ЛП-№(003622)-(РГ-RU) от 02.02.2026

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

▼ Данный лекарственный препарат подлежит дополнительному мониторингу. Это позволит быстро выявить новую информацию по безопасности. Мы обращаемся к специалистам системы здравоохранения с просьбой сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях. Порядок сообщения о нежелательных реакциях представлен в разделе 4.8.

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лусефи, 2,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Лусефи, 5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лусеоглифлозин

Лусефи, 2,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 2,5 мг лусеоглифлозина (в виде гидрата).

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4.).

Лусефи, 5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 5 мг лусеоглифлозина (в виде гидрата).

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Лусефи, 2,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета.

Лусефи, 5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Лусефи показан к применению у взрослых пациентов с сахарным диабетом 2 типа в дополнение к диете и физическим упражнениям для улучшения гликемического контроля:

- в качестве монотерапии;
- в составе комбинированной терапии с другими гипогликемическими препаратами: метформином, тиазолидиндионами, производными сульфонилмочевины, ингибиторами дипептидилпептидазы-4, ингибиторами альфа-глюкозидазы, глинидами, аналогами

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1), препаратами инсулина (см. разделы 4.4., 4.5. и 5.1.).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Рекомендуемая доза лусеоглифлозина составляет 2,5 мг 1 раз в сутки. При недостаточном эффекте суточная доза может быть увеличена до 5 мг 1 раз в сутки при условии тщательного наблюдения за динамикой клинической картины.

Следует соблюдать осторожность при совместном применении с другими гипогликемическими препаратами (в частности, при совместном применении с производными сульфонилмочевины, препаратами инсулина или агонистами рецепторов ГПП-1) в связи с риском развития гипогликемии. С целью снижения риска развития гипогликемии необходимо рассмотреть снижение дозы производного сульфонилмочевины, препарата инсулина или аналога ГПП-1 (см. разделы 4.5. и 4.8.).

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Применение препарата Лусефи у пациентов с почечной недостаточностью средней тяжести (30 мл/мин/1,73 м^2 ≤ рСКФ (расчетная скорость клубочковой фильтрации) ≤ 59 мл/мин/ 1,73 м^2) возможно только после тщательной оценки соотношения ожидаемой пользы терапии к возможному риску, ввиду возможного снижения гипогликемического действия лусеоглифлозина у таких пациентов (см. раздел 4.4.).

Прием препарата Лусефи противопоказан у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (рСКФ < 30 мл/мин/1,73 м^2), терминальной стадией хронической почечной недостаточности (ХПН) или находящихся на диализе, в связи с прогнозируемым отсутствием эффекта от проводимой терапии в этих популяциях (см. раздел 4.3.).

Коррекция дозы лусеоглифлозина при почечной недостаточности легкой степени тяжести не требуется.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Клинические данные по эффективности и безопасности применения лусеоглифлозина у пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени тяжести отсутствуют. Безопасность у данной категории пациентов не установлена. Данные отсутствуют.

Коррекция дозы лусеоглифлозина при печеночной недостаточности легкой и средней степени тяжести не требуется.

Лица пожилого возраста

Поскольку физиологические функции у лиц пожилого возраста обычно снижаются, препарат Лусефи следует применять с осторожностью и при условии тщательного наблюдения за состоянием пациента.

Поскольку выявление симптомов дегидратации (включая жажду) у пациентов пожилого возраста может быть затруднено, следует проявлять особое внимание при лечении данной категории пациентов (см. раздел 4.4.).

Дети

Безопасность и эффективность лусеоглифлозина у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь, до или после завтрака, запивая водой.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к лусеоглифлозину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- Сахарный диабет 1 типа.
- Беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.).
- Почечная недостаточность тяжелой степени (рСКФ < 30 мл/мин/1,73 м^2), терминальная стадия ХПН или проведение диализа, в связи с прогнозируемым отсутствием эффекта от проводимой терапии в этих популяциях пациентов.
- Диабетический кетоацидоз, диабетическая кома и прекома (терапия не показана ввиду необходимости быстрой коррекции гипергликемии посредством инфузионной терапии и/или введением инсулина).
- Тяжелые инфекционные заболевания, пред- и постоперационный период, тяжелые травмы (терапия не показана, поскольку для контроля гликемии требуется инсулинотерапия).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Общие

Возможность применения препарата Лусефи может быть рассмотрена только в случае недостаточной эффективности диеты и физических упражнений, которые лежат в основе терапии сахарного диабета. При применении препарата Лусефи необходимо регулярно проверять концентрацию глюкозы, содержание гликированного гемоглобина в крови и другие показатели. Если после 3 месяцев применения не удается достичь адекватного гликемического контроля, следует рассмотреть переход на другой вид терапии. Препарат Лусефи может быть назначен только пациентам, у которых подтверждён диагноз сахарного диабета 2 типа.

Нарушение функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью средней тяжести (30 мл/мин/1,73 м^2 ≤ рСКФ ≤ 59 мл/мин/1,73 м^2) имеется вероятность недостаточной эффективности лусеоглифлозина, в связи с чем применение препарата возможно только после тщательной оценки соотношения ожидаемой пользы терапии к возможному риску. При применении препарата Лусефи может отмечаться повышение концентрации креатинина в сыворотке или снижение рСКФ. Необходимо регулярно контролировать функцию почек во время терапии препаратом Лусефи, особенно у пациентов с нарушением функции почек (см. разделы 4.2., 5.1. и 5.2.).

Нарушение функции печени

Клинические данные по эффективности и безопасности применения лусеоглифлозина у пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени отсутствуют.

Повышенный риск снижения объема циркулирующей крови и развития дегидратации

Препарат Лусефи следует применять с осторожностью у пациентов с повышенным риском развития дегидратации: пожилого возраста, с выраженной декомпенсацией сахарного диабета, получающих диуретики.

Применение препарата Лусефи может приводить к полиурии или поллакиурии вследствие его диуретического эффекта. При обнаружении таких нарушений, как обезвоживание, снижение артериального давления, необходимо прекратить прием препарата, обеспечить восполнение объёма жидкости, а также принять другие соответствующие меры. При лечении пациентов с повышенным риском развития гиповолемии (пациентов пожилого возраста или получающих диуретики) следует обращать особое внимание на появление симптомов обезвоживания, диабетического кетоацидоза, гипергликемического гиперосмолярного синдрома,

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

тромбоэмболии, в том числе ишемического инсульта и т.д. (см. разделы 4.2., 4.5., 4.8.).

Инфекции мочевыводящих путей и генитальные инфекции

Препарат Лусефи следует применять с осторожностью у пациентов с инфекциями мочевыводящих путей или генитальными инфекциями (возможно усугубление симптомов).

На фоне терапии препаратом Лусефи существует риск развития инфекций мочевыводящих путей, которые могут привести к пиелонефриту и сепсису. Существует также риск развития кандидозного вульвовагинита и других генитальных инфекций. Необходимо тщательное наблюдение для выявления признаков и симптомов инфекций мочевыводящих путей и генитальных инфекций. При подозрении на инфекцию мочевыводящих путей или генитальную инфекцию следует рассмотреть необходимость прекращения терапии лусеоглифлозином и немедленно начать соответствующее лечение (см. раздел 4.8.). Пациентов следует предупредить о возможном риске развития бактериальных и грибковых инфекций мочевыводящих путей и половых органов.

Некротизирующий фасциит промежности (гангрена Фурнье)

В пострегистрационном периоде применения ингибиторов натрийзависимых переносчиков глюкозы 2-го типа (ингибиторов НГЛТ-2) у пациентов женского и мужского пола сообщалось о случаях некротизирующего фасциита промежности (также известного как гангрена Фурнье), редкой, но серьезной и опасной для жизни некротизирующей инфекции, требующей неотложного хирургического вмешательства и применения антибиотиков. Серьезные исходы некротизирующего фасциита промежности включали госпитализацию, множественные хирургические вмешательства и смерть. Пациенту, получающему терапию ингибитором НГЛТ-2, в случае появления таких симптомов как боль или болезненная чувствительность, гиперемия, отек в области половых органов или промежности, лихорадка, недомогание, следует немедленно обратиться к врачу. Известно, что некротизирующему фасцииту может предшествовать урогенитальная инфекция или абсцесс промежности. При подозрении на некротизирующий фасциит прием препарата Лусефи следует немедленно прекратить, незамедлительно должна быть начата терапия антибиотиками широкого спектра действия с иссечением, в случае необходимости, некротических тканей.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

При проявлении у пациентов таких симптомов, как затруднённое мочеиспускание, олигурия, задержка мочеиспускания или анурия, необходимо в первую очередь купировать эти симптомы и рассмотреть целесообразность терапии другими гипогликемическими препаратами.

Диабетический кетоацидоз

Усиление экскреции глюкозы с мочой, обусловленное механизмом действия лусеоглифлозина, может приводить к повышению метаболизма жирных кислот и развитию кетоза, и в итоге – кетоацидоза, даже при надлежащем гликемическом контроле (см. раздел 4.8.).

Поскольку в таких ситуациях выраженного повышения концентрации глюкозы в крови может не наблюдаться, следует тщательно наблюдать за пациентами на предмет развития указанных ниже состояний.

При развитии таких симптомов, как быстрая потеря массы тела, тошнота, рвота, снижение аппетита, общее недомогание, боль в животе, выраженное чувство жажды, одышка, нарушение сознания, дезориентация, немотивированная утомляемость или сонливость, запах ацетона в выдыхаемом воздухе пациенты должны немедленно обратиться за медицинской помощью. Необходимо незамедлительно провести соответствующие обследования, включая анализ на содержание кетоновых тел в крови или моче, независимо от концентрации глюкозы в крови. При выявлении отклонений применение лусеоглифлозина должно быть немедленно

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

прекращено или временно приостановлено. Пациенту должна быть назначена соответствующая терапия.

В частности, в связи в повышенным риском развития кетоацидоза, пациенты в следующих ситуациях должны находиться под тщательным медицинским наблюдением: нарушение секреции инсулина, снижение дозы инсулина, прекращение инсулинотерапии, значительное ограничение поступления углеводов в организм, недостаточное питание, инфекция, дегидратация.

Были зарегистрированы случаи, когда экскреция глюкозы с мочой и кетоацидоз сохранялись дольше, чем ожидалось, исходя из периода полувыведения ингибиторов НГЛТ-2 из плазмы крови после прекращения их применения, включая данный лекарственный препарат. Следует тщательно наблюдать за пациентами, проводя определение концентрации глюкозы в моче при необходимости.

В случае обширного хирургического вмешательства или госпитализации в связи с острым серьезным заболеванием применение лусеоглифлозина должно быть временно приостановлено. Терапия лусеоглифлозином может быть возобновлена при стабилизации состояния пациента.

Гипогликемия

Риск развития гипогликемии повышен при совместном применении с другими гипогликемическими препаратами. Перед началом комбинированной терапии с производными сульфонилмочевины, препаратами инсулина или агонистами рецепторов ГПП-1 необходимо рассмотреть снижение дозы данных препаратов для уменьшения риска развития гипогликемии.

При возникновении симптомов гипогликемии необходимо принять соответствующие меры (съесть кусочек сахара; принять напитки или соки, содержащие сахар, пищу с быстроусваиваемыми углеводами). При развитии гипогликемии, обусловленной совместным применением препарата Лусефи с ингибиторами альфа-глюкозидазы, необходимо обеспечить приём пациентом глюкозы (см. разделы 4.5., 4.8. и 5.1.).

Влияние на лабораторные данные

Вследствие механизма действия лусеоглифлозина результаты анализа мочи на глюкозу у пациентов, принимающих данный препарат, будут положительными. Следует учитывать, что при применении препарата Лусефи снижается концентрация 1,5-ангидроглюцитола (1,5-АГ) в сыворотке крови. Результаты исследований глюкозы в моче и 1,5-АГ в сыворотке крови во время терапии лусеоглифлозином не отражают концентрацию глюкозы в крови и не могут использоваться для контроля гликемии.

Гипофизарная и надпочечниковая недостаточность

Препарат Лусефи следует применять с особой осторожностью у пациентов с гипофизарной и/или надпочечниковой недостаточностью.

Алкоголь

Препарат Лусефи следует применять с осторожностью у пациентов, злоупотребляющих алкоголем ввиду риска развития у них гипогликемии или кетоацидоза.

Интенсивная физическая нагрузка

Препарат Лусефи следует применять с особой осторожностью при интенсивных физических нагрузках ввиду риска развития гипогликемии.

Нерегулярное и/или несбалансированное питание

Препарат Лусефи следует применять с особой осторожностью при неполноценном питании и

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

голодании, нерегулярном приеме пищи, недостаточном усвоении пищи или при ослабленном состоянии ввиду риска развития гипогликемии.

Снижение массы тела

Ввиду сообщений о снижении массы тела на фоне применения препарата Лусефи, необходимо контролировать и предотвращать избыточное снижение массы тела.

Ампутация нижних конечностей

Увеличение частоты ампутации нижних конечностей (в первую очередь пальцев стопы) наблюдалось в долгосрочных клинических исследованиях с применением другого ингибитора НГЛТ-2. Неизвестно, является ли это нежелательным эффектом препаратов класса ингибиторов НГЛТ-2. В связи с чем пациентам с сахарным диабетом, в том числе получающим терапию ингибиторами НГЛТ-2, следует рекомендовать постоянный тщательный профилактический уход за стопами в обязательном порядке.

Вспомогательные вещества

Препарат Лусефи содержит лактозы моногидрат. Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Фармакодинамическое взаимодействие

Гипогликемические препараты (производные сульфонилмочевины, бигуаниды, тиазолидиндионы, ингибиторы дипептидилпептидазы-4 (ДПП-4), ингибиторы альфа-глюкозидазы, стимуляторы секреции инсулина (глиниды), агонисты рецепторов ГПП-1, препараты инсулина и др.)

Поскольку применение данных препаратов может увеличить риск развития гипогликемии, их следует назначать при условии тщательного контроля концентрации глюкозы в плазме крови и мониторинга состояния пациента. При совместной терапии с производными сульфонилмочевины, препаратами инсулина или агонистами рецепторов ГПП-1 необходимо рассмотреть снижение дозы данных препаратов для уменьшения риска развития гипогликемии (см. разделы 4.4. и 4.8.).

Лекарственные препараты, усиливающие гипогликемический эффект (бета-блокаторы, производные салициловой кислоты, ингибиторы моноаминоксидазы, фибраты и др.)

Совместное применение с данными препаратами может увеличить риск развития гипогликемии, поэтому при их применении следует контролировать концентрацию глюкозы в крови и другие параметры состояния пациента.

Лекарственные препараты, ослабляющие гипогликемический эффект (адреналин, гормоны коры надпочечников, гормоны щитовидной железы и др.)

Совместное применение с данными препаратами может снизить гипогликемический эффект препарата Лусефи, поэтому при их применении следует контролировать концентрацию глюкозы в плазме крови и другие параметры состояния пациента.

Диуретики («петлевые» диуретики, тиазидные диуретики и др.)

При совместном применении диуретиков с препаратом Лусефи мочегонный эффект может усиливаться, поэтому следует соблюдать осторожность и при необходимости корректировать дозу диуретиков (см. раздел 4.4.).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Фармакокинетическое взаимодействие

В исследованиях было установлено, что метаболизм лусеоглифлозина осуществляется главным образом посредством изоферментов CYP (системы цитохрома P450): CYP3A4/5, 4A11, 4F2, 4F3B и фермента UGT1A1 (*in vitro*) (см. раздел 5.2.).

Влияние других лекарственных препаратов на лусеоглифлозин

Исследования по изучению взаимодействия с участием здоровых добровольцев показали, что глимепирид, метформин, воглибоза, миглитол, пиоглитазон, ситаглиптин, фуросемид и гидрохлоротиазид не оказывают клинически значимого влияния на фармакокинетику лусеоглифлозина при их совместном применении (см. раздел 5.2.).

Влияние лусеоглифлозина на другие лекарственные препараты

Исследования по изучению взаимодействия с участием здоровых добровольцев показали, что лусеоглифлозин не оказывает клинически значимого влияния на фармакокинетику глимепирида, метформина, воглибозы, миглитола, пиоглитазона, ситаглиптина, фуросемида и гидрохлоротиазида при их совместном применении (см. раздел 5.2.).

Дети

Исследования взаимодействия проведены только у взрослых.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Препарат Лусефи противопоказан во время беременности. Клинических данных по эффективности и безопасности применения лусеоглифлозина у беременных нет. При диагностировании или планировании беременности пациентка должна быть переведена на инсулинотерапию. В исследованиях на животных (крысах) было выявлено, что лусеоглифлозин проникает в организм плода (см. раздел 5.3.).

Лактация

В исследованиях на животных (крысах) было показано, что лусеоглифлозин проникает в молоко лактирующих животных. Таким образом, применение препарата Лусефи в период грудного вскармливания противопоказано (см. раздел 4.3.). В случае необходимости терапии лусеоглифлозином грудное вскармливание следует прекратить.

Фертильность

Данные о влиянии лусеоглифлозина на фертильность отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Лусефи не оказывает или оказывает несущественное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Тем не менее пациентам следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе с механизмами, а также при осуществлении высотных работ, так как при применении препарата Лусефи возможно возникновение симптомов гипогликемии.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

По результатам клинических исследований у пациентов с сахарным диабетом 2 типа в Японии нежелательные реакции были зарегистрированы у 236 пациентов из 1262 (18,7 %). Основными

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

нежелательными реакциями были поллакиурия (35 случаев – 2,8 %); гипогликемия (30 случаев – 2,4 %); увеличение бета-2-микроглобулина в моче (26 случаев – 2,1 %).

Табличное резюме нежелательных реакций

Частота нежелательных реакций, наблюдавшихся во время клинических исследований и при пострегистрационном наблюдении, приведена в виде следующей градации по системно-органным классам:

Очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, но <1/10), нечасто (≥1/1000, но <1/100), редко (≥1/10000, но <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Таблица 1. Нежелательные реакции по результатам клинических исследований и при пострегистрационном наблюдении

Перечень системно-органных классов (СОК)	**Частота**		
	Часто	**Нечасто**	**Частота неизвестна**
Инфекции и инвазии	цистит	кандидоз половых органов, инфекции мочевыводящих путей, пиелонефрит, генитальные инфекции	сепсис, некротизирующий фасциит промежности (гангрена Фурнье)
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы		полицитемия	
Нарушения метаболизма и питания	гипогликемия	дегидратация	кетоацидоз (включая диабетический кетоацидоз)
Нарушения со стороны нервной системы		постуральное головокружение, головокружение, головная боль	сонливость
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта			вертиго
Нарушения со стороны сосудов		артериальная гипотензия	
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	запор	диарея, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, боль в животе, вздутие живота	тошнота, рвота, дискомфорт в области живота
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей		кожная сыпь, экзема	кожный зуд, крапивница
Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани		мышечные спазмы	
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей	поллакиурия	полиурия	

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Перечень системно-органных классов (СОК)	**Частота**		
	Часто	**Нечасто**	**Частота неизвестна**
Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез		генитальный зуд	баланопостит
Общие нарушения и реакции в месте введения		жажда, общее недомогание	вялость, чувство голода
Лабораторные и инструментальные данные	увеличение кетоновых тел в крови, увеличение β2-микроглобулина в моче, положительный тест на лейкоциты в моче, положительная реакция на альбумин в моче	увеличение концентрации С-реактивного белка, повышение числа лейкоцитов в крови, увеличение гематокрита, увеличение концентрации гемоглобина, положительная реакция на кетоновые тела в моче, положительная реакция при бактериологическом исследовании мочи, положительная реакция на кровь в моче, положительная реакция на белок в моче, положительный тест на эритроциты в моче, увеличение концентрации N-ацетилглюкозаминидазы	снижение массы тела, увеличение концентрации креатинина в плазме крови

Описание отдельных нежелательных реакций

Серьезные нежелательные реакции

Гипогликемия (часто): при совместном применении с другими гипогликемическими препаратами (в частности, производными сульфонилмочевины, инсулином или аналогами рецепторов ГПП-1) имеется повышенный риск развития гипогликемии. Сообщалось также о случаях развития гипогликемии при монотерапии препаратом Лусефи (см. разделы 4.4., 4.5., 5.1.).

Пиелонефрит (нечасто) и *сепсис* (частота неизвестна) (см. раздел 4.4.).

Некротизирующий фасциит промежности (гангрена Фурнье) (частота неизвестна)

На фоне применения препаратов ингибиторов НГЛТ-2 сообщалось о случаях некротизирующего фасциита промежности (гангрены Фурнье) у пациентов женского и мужского пола (см. раздел 4.4.).

Дегидратация (нечасто) (см. раздел 4.4.).

Кетоацидоз (частота неизвестна) (см. раздел 4.4.).

Дети

Безопасность и эффективность лусеоглифлозина у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлена (опыт применения у данной категории пациентов отсутствует).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: http://www.roszdravnadzor.gov.ru/

Республика Казахстан

РГП на ПХВ «Национальный центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитета медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

Адрес: 010000, г. Астана, район Байконыр, ул. А. Иманова, 13 (БЦ «Нурсаулет 2»)

Телефон: +7 (7172) 235-135

Электронная почта: farm@dari.kz

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: http://www.ndda.kz

Кыргызская Республика

Департамент лекарственных средств и медицинских изделий при Министерстве Здравоохранения Кыргызской Республики

Адрес: 720044, г. Бишкек, ул. 3-я Линия, 25

Телефон: +996 (312) 21-92-78

Электронная почта: pharm@dlsmi.kg

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: http://dlsmi.kg

Республика Армения

ГНКО «Центр экспертизы лекарств и медицинских технологий»

Адрес: 0051, г. Ереван, пр. Комитаса, 49/5

Телефон: (+374 60) 83-00-73, (+374 10) 23-08-96, (+374 10) 23-16-82

Горячая линия отдела мониторинга безопасности лекарств: (+374 10) 20-05-05, (+374 96) 22-05-05

Электронная почта: info@ampra.am, vigilance@pharm.am

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: http://pharm.am

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

Адрес: 220037, г. Минск, Товарищеский пер., д. 2а.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Телефон: +375 (17) 242-00-29

Факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: http://www.rceth.by

4.9. Передозировка

Симптомы

Однократный прием лусеоглифлозина в дозах до 25 мг (в 5 раз выше рекомендуемой суточной дозы) у здоровых добровольцев в целом хорошо переносился.

Лечение

В случае передозировки необходимо проводить поддерживающую терапию, учитывая состояние пациента. Выведение лусеоглифлозина с помощью гемодиализа не изучалось.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения сахарного диабета; гипогликемические средства, кроме инсулинов; ингибиторы натрийзависимого переносчика глюкозы 2-го типа.

Код АТХ: A10BK07

Механизм действия

Лусеоглифлозин снижает концентрацию глюкозы в плазме крови посредством ингибирования натрийзависимого переносчика глюкозы 2-го типа (НГЛТ-2), участвующего в реабсорбции глюкозы в проксимальных почечных канальцах, а также обеспечивает экскрецию избыточной глюкозы крови с мочой.

Лусеоглифлозин селективно ингибирует захват глюкозы, опосредованной НГЛТ-2 (НГЛТ-2-гиперэкспрессирующие клетки) (константа ингибирования Ki = 1,1 нмоль/л) *(in vitro*).

Фармакодинамические эффекты

Экскреция глюкозы с мочой

В моделях сахарного диабета 2 типа (СД2) на фоне ожирения (крысы линии Zucker Fatty и мыши линии db/db) однократное пероральное введение препарата увеличивало экскрецию глюкозы с мочой (через 8 или 24 часов после приема). В модели СД2 без сопутствующего ожирения (крысы линии GK) добавление препарата к рациону животных на протяжении 20 недель увеличивало экскрецию глюкозы с мочой (в течение 24 часов после применения).

Лусеоглифлозин увеличивал экскрецию глюкозы с мочой в течение 24 часов после приема по сравнению с плацебо в исследовании с участием пациентов с СД2, получавших лусеоглифлозин в дозе 2,5 или 5 мг или плацебо перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 7 дней.

Гипогликемическое действие

В модели СД2 на фоне ожирения (крысы линии Zucker Fatty) однократный пероральный прием препарата подавлял повышение концентрации глюкозы в плазме в пробе с нагрузкой глюкозой. В другой модели СД2 на фоне ожирения (у мышей линии db/db) при многократном пероральном приеме препарата 1 раз в сутки на протяжении 4 недель снижалось изменение

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

концентрации гликированного гемоглобина (HbA1c) относительно исходного значения. В модели СД2 без сопутствующего ожирения (крысы линии GK) добавление препарата к рациону животных на протяжении 20 недель снижало концентрацию HbA1c.

Лусеоглифлозин уменьшал площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) глюкозы в плазме через 4 часа после завтрака, обеда или ужина и концентрацию глюкозы в плазме натощак по сравнению с плацебо в исследовании с участием пациентов с СД2, получавших лусеоглифлозин в дозе 2,5 или 5 мг или плацебо перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 7 дней.

Другие эффекты

Предусмотренное основным механизмом действия лусеоглифлозина дополнительное выведение глюкозы почками вызывает потерю калорий, что сопровождается уменьшением объема жировой ткани и снижением массы тела. Это подтверждено в исследованиях: снижение массы тела в среднем на 1,97 кг за 24 недели терапии. Также отмечается снижение концентрации триглицеридов крови.

Глюкозурия, обусловленная механизмом действия лусеоглифлозина, сопровождается небольшим увеличением осмотического диуреза, что может привести к сокращению внутрисосудистого объема и, как следствие, может способствовать умеренному снижению артериального давления: систолического от -2,5 до -6,5 мм рт. ст., диастолического от -1,9 до -3,5 мм рт. ст., в зависимости от исходного индекса массы тела пациента.

Отмечалась корреляция между увеличением экскреции мочевой кислоты с мочой и снижением концентрации мочевой кислоты в плазме крови у здоровых мужчин. В клиническом исследовании эффективности и безопасности терапии лусеоглифлозином снижение концентрации мочевой кислоты в плазме крови составляло -0,83 мг/дл ко 2 неделе, -0,70 мг/дл к 12 неделе и -0,62 мг/дл к 52 неделе приема препарата.

Клиническая эффективность и безопасность

Монотерапия

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме крови которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты и физических нагрузок (280 пациентов), получали лусеоглифлозин в дозе 1 мг, 2,5 мг, 5 мг, 10 мг или плацебо перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 12 недель. При сравнении изменений относительно значения до применения препарата, лусеоглифлозин значимо снижал концентрацию HbA1c по сравнению с плацебо (HbA1c определяли в соответствии с рекомендациями Национальной программы по стандартизации измерений концентрации гликированного гемоглобина (NGSP)).

Таблица 2. Результаты двойного слепого плацебо-контролируемого исследования (исследование по определению диапазона дозы)

	Монотерапия		
	Плацебо	Лусеоглифлозин 2,5 мг	Лусеоглифлозин 5 мг
N	57	56	54
HbA1c (значение по NGSP) (%)			
Исходное значение[1]	7,92 ± 0,84	8,05 ± 0,75	7,86 ± 0,69
Изменение относительно исходного значения[2]	0,22 [0,10, 0,34]	- 0,39 [-0,51, -0,27]	- 0,46 [-0,58, -0,34]
Отличие от плацебо[2]	-	- 0,61[#] [-0,78, -0,44]	-0,68[#] [-0,85, -0,51]
Концентрация глюкозы в плазме натощак (мг/дл)			
Изменение относительно исходного значения[2]	8,1 [2,6, 13,6]	-16,8 [-22,3, -11,3]	-21,0 [-26,7, -15,3]

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

	Монотерапия		
	Плацебо	Лусеоглифлозин 2,5 мг	Лусеоглифлозин 5 мг
N	57	56	54
Отличие от плацебо[2]	-	-24,9[#] [-32,7, -17,1]	-29,1[#] [-37,0, -21,2]
Постпрандиальная концентрация глюкозы в плазме через 2 часа (мг/дл)			
Изменение относительно исходного значения[2]	3,7 [-6,8, 14,3]	-52,7 [-63,5, -41,9]	-55,4 [-66,5, -44,3]
Отличие от плацебо[2]	-	-56,4[#] [-71,6, -41,3]	-59,2[#] [-74,5, -43,8]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, рассчитанное методом наименьших квадратов

[#] p < 0,001 (метод неограниченных пределов среднего с использованием исходного значения в качестве ковариаты), двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты и физических нагрузок (158 пациентов), получали лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или плацебо перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 24 недель. При сравнении изменений относительно значения до применения препарата, лусеоглифлозин значимо снижал концентрации HbA1c по сравнению с плацебо (HbA1c определяли в соответствии с рекомендациями Национальной программы по стандартизации измерений концентрации гликированного гемоглобина (NGSP)).

Таблица 3. Результаты двойного слепого плацебо-контролируемого исследования (контрольное исследование)

	Монотерапия	
	Плацебо	Лусеоглифлозин 2,5 мг
N	79	79
HbA1c (значение по NGSP) (%)		
Исходное значение[1]	8,17 ± 0,80	8,14 ± 0,91
Изменение относительно исходного значения[2]	0,13 [-0,04, 0,29]	-0,63 [-0,79, -0,46]
Отличие от плацебо[2]	-	-0,75[#] [-0,99, -0,52]
Концентрация глюкозы в плазме крови натощак (мг/дл)		
Изменение относительно исходного значения[2]	-0,8 [-5,4, 3,7]	-28,3 [-32,9, -23,8]
Отличие от плацебо[2]	-	-27,5[#] [-33,9, -21,1]
Постпрандиальная концентрация глюкозы в плазме крови через 2 часа (мг/дл)		
Изменение относительно исходного значения[2]	1,1 [-8,0, 10,1]	-55,8 [-64,7, -46,8]
Отличие от плацебо[2]	-	-56,8[#] [-69,6, -44,1]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, рассчитанное методом наименьших квадратов

[#] p < 0,001 (метод неограниченных пределов среднего с использованием исходного значения в качестве ковариаты), двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Долгосрочные исследования

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты и физических нагрузок (299 пациентов), получали лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или 5 мг перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 52 недель (концентрация HbA1c [значение по NGSP] в начале применения: 7,67 % ± 0,66 %). Лусеоглифлозин снижал концентрацию HbA1c (значение по NGSP) с начала применения препарата, а изменение концентрации HbA1c (значение по NGSP) на 52-й неделе после начала применения (среднее значение [2-сторонний 95 % доверительный интервал])

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

составило 0,50 (-0,6, -0,4) %. Достигался стабильный гликемический контроль на протяжении 52 недель. Частота гипогликемии составила 1,3 % (4/299 пациентов).

Комбинированная терапия

Долгосрочное исследование комбинированной терапии с пероральными гипогликемическими препаратами

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме крови которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты, физических нагрузок и монотерапии пероральными гипогликемическими препаратами (производные сульфонилмочевины [150 пациентов], бигуаниды [117 пациентов], тиазолидиндионы [95 пациентов], ингибиторы альфа-глюкозидазы [105 пациентов], ингибиторы ДПП-4 [111 пациентов], глиниды [59 пациентов]), получали лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или 5 мг (при увеличении дозы препарата) перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 52 недель. Лусеоглифлозин снижал концентрацию HbA1c (значение по NGSP) с самого начала применения. При совместном применении лусеоглифлозина с любым изучаемым пероральным гипогликемическим препаратом достигался стабильный гликемический контроль на протяжении 52 недель.

Таблица 4. Результаты исследований комбинированной терапии с пероральными гипогликемическими препаратами на 52-й неделе

Препараты, применявшиеся в совместной терапии с лусеоглифлозином	N	**HbA1c (значение по NGSP) (%)**	
		Исходное значение[1]	Изменение относительно исходного значения к 52-й неделе[2]
Производные сульфонилмочевины	150	8,07 ± 0,85	-0,63 [-0,8, -0,5]
Бигуаниды	117	7,84 ± 0,71	-0,61 [-0,7, -0,5]
Ингибиторы альфа-глюкозидазы	105	7,85 ± 0,77	-0,68 [-0,8, -0,5]
Тиазолидиндионы	95	7,95 ± 0,92	-0,60 [-0,8, -0,4]
Ингибиторы ДПП-4	111	7,88 ± 0,78	-0,52 [-0,6, -0,4]
Глиниды	59	8,00 ± 0,88	-0,59 [-0,8, -0,4]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Частота гипогликемии составила 8,7 % (13/150 пациентов) при совместном применении с производными сульфонилмочевины, 2,6 % (3/117 пациентов) при совместном применении с бигуанидами, 2,1 % (2/95 пациентов) при совместном применении с тиазолидиндионами, 0,9 % (1/111 пациентов) при совместном применении с ингибиторами ДПП-4 и 1,7 % (1/59 пациентов) при совместном применении с глинидами. Случаев гипогликемии при совместном применении с ингибитором альфа-глюкозидазы не отмечено.

Долгосрочное исследование комбинированной терапии с препаратами инсулина

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме крови которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты, физических нагрузок и препаратов инсулина (233 пациента), получали лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или плацебо перорально 1 раз в сутки до завтрака. Результаты исследования приведены в таблице ниже. Частота развития гипогликемии как нежелательной реакции составила 10,8 % в группе плацебо (8/74 пациентов) и 18,9 % в группе лусеоглифлозина (30/159 пациентов).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Таблица 5. Результаты долгосрочного исследования комбинированной терапии с препаратами инсулина

	Плацебо	Лусеоглифлозин 2,5 мг
N	74	159
HbA1c (значение по NGSP) (%)		
Исходное значение[1]	8,84 ± 0,83	8,70 ± 0,83
Изменение относительно исходного значения[2]	0,29 [0,1, 0,5]	-0,77 [-0,9, -0,6]
Отличие от плацебо[2]	-	-1,07[#] [-1,3, -0,9]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, рассчитанное методом наименьших квадратов

[#] p < 0,001 (метод неограниченных пределов среднего с использованием исходного значения в качестве ковариаты), двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Долгосрочное исследование комбинированной терапии с агонистами рецепторов ГПП-1

Пациенты с СД2, концентрация глюкозы в плазме крови которых недостаточно эффективно контролировалась с помощью диеты, физических нагрузок и монотерапии агонистами рецепторов ГПП-1 (76 пациентов), получали лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или 5 мг (при увеличении дозы препарата) перорально 1 раз в сутки до завтрака в течение 52 недель. Результаты исследования приведены в таблице ниже. Частота развития гипогликемии как нежелательной реакции составила 6,6 % (5/76 пациентов).

Таблица 6. Результаты долгосрочного исследования комбинированной терапии с агонистами рецепторов ГПП-1

Сопутствующие препараты	N	**HbA1c (значение по NGSP) (%)**	
		Исходное значение[1]	Изменение относительно исходного значения на 52-й неделе[2]
Агонисты рецепторов ГПП-1	76	8,52 ± 1,08	-0,68 [-0,9, -0,5]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Пациенты с почечной недостаточностью

При применении лусеоглифлозина в дозе 2,5 мг или плацебо перорально 1 раз в день перед завтраком в течение 24 недель у пациентов с СД2 и почечной недостаточностью средней степени тяжести (30 мл/мин/1,73 м^2 ≤ рСКФ ≤ 59 мл/мин/1,73 м^2) (145 пациентов) изменение уровня HbA1c составляло:

Таблица 7. Результаты двойного слепого плацебо-контролируемого исследования у пациентов с сочетанием диабета и почечной недостаточности средней степени тяжести на 24-й неделе

Эффективность у пациентов с почечной недостаточностью		
	Плацебо	Лусеоглифлозин 2,5 мг
N	50	95
HbA1c (значение по NGSP) (%)		
Исходное значение[1]	7,69 ± 0,65	7,72 ± 0,68
Изменение относительно исходного значения[2]	0,09 [-0,1, 0,3]	-0,11 [-0,2, 0,0]
Отличие от плацебо[2]	-	-0,19[#] [-0,4, 0,0]

[1] среднее значение ± стандартное отклонение

[2] среднее значение, рассчитанное методом наименьших квадратов

[#] p < 0,05 (метод неограниченных пределов среднего с использованием исходного значения в качестве

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

ковариаты), двусторонний 95 % доверительный интервал представлен в квадратных скобках

Когда в дополнение к терапии применяли лусеоглифлозин в дозе 2,5 мг или 5 мг (в случае повышения дозы) 1 раз в сутки в течение 28 недель (всего 52 недели) (у 95 пациентов) (уровень HbA1c [значение по NGSP] в начале применения: 7,72 % ± 0,68 %), изменение HbA1c (значение по NGSP) относительно значения в начале применения (среднее значение [двусторонний 95 % доверительный интервал]) составило 0,30 (-0,4, -0,2) %.

Дети

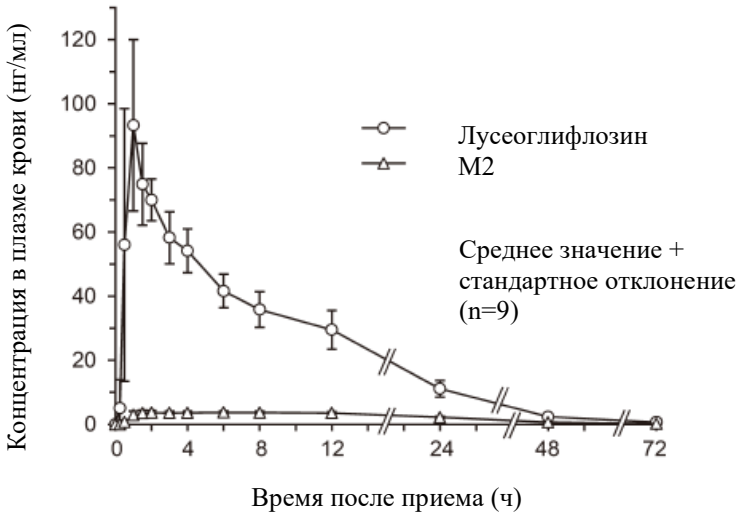
Фармакодинамика при применении у детей до 18 лет не изучалась.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При однократном приеме

Динамика концентрации препарата в плазме крови во времени и фармакокинетические параметры лусеоглифлозина и его активного метаболита (M2) при однократном приеме внутрь натощак лусеоглифлозина в дозе 2,5 мг у здоровых взрослых мужчин представлены ниже:



Доза	Анализируемое вещество	C_{max} (нг/мл)	t_{max} (ч)	$t_{1/2}$ (ч)	$AUC_{0-\infty}$ (нг·ч/мл)
2,5 мг (n = 9)	Лусеоглифлозин	100 ± 22,3	1,11 ± 0,546	11,2 ± 1,05	1000 ± 163
	M2	3,98 ± 0,538	5,44 ± 4,21	13,4 ± 1,11	122 ± 15,9

Среднее значение ± стандартное отклонение

При многократном приеме

Фармакокинетические параметры лусеоглифлозина при 7-дневном многократном пероральном приеме в дозе 2,5 мг или 5 мг 1 раз в сутки у пациентов с СД2 представлены ниже. Молярное отношение активного метаболита M2 к лусеоглифлозину, рассчитанное по $AUC_{0-24ч}$ на 7-й день применения составило 14,0 % и 14,8 % при использовании в дозах 2,5 и 5 мг соответственно.

Доза	День приема	C_{max} (нг/мл)	t_{max} (ч)	$t_{1/2}$ (ч)	AUC* (нг·ч/мл)
2,5 мг (n = 8)	1-й день	119 ±27,0	0,625 ± 0,354	9,24 ± 0,928	864 ± 132
	7-й день	136 ± 42,0	1,00 ± 0,886	9,20 ± 0,710	899 ± 148
5 мг (n = 8)	1-й день	243 ± 45,7	0,625 ± 0,231	8,96 ± 1,11	1 690 ± 271
	7-й день	299 ± 50,3	0,688 ± 0,259	9,54 ± 1,26	1 880 ± 318

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Среднее значение ± стандартное отклонение

* $AUC_{0-\infty}$ в 1-й день, $AUC_{0-24ч}$ в 7-й день

Влияние приема пищи

При однократном пероральном приеме лусеоглифлозина натощак за 5 минут до завтрака (до приема пищи) или через 30 минут после завтрака (после приема пищи) в разовой дозе 2,5 мг у здоровых взрослых мужчин (9 добровольцев) соотношение средних геометрических значений C_{max} и $AUC_{0-72ч}$ и их 90 % доверительные интервалы составляли 0,790 [0,670, 0,933] и 0,986 [0,958, 1,01] при приеме препарата после еды/до еды, 0,922 [0,781, 1,09] и 0,980 [0,953, 1,01] при приеме натощак/до еды, 0,857 [0,726, 1,01] и 1,01 [0,977, 1,04] после еды/натощак и 1,08 [0,919, 1,28] и 1,02 [0,991, 1,05] до еды/натощак.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови человека составило 96,0-96,3 % для диапазона концентраций от 50 до 5000 нг/мл (при определении *in vitro* после ультрацентрифугирования).

Биотрансформация

Основными метаболитами лусеоглифлозина в плазме крови и моче при приеме внутрь у здоровых взрослых мужчин являются О-деэтильная форма (М2), карбоксильная форма, образующаяся в результате окисления и гидроксилирования терминального атома углерода этиловой группы (М17), глюкуронид лусеоглифлозина (М8) и глюкуронид М2 (М12).

М2 – активный метаболит, который ингибирует НГЛТ-2. Значение концентрации полумаксимального ингибирования (IC_{50}) лусеоглифлозина и М2 в отношении захвата глюкозы, опосредованного НГЛТ-2 (НГЛТ-2-гиперэкспрессирующие клетки), составляла 2,26 и 4,01 нмоль/л, соответственно (*in vitro*).

Было продемонстрировано, что метаболизм лусеоглифлозина осуществляется главным образом посредством изоферментов CYP (системы цитохрома Р450): CYP3A4/5, 4A11, 4F2, 4F3B и фермента UGT1A1 (*in vitro*).

Лусеоглифлозин показал слабое ингибирующее действие в отношении изофермента CYP2C19 (значение IC_{50}: 58,3 мкмоль/л), не проявляя при этом никакого ингибирующего действия в отношении изоферментов CYP1A2, 2A6, 2B6, 2C8, 2C9, 2D6, 2E1 или 3A4 (IC_{50} > 100 мкмоль/л) (*in vitro*). Лусеоглифлозин не демонстрировал индуцирующее действие в отношении изоферментов CYP1A2 и 2B6, в то время как в отношении изофермента CYP3A4 он продемонстрировал слабое индуцирующее действие (*in vitro*). В исследовании у пациентов с СД2 с использованием концентрации 6β-гидроксикортизола в моче в качестве маркера лусеоглифлозин не индуцировал изофермент CYP3A4 (данные у пациентов, не относящихся к японской этнической группе).

Элиминация

При однократном приеме лусеоглифлозина внутрь натощак в дозе 2,5 мг у здоровых взрослых мужчин (9 участников) средняя экскреция препарата с мочой на протяжении до 72 часов после приема составила 4,47 %.

Было продемонстрировано, что лусеоглифлозин является субстратом гликопротеина Р (P-gp), но не субстратом белка резистентности рака молочной железы (BCRP), полипептидов, транспортирующих органические анионы (OATP1B1, OATP1B3), переносчиков органических анионов (OAT1, OAT3) или переносчика органических катионов (OCT2). Лусеоглифлозин продемонстрировал слабое ингибирующее действие в отношении OATP1B3 (значение IC_{50}: 93,1 мкмоль/л), не демонстрируя при этом ингибирующего действия в отношении P-gp, BCRP, OATP1B1, OAT1, OAT3 или OCT2 (IC_{50} > 100 мкмоль/л) (*in vitro*).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

При однократном пероральном приеме лусеоглифлозина в дозе 5 мг у пациентов с СД2 с почечной недостаточностью и у пациентов с СД2 с нормальной функцией почек отмечалась тенденция к снижению C_{max} по мере снижения функции почек.

Степень тяжести почечной недостаточности [рСКФ[1]]		C_{max} (нг/мл)	t_{max} (ч)	$t_{1/2}$ (ч)	$AUC_{0-\infty}$ (нг·ч/мл)	Экскреция глюкозы с мочой[2] (г)
Нормальная функция [≥ 90] (n = 11)		272 ± 86,4	0,545 ± 0,151	10,4 ± 0,832	2010 ± 508	88,3 ± 36,9
Легкая [60-89] (n = 17)		244 ± 53,4	1,01 ± 1,43	10,9 ± 0,752	2070 ± 395	69,7 ± 19,1
Средняя	[45-59] (n = 10)	252 ± 67,5	0,650 ± 0,337	11,2 ± 2,68	2160 ± 878	57,3 ± 14,9
	[30-44] (n = 13)	211 ± 62,5	1,58 ± 3,16	11,0 ± 1,49	2060 ± 414	35,3 ± 10,8
Тяжелая [15-29] (n = 6)		195 ± 63,1	2,00 ± 1,64	13,1 ± 3,62	2420 ± 657	21,8 ± 7,10

Среднее значение ± стандартное отклонение

[1] расчетная скорость клубочковой фильтрации (мл/мин/1,73 м^2)

[2] изменение совокупной экскреции глюкозы с мочой в течение 24 часов после приема относительно исходного уровня (за день до приема)

Пациенты с печеночной недостаточностью

При однократном пероральном приеме лусеоглифлозина в дозе 5 мг у пациентов с печеночной недостаточностью средней степени тяжести и у пациентов с нормальной функцией печени значение C_{max} у первых было на 23 % ниже, чем у вторых.

Степень тяжести печеночной недостаточности [по классификации Чайлд-Пью]	C_{max} (нг/мл)	t_{max} (ч)	$t_{1/2}$ (ч)	$AUC_{0-\infty}$ (нг·ч/мл)
Нормальная функция (n = 6)	228 ± 80,6	1,17 ± 1,40	11,0 ± 1,17	1800 ± 427
Легкая [класс A] (n = 8)	228 ± 54,9	0,500 ± 0,00	10,9 ± 1,14	1720 ± 523
Средняя [класс B] (n = 5)	170 ± 28,4	0,500 ± 0,00	12,9 ± 1,85	1780 ± 260

Среднее значение ± стандартное отклонение

Лица пожилого возраста

При однократном пероральном приеме лусеоглифлозина в дозе 5 мг у пациентов пожилого возраста (24 мужчины и женщины в возрасте 65 лет и старше) значения C_{max} и $AUC_{0-\infty}$ (среднее значение ± стандартное отклонение) составили 256 ± 63,6 нг/мл и 2050 ± 307 нг·ч/мл, соответственно. При однократном пероральном приеме лусеоглифлозина в дозе 5 мг у здоровых взрослых мужчин в возрасте 20-40 лет (8 участников) в другом исследовании значения C_{max} и $AUC_{0-\infty}$ составили 205 ± 53,5 нг/мл и 1930 ± 290 нг·ч/мл, соответственно.

Фармакокинетическое взаимодействие

Влияние совместного применения лусеоглифлозина и различных лекарственных препаратов у

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

здоровых взрослых мужчин на фармакокинетические параметры лекарственных препаратов представлено ниже:

Совместно применяемый препарат	Доза совместно применяемого препарата	Доза лусеоглифлозина	Анализируемое вещество	Соотношение средних геометрических значений (соотношение с/без совместно применяемого препарата)	
				Соотношение C_{max} (90-процентный доверительный интервал)	Соотношение $AUC_{0-\infty}$ (90-процентный доверительный интервал)
Глимепирид	1 мг Однократно	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	1,00 [0,898, 1,12]	1,00 [0,977, 1,03]
			Глимепирид (n=12)	1,03 [0,949, 1,12]	1,07 [1,04, 1,10]
Метформин	250 мг Однократно	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	0,925 [0,845, 1,01]	0,985 [0,964, 1,01]
			Метформин (n=12)	0,999 [0,897, 1,11]	1,04 [0,953, 1,14]
Воглибоза	0,2 мг 3 раза в день 7 дней	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	1,09 [0,984, 1,21]	0,999 [0,957, 1,04]
Миглитол	50 мг Однократно	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	0,851 [0,761, 0,952]	0,953 [0,931, 0,975]
			Миглитол (n=12)	1,02 [0,915, 1,14]	1,04 [0,938, 1,16]
Пиоглитазон	30 мг 1 раз в день 7 дней	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	1,16 [1,04, 1,30]	0,939 [0,897, 0,982]
			Пиоглитазон (n=12)	0,884 [0,746, 1,05]	0,896* [0,774, 1,04]
			Метаболит пиоглитазона M-III (n=12)	1,04 [0,973, 1,11]	1,01* [0,945, 1,07]
			Метаболит пиоглитазона M-IV (n=12)	1,01 [0,947, 1,07]	1,03* [0,977, 1,09]
Ситаглиптин	50 мг Однократно	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	0,967 [0,914, 1,02]	0,986 [0,948, 1,03]
			Ситаглиптин (n=12)	0,983 [0,922, 1,05]	1,03 [1,01, 1,05]
Фуросемид	40 мг 1 раз в день 4 дня	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	1,07 [0,980, 1,17]	1,13 [1,08, 1,18]
			Фуросемид (n=12)	1,36 [1,19, 1,54]	1,14* [1,07, 1,21]
Гидрохлоротиазид	25 мг 1 раз в день 4 дня	5 мг Однократно	Лусеоглифлозин (n=12)	1,16 [1,04, 1,31]	1,11 [1,07, 1,16]
			Гидрохлоротиазид (n=12)	1,09 [0,974, 1,23]	1,11* [1,08, 1,15]

* $AUC_{0-24ч}$

Дети

Фармакокинетика при применении у детей не изучалась.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

5.3. Данные доклинической безопасности

В доклинических данных, полученных по результатам стандартных исследований фармакологической безопасности, токсичности при многократном введении, генотоксичности, канцерогенного потенциала, репродуктивной и онтогенетической токсичности, особый вред для человека не выявлен.

В исследовании канцерогенности у мышей не наблюдалось никаких опухолевых изменений, связанных с введением лусеоглифлозина в максимальной дозе 100 мг/кг. Значения $AUC_{0\text{-}24ч}$ лусеоглифлозина в данной дозе были в 21-48 раз выше значения AUC_{τ} (площадь под кривой «концентрация-время» в течение интервала дозирования) у человека. С другой стороны, у самцов крыс было отмечено увеличение частоты возникновения феохромоцитомы надпочечников, опухолей (доброкачественных) из интерстициальных клеток в семенниках и гемангиомы/гемангиосаркомы в брыжеечных лимфатических узлах при введении дозы 100 мг/кг. При введении лусеоглифлозина в дозе 20 мг/кг у самцов и 100 мг/кг у самок значения $AUC_{0\text{-}24ч}$ лусеоглифлозина, при которых не было выявлено никаких опухолевых изменений, были в 4,2 раза выше у самцов и в 40 раз выше у самок по сравнению с AUC_{τ} у человека.

Увеличение числа крыс с феохромоцитомой надпочечников, вероятно, объяснялось изменением гомеостаза кальция из-за стойкого ингибирования НГЛТ-1 (увеличение абсорбции кальция) и увеличения потребления пищи (увеличение потребления кальция). Феохромоцитома надпочечников, вызванная данным механизмом, имеет тенденцию возникать у крыс и плохо экстраполируется на людей. Кроме того, у людей не было обнаружено влияния лусеоглифлозина на обмен кальция. Таким образом, представляется маловероятным, что лусеоглифлозин будет вызывать феохромоцитому надпочечников у человека.

Опухоль из интерстициальных клеток в семенниках, вероятно, была вызвана увеличением концентрации лютеинизирующего гормона из-за снижения концентрации тестостерона в результате длительного многократного введения лусеоглифлозина. Однако данный механизм развития опухоли является специфичным для крыс и плохо экстраполируется на человека. Таким образом, представляется крайне маловероятным, что лусеоглифлозин приведет к возникновению опухоли из интерстициальных клеток у человека.

Гемангиома / гемангиосаркома в брыжеечных лимфатических узлах, вероятно, была вызвана указанным далее механизмом. Предполагается, что развитие этих опухолей в брыжеечных лимфатических узлах при исследовании канцерогенности у крыс было связано с условиями эксперимента. Кроме того, предполагается, что опухоли были вызваны такими вторичными факторами, как местная ишемия, опосредованная неполноценным питанием и стрессом (снижение массы тела и повышенная экскреция глюкозы с мочой). Однако, представляется крайне маловероятным, что лусеоглифлозин вызывает гемангиому / гемангиосаркому у человека.

При введении лусеоглифлозина беременным животным (крысам) в дозе 150 мг/кг или 500 мг/кг у эмбрионов / плодов наблюдались изменения скелета, задержка оссификации, снижение массы тела и дефект межжелудочковой перегородки сердца вследствие нарушения питания и ухудшения общего состояния самок на фоне введения лусеоглифлозина. Значение $AUC_{0\text{-}24ч}$ лусеоглифлозина для дозы 50 мг/кг, при которой не было выявлено тератогенного эффекта у животных, в 15 раз превышает значение AUC у человека.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

Целлюлоза микрокристаллическая

Гидроксипропилцеллюлоза

Карбоксиметилкрахмал натрия тип А

Магния стеарат

Лактозы моногидрат

Премикс белый (гипромеллоза 2910, титана диоксид (Е171), макрогол 400)

Воск пчелиный белый синтетический

Кремния диоксид коллоидный безводный

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 15 таблеток в упаковке ячейковой контурной (фольга холодного формования из полиамид/алюминий/поливинилхлорид (ПА/Ал/ПВХ) и фольга алюминиевая с термолаковым покрытием).

По 2 или 4 упаковки ячейковой контурной с листком-вкладышем в пачку картонную.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

АО «Сервье»

125196, г. Москва, ул. Лесная, д. 7, этаж 7/8/9

Телефон: +7 (495) 937-07-00

Электронная почта: servier.russia@servier.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 785
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0021)

АО «Сервье»

Адрес: 125196, г. Москва, ул. Лесная, дом 7, этаж 7/8/9

Телефон: +7 (495) 937-07-00

Электронная почта: servier.russia@servier.com

Республика Казахстан и Кыргызская Республика

ТОО «Сервье Казахстан»

Адрес: Республика Казахстан, 050020, г. Алматы, пр. Достык, 310Г

Телефон: +7 (727) 386-76-62

Электронная почта: kazadinfo@servier.com

Республика Беларусь

Представительство УАО «Les Laboratoires Servier» (Французская Республика) в Республике Беларусь

Адрес: 220030, г. Минск. ул. Мясникова, 70, оф. 303

Телефон: +375 (17) 306-54-55/56

Электронная почта: officeBY@servier.com

Республика Армения

Представительство компании «Ле Лабораторуар Сервье» в Республике Армения

Адрес: 0002, г. Ереван, Кентрон, ул. Амиряна, 15, магазин 100

Телефон: +374 (10) 50-50-74

Электронная почта: pvarmenia@servier.com

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация: ЛП-№(003622)-(РГ-RU)

Республика Армения: ЛП-№(003622)-(ГП-AM)

Республика Беларусь: ЛП-№003622-ГП-BY

Кыргызская Республика: ЛП-№(003622)-(ГП-KG)

Республика Казахстан: ЛП-№003622-ГП-KZ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Лусефи доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) (https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC).