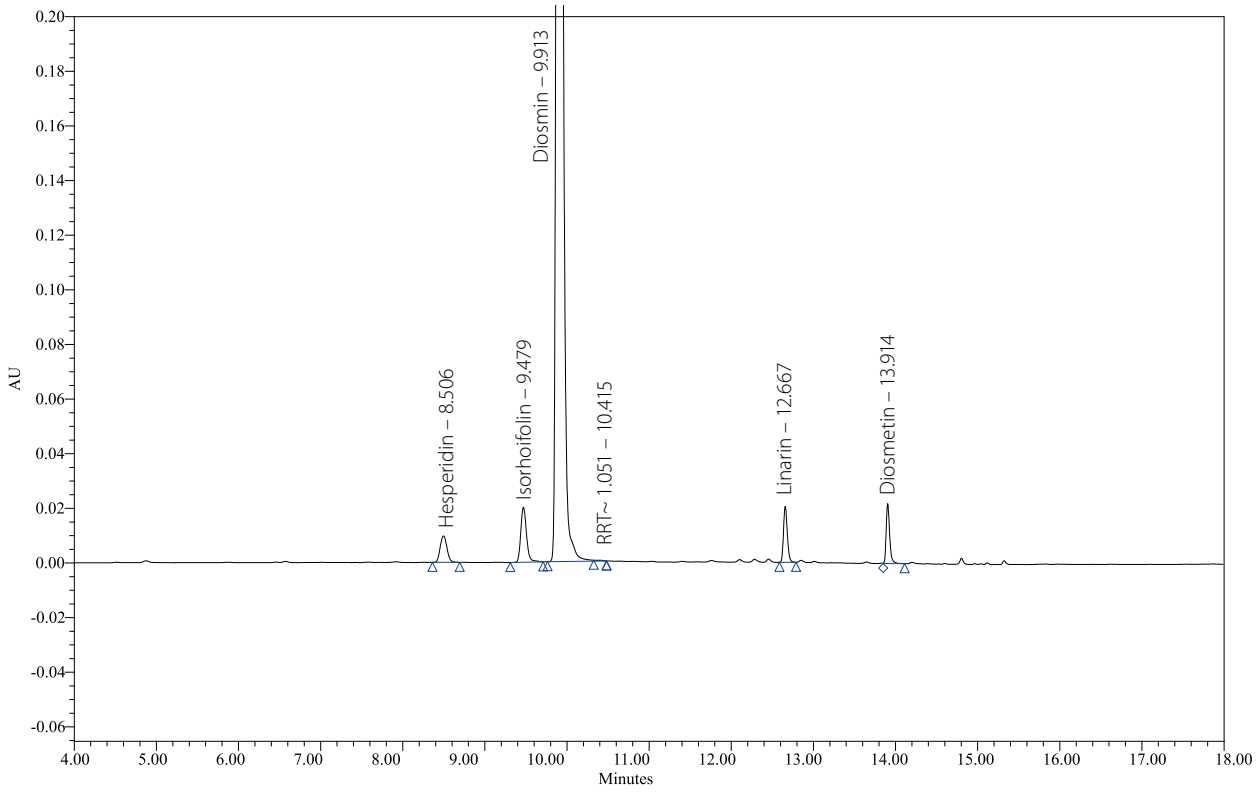
Chromatografický záznam složení tablety Diozen 500 mg



Pohled farmaceuta na výsledky laboratorních testů složení přípravku Diozen

Diosmin patří svým farmakologickým účinkem mezi venofarmaka neboli látky ovlivňující chronickou žilní insuficienci. Mezi jeho benefity patří zlepšení žilního tonu, antioxidační a protizánětlivé účinky. Svou chemickou strukturou je diosmin řazen do skupiny flavonoidů, látek přírodního původu vyskytujících se ve víně, ovoci, čaji, kávě či zelenině. Pokud jde konkrétně o diosmin, ten je syntetizován z extraktu získaného z oplodí (slupek) pomeranče. Prvním krokem k získání účinné látky je extrakce hesperidinu a dalších flavonoidů z pomerančů. Extrahovaný hesperidin dále podstupuje chemickou reakci, při níž jsou mu odebrány dva atomy vodíku a v molekule vzniká dvojná vazba, probíhá tedy dehydrogenace a výsledným produktem je diosmin. Vzhledem k tomu, že hesperidin není jediným flavonoidem obsaženým v pomerančové kůře, a navíc chemická reakce neprobíhá stoprocentně, obsahuje tímto způsobem získaný produkt kromě diosminu i další flavonoidy s podobným účinkem (1). Jedná se o takzvané povolené nečistoty, které jsou i se svými limity definovány v příslušném článku Evropského lékopisu. Patří sem hesperidin (4,0 %), isorhoifolin (3,0 %), linarin (3,0 %) a diosmetin (2,0 %). Abychom mohli výsledný produkt nazývat diosminem, celkové množství těchto nečistot nesmí přesáhnout obsah 8,5 %, obsah diosminu je tedy alespoň 91,5 % (2).

Co se týče klinického využití diosminu pro rutinní podávání pacientům v léčbě chronické žilní insuficience, problémem je jeho nedostatečná absorpce z trávicího traktu po perorálním podání. Jako optimální řešení se jeví následná technologická úprava diosminu mikronizací. Jedná se o rozdrobnění na menší částice, které se lépe rozpouštějí, a účinná látka je proto rychleji a ve větší míře absorbována skrze střevní stěnu. Že je proces mikronizace vysoce efektivní, ukazují i doporučené postupy pro léčbu chronické žilní insuficience. Zde je mikronizovaná purifikovaná flavonoidní frakce řazena na první místo mezi venofarmaky s největší silou důkazů 1B, na rozdíl od nemikronizovaného diosminu, kde je síla důkazů 2C, tedy nízká (3).

SmPC léčivého přípravku Diozen uvádí, že účinnou látkou tohoto přípravku je mikronizovaný diosmin (4), což dle definice Evropského lékopisu znamená, že je přípravek složen z flavonoidní směsi diosminu, hesperidinu, isorhoifolinu, linarinu, diosmetinu a případně dalších flavonoidů. Přípravek Diozen je přírodního původu a prochází purifikací (přečištěním) a mikronizací. Z uvedených faktů vyplývá, že přípravek obsahuje mikronizovanou purifikovanou flavonoidní směs se specifikovaným obsahem diosminu alespoň 91,5 % (zbylá procenta pak představují ostatní flavonoidy: hesperidin, isorhoifolin, linarin a diosmetin). Pro zjištění přesného obsahu jednotlivých flavonoidů v přípravku Diozen byla vypracována