

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Диабеталонг, 60 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: гликлазид

Каждая таблетка содержит 60 мг гликлазида.

Вспомогательные вещества, наличие которых нужно учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.3.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с пролонгированным высвобождением.

Круглые плоскоцилиндрические таблетки с фаской и риской белого или почти белого цвета.

Допускается наличие мраморности.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Диабеталонг показан к применению у взрослых.

- Сахарный диабет 2 типа при недостаточной эффективности диетотерапии, физических нагрузок и снижения массы тела.
- Профилактика осложнений сахарного диабета: снижение риска микрососудистых (нефропатия, ретинопатия) и макрососудистых осложнений (инфаркт миокарда, инсульт) у пациентов с сахарным диабетом 2 типа путем интенсивного гликемического контроля.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Суточная доза может составлять 30–120 мг (1/2–2 таблетки) в один прием.

Рекомендуемую дозу препарата следует принимать внутрь, 1 раз в сутки, предпочтительно во время завтрака.

При пропуске одного или более приемов препарата нельзя принимать более высокую дозу в следующий прием, обычную дозу следует принять на следующий день.

Как и в отношении других гипогликемических лекарственных средств, дозу препарата в каждом случае необходимо подбирать индивидуально, в зависимости от концентрации глюкозы крови и показателя гликированного гемоглобина (HbA1c).

Лечение сахарного диабета 2 типа

Начальная доза

Начальная рекомендуемая доза гликлазида (в том числе для пациентов пожилого возраста ≥ 65 лет) – 30 мг в сутки (1/2 таблетки).

В случае адекватного контроля гликлазид в этой дозе может использоваться для поддерживающей терапии. При неадекватном гликемическом контроле суточная доза гликлазида может быть последовательно увеличена до 60 мг, 90 мг или 120 мг.

Повышение дозы возможно не ранее, чем через 1 месяц терапии гликлазидом в ранее назначенной дозе. Исключение составляют пациенты, у которых концентрация глюкозы крови не снизилась после 2 недель терапии. В таких случаях доза препарата может быть увеличена через 2 недели после начала приема.

Максимальная рекомендуемая суточная доза гликлазида составляет 120 мг.

1 таблетка препарата Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг, эквивалентна 2 таблеткам препарата Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 30 мг. Наличие риски на таблетках 60 мг позволяет делить таблетку и принимать суточную дозу как 30 мг (1/2 таблетки 60 мг), так и при необходимости 90 мг (1 и 1/2 таблетки 60 мг).

Переход с приема лекарственного препарата, содержащего гликлазид в дозировке 80 мг, на лекарственный препарат Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг

1 таблетка лекарственного препарата, содержащего гликлазид в дозировке 80 мг, может быть заменена 1/2 таблетки лекарственного препарата Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг. При переводе пациентов с лекарственного препарата, содержащего гликлазид в дозировке 80 мг, на лекарственный препарат Диабеталонг рекомендуется тщательный контроль гликемии.

Переход с приема другого гипогликемического лекарственного средства на лекарственный препарат Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг

Препарат Диабеталонг, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг может применяться вместо другого перорального гипогликемического лекарственного препарата. При этом следует учитывать их дозу и период полувыведения. Как правило, переходного периода при этом не требуется. Начальная доза должна составлять 30 мг и затем должна титроваться в зависимости от концентрации глюкозы крови.

При замене препаратом Диабеталонг производных сульфонилмочевины с длительным периодом полувыведения во избежание гипогликемии, вызванной аддитивным эффектом двух гипогликемических средств, можно прекратить их прием на несколько дней.

Начальная доза препарата Диабеталонг при этом также составляет 30 мг (1/2 таблетки 60 мг) и при необходимости может быть повышена в дальнейшем, в зависимости от терапевтического эффекта.

Комбинированный прием с другим гипогликемическим лекарственным средством

Препарат Диабеталонг может применяться в сочетании с бигуанидами, ингибиторами альфа-глюкозидазы или инсулином.

При неадекватном гликемическом контроле следует назначить дополнительно инсулинотерапию с проведением тщательного медицинского контроля.

Профилактика осложнений сахарного диабета 2 типа

Для достижения интенсивного гликемического контроля можно постепенно увеличивать дозу препарата Диабеталонг до 120 мг/сутки в дополнение к диете и физическим нагрузкам до достижения целевой концентрации HbA1c. При этом необходимо проводить мониторинг риска развития гипогликемии.

Помимо этого, к терапии можно добавить другие средства, например, метформин, ингибиторы альфа-глюкозидазы, производные тиазолидиндиона или инсулин.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Коррекции дозы препарата для пациентов старше 65 лет не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

Результаты клинических исследований показали, что коррекции дозы препарата у пациентов с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести не требуется.

Рекомендуется проведение тщательного медицинского контроля.

Пациенты с риском развития гипогликемии

У пациентов, относящихся к группе риска развития гипогликемии (недостаточное или несбалансированное питание; тяжелые или плохо компенсированные эндокринные расстройства – гипопитарная и надпочечниковая недостаточность, гипотиреоз; отмена глюкокортикостероидов (ГКС) после их длительного приема и/или приема в высоких дозах; тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы – тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелый атеросклероз сонных артерий, распространенный атеросклероз), рекомендуется использовать минимальную дозу (30 мг) препарата Диабеталонг.

Дети

Данные об эффективности и безопасности применения препарата у детей и подростков в возрасте до 18 лет отсутствуют.

Способ применения

Рекомендуется проглотить дозу препарата целиком, не разжевывая и не измельчая (см. раздел 4.4.).

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к гликлазиду или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1., другим производным сульфонилмочевины, сульфаниламидам;
- сахарный диабет 1 типа;
- диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, диабетическая кома;
- почечная или печеночная недостаточность тяжелой степени (в этих случаях показана инсулинотерапия);
- сопутствующая терапия миконазолом (см. раздел 4.5.);
- беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.);
- возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности гликлазида в данной возрастной популяции);
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции (в состав препарата входит лактоза).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении.

С осторожностью

- Пожилой возраст;
- нерегулярное и/или несбалансированное питание;
- недостаточность глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- заболевания сердечно-сосудистой системы тяжелой степени;
- гипотиреоз, надпочечниковая или гипофизарная недостаточность;
- почечная и/или печеночная недостаточность легкой степени и средней степени тяжести;
- длительная терапия глюкокортикостероидами;
- алкоголизм.

Особые указания

Гипогликемия

При приеме производных сульфонилмочевины, в том числе и гликлазида, может развиваться гипогликемия, в некоторых случаях – тяжелой степени и продолжительная, требующая госпитализации и внутривенного введения раствора глюкозы в течение нескольких дней.

Гликлазид может быть назначен только тем пациентам, питание которых регулярно и включает завтрак. Очень важно поддерживать достаточное поступление углеводов с пищей,

так как риск развития гипогликемии возрастает при нерегулярном или недостаточном питании, а также в случае употребления бедной углеводами пищи.

Гипогликемия чаще развивается при низкокалорийной диете, после продолжительных или энергичных физических нагрузок, после употребления алкоголя или при приеме нескольких гипогликемических лекарственных средств одновременно.

Как правило, симптомы гипогликемии проходят после приема пищи, богатой углеводами (например, сахара). Следует иметь в виду, что приём сахарозаменителей не способствует устранению гипогликемии. Опыт применения других производных сульфонилмочевины свидетельствует о том, что гипогликемия может рецидивировать, несмотря на эффективное первоначальное ее купирование. Если симптомы гипогликемии ярко выражены или являются продолжительными, даже в случае временного улучшения состояния после приема пищи, богатой углеводами, необходимо оказание скорой медицинской помощи, вплоть до госпитализации.

Во избежание развития гипогликемии необходим тщательный индивидуальный подбор препаратов и режима дозирования, а также предоставление пациенту полной информации о проводимом лечении.

Повышенный риск развития гипогликемии может отмечаться в следующих случаях:

- отказ или неспособность пациента (особенно пожилого возраста) следовать назначениям врача и контролировать свое состояние;
- недостаточное и нерегулярное питание, пропуск приемов пищи, голодание и изменение рациона;
- дисбаланс между физической нагрузкой и количеством принимаемых углеводов;
- почечная недостаточность;
- печеночная недостаточность тяжелой степени;
- передозировка гликлазида;
- некоторые эндокринные расстройства: заболевания щитовидной железы, гипопитарная и надпочечниковая недостаточность;
- совместное применение с некоторыми лекарственными препаратами (см. раздел 4.5.).

Пациенты с нарушением функции почек и печени

У пациентов с печеночной недостаточностью и/или почечной недостаточностью тяжелой степени могут изменяться фармакокинетические и/или фармакодинамические параметры гликлазида. Состояние гипогликемии, развивающееся у таких пациентов, может быть достаточно длительным, в таких случаях необходимо немедленное проведение соответствующей терапии.

Пациенты с недостаточным гликемическим контролем

На гликемический контроль у пациентов, получающих терапию гипогликемическими средствами, может влиять следующее: совместный прием препаратов зверобоя продырявленного (*Hypericum perforatum*) (см. раздел 4.5.), лихорадка, травмы, инфекционные заболевания или хирургические вмешательства. При данных состояниях может возникнуть необходимость прекратить терапию гликлазидом и назначить инсулинотерапию.

У многих пациентов эффективность пероральных гипогликемических средств, в том числе гликлазида, имеет тенденцию к снижению после продолжительного периода лечения. Этот эффект может быть обусловлен как прогрессированием заболевания, так и снижением терапевтического ответа на препарат. Данный феномен известен как вторичная лекарственная резистентность, которую необходимо отличать от первичной, при которой лекарственный препарат уже при первом применении не дает ожидаемого клинического эффекта. Прежде чем диагностировать у пациента вторичную лекарственную резистентность, необходимо оценить адекватность подбора дозы и соблюдение пациентом предписанной диеты.

Лабораторные тесты

Для оценки гликемического контроля рекомендуется регулярное определение концентрации HbA_{1c} или концентрации глюкозы в венозной крови натощак. Кроме того, целесообразно регулярно проводить самоконтроль концентрации глюкозы крови.

Производные сульфонилмочевины могут вызвать гемолитическую анемию у пациентов с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы. Поскольку гликлазид является производным сульфонилмочевины, необходимо соблюдать осторожность при его назначении пациентам с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы. Следует рассмотреть возможность назначения гипогликемического препарата другой группы.

Информация для пациентов

Необходимо проинформировать пациента, а также членов его семьи о риске развития гипогликемии, ее симптомах (см. раздел 4.8.), условиях, способствующих ее развитию и лечению.

Пациенту необходимо разъяснить важность соблюдения диеты, необходимость регулярных физических нагрузок и регулярного контроля концентрации глюкозы в крови.

Дисгликемия (изменение концентрации глюкозы в крови)

Сообщалось об изменениях концентрации глюкозы в крови, включая как гипогликемию, так и гипергликемию, у пациентов с сахарным диабетом 2 типа, получающих совместную терапию фторхинолонами, особенно у пациентов пожилого возраста. Таким образом, всем

пациентам, получающим одновременно гликлазид и фторхинолоны, следует проводить тщательный мониторинг концентрации глюкозы в крови.

Пациенты с порфирией

Описаны случаи обострения порфирии при применении некоторых других производных сульфонилмочевины у пациентов с порфирией.

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат Диабеталонг не следует применять у пациентов с редкими наследственными состояниями, связанными с непереносимостью галактозы, полной лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Препараты, способствующие увеличению риска развития гипогликемии (усиливающие действие гликлазида)

Противопоказанные комбинации

Миконазол (при системном введении и при использовании геля на слизистую оболочку полости рта): усиливает гипогликемическое действие гликлазида (возможно развитие гипогликемии вплоть до состояния комы).

Нерекомендуемые комбинации

Фенилбутазон (системное введение): усиливает гипогликемический эффект производных сульфонилмочевины (вытесняет их из связи с белками плазмы и/или замедляет их выведение из организма).

Предпочтительнее использовать другой противовоспалительный препарат. Если прием фенилбутаона необходим, пациент должен быть предупрежден о необходимости регулярного гликемического контроля. При необходимости дозу гликлазида следует корректировать во время приема фенилбутаона и после его окончания.

Этанол: усиливает гипогликемию, ингибируя компенсаторные реакции, может способствовать развитию гипогликемической комы. Необходимо отказаться от приема лекарственных средств, в состав которых входит этанол, и употребления алкоголя.

Сочетание препаратов, требующее особого внимания и осторожности

Следующие лекарственные средства могут усиливать гипогликемический эффект и способствовать развитию гипогликемии: другие гипогликемические препараты (инсулин, акарбоза, метформин, тиазолидиндионы, ингибиторы дипептидилпептидазы-4, агонисты рецепторов ГПП-1); β -адреноблокаторы; флуконазол; ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (каптоприл, эналаприл); блокаторы H₂-

гистаминовых рецепторов; ингибиторы моноаминоксидазы, сульфаниламиды; кларитромицин и нестероидные противовоспалительные препараты.

Препараты, способствующие увеличению концентрации глюкозы в крови (ослабляющие действие гликлазида)

Нерекомендуемые комбинации

Даназол обладает диабетогенным эффектом. В случае необходимости приема даназола, следует проводить тщательный гликемический контроль. При необходимости совместного приема препаратов рекомендуется подбор дозы гипогликемического средства как во время приема даназола, так и после прекращения терапии.

Сочетание препаратов, требующее особого внимания и осторожности

Хлорпромазин (нейролептик): в высоких дозах (более 100 мг в сутки) увеличивает концентрацию глюкозы в крови, снижая секрецию инсулина. Рекомендуется тщательный гликемический контроль. При необходимости совместного приема препаратов рекомендуется подбор дозы гипогликемического средства как во время приема нейролептика, так и после его отмены.

ГКС (системное и местное применение: внутрисуставное, накожное, ректальное введение) и **тетракозактид**: повышают концентрацию глюкозы крови с возможным развитием кетоза (снижение толерантности к углеводам). Рекомендуется тщательный гликемический контроль, особенно в начале лечения. При необходимости совместного приема препаратов может потребоваться коррекция дозы гипогликемического средства как во время приема ГКС, так и после их отмены.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин (при внутривенном введении): β_2 -адреномиметики способствуют повышению концентрации глюкозы в крови. Необходимо уделять особое внимание важности самостоятельного гликемического контроля. При необходимости рекомендуется перевести пациента на инсулинотерапию.

Препараты зверобоя продырявленного (*Hypericum perforatum*): экспозиция гликлазида снижается при совместном применении с препаратами зверобоя продырявленного. Необходимо обратить внимание пациента на важность регулярного контроля концентрации глюкозы в крови.

Препараты, которые могут вызывать дисгликемию (изменение концентрации глюкозы в крови)

Сочетание препаратов, требующее особого внимания и осторожности

Фторхинолоны: при одновременном приеме гликлазида и фторхинолона пациент должен быть предупрежден о риске дисгликемии. Необходимо обратить внимание пациента на важность регулярного контроля концентрации глюкозы в крови.

Комбинации, которые должны быть приняты во внимание

Антикоагулянты (например, варфарин): производные сульфонилмочевины могут усиливать действие антикоагулянтов при совместном применении. Может потребоваться коррекция дозы антикоагулянта.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение гликлазида во время беременности противопоказано.

Данные о применении гликлазида у беременных отсутствуют или ограничены (менее 300 исходов беременности), также как ограничены данные о применении других производных сульфонилмочевины.

Исследования репродуктивной токсичности на животных не свидетельствуют о наличии тератогенных эффектов (см. раздел 5.3.).

Для снижения риска врожденных пороков, связанных с неконтролируемым сахарным диабетом, следует достичь нормогликемии до зачатия.

Пероральные гипогликемические препараты в период беременности не применяются. Инсулин является препаратом выбора для терапии сахарного диабета у беременных. Рекомендуется заменить прием пероральных гипогликемических препаратов на инсулинотерапию: или заранее – в случае планируемой беременности, или сразу после выявления беременности.

Лактация

Данные о проникновении гликлазида и его метаболитов в грудное молоко человека отсутствуют. Принимая во внимание риск развития неонатальной гипогликемии, в период грудного вскармливания прием препарата противопоказан. Риск для новорожденных/младенцев не может быть исключен.

Фертильность

Исследования репродуктивной токсичности на крысах обоего пола не показали влияния на фертильность или репродуктивную функцию (см. раздел 5.3.).

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

Лекарственный препарат Диабеталонг не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами.

В связи с возможным развитием гипогликемии при применении препарата Диабеталонг, пациенты должны быть осведомлены о симптомах гипогликемии и должны соблюдать осторожность во время управления транспортными средствами или выполнения работы,

требующей высокой скорости физических и психических реакций, особенно в начале терапии.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

При применении гликлазида возможно развитие следующих нежелательных эффектов:

Гипогликемия

Как и другие производные сульфонилмочевины, гликлазид может вызывать гипогликемию в случае нерегулярного приёма пищи и особенно, если приём пищи пропущен. Возможные симптомы гипогликемии: головная боль, ощущение сильного голода, тошнота, рвота, повышенная утомляемость, нарушение сна, агрессивность, возбуждение, снижение концентрации внимания, замедленная реакция, депрессия, спутанность сознания, нарушение зрения и речи, афазия, тремор, парезы, потеря самоконтроля, ощущение беспомощности, нарушение восприятия, головокружение, слабость, судороги, брадикардия, бред, поверхностное дыхание, сонливость, потеря сознания с возможным развитием комы, вплоть до летального исхода.

Также могут отмечаться адренергические компенсаторные реакции: повышенное потоотделение, «липкая» кожа, тревожность, тахикардия, повышение артериального давления, ощущение сердцебиения, аритмия и стенокардия.

Как правило, симптомы гипогликемии купируются приемом углеводов (сахара). Прием сахарозаменителей неэффективен. На фоне применения других производных сульфонилмочевины отмечались рецидивы гипогликемии после успешного ее купирования.

В случае тяжелой или длительной гипогликемии показана неотложная медицинская помощь, возможно, с госпитализацией, даже при наличии эффекта от приема углеводов.

Описание отдельных нежелательных реакций

Другие побочные эффекты

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: боль в животе, тошнота, рвота, диспепсия, диарея, запор. Прием препарата во время завтрака позволяет избежать этих симптомов или минимизировать их.

Реже отмечаются следующие побочные эффекты:

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек, эритема, макулопапулезная сыпь, буллезные реакции (такие как синдром Стивенса – Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, аутоиммунные буллезные нарушения) и, в исключительных случаях, лекарственная сыпь с эозинофилией и системной симптоматикой (DRESS-синдром).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: гематологические нарушения (анемия, лейкопения, тромбоцитопения, гранулоцитопения) развиваются редко. Как правило, эти явления обратимы в случае прекращения терапии.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: повышение активности печеночных ферментов (аспартатаминотрансферазы (АСТ), аланинаминотрансферазы (АЛТ), щелочной фосфатазы), гепатит (единичные случаи). При появлении холестатической желтухи необходимо прекратить терапию.

Эти явления обычно обратимы в случае прекращения терапии.

Нарушения со стороны органа зрения: преходящие зрительные расстройства, вызванные изменением концентрации глюкозы крови, особенно в начале терапии.

Класс специфичные эффекты, присущие производным сульфонилмочевины: на фоне приема других производных сульфонилмочевины отмечались следующие нежелательные явления: эритроцитопения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, панцитопения, аллергический васкулит, гипонатриемия, повышение активности печеночных ферментов, нарушение функции печени (например, с развитием холестаза и желтухи) и гепатит, проявление которых регрессировало после отмены препаратов сульфонилмочевины, но в отдельных случаях приводили к жизнеугрожающему нарушению функции печени.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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

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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: + 7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

При передозировке производными сульфонилмочевины может развиваться гипогликемия.

Симптомы

При возникновении умеренных симптомов гипогликемии без нарушения сознания или неврологической симптоматики следует увеличить прием углеводов с пищей, уменьшить

дозу препарата и/или изменить диету. Тщательное медицинское наблюдение за состоянием пациента должно продолжаться до тех пор, пока не будет уверенности в том, что его здоровью ничто не угрожает.

Возможно развитие тяжелых гипогликемических состояний, сопровождающихся комой, судорогами или другими неврологическими нарушениями. При появлении таких симптомов необходимо оказание скорой медицинской помощи и немедленная госпитализация.

Лечение

В случае гипогликемической комы или при подозрении на нее пациенту внутривенно струйно вводят 50 мл 20–40 % раствора декстрозы (глюкозы). Затем внутривенно, капельно, вводят 5–10 % раствор декстрозы (глюкозы) для поддержания концентрации глюкозы в крови выше 1 г/л. Тщательный контроль концентрации глюкозы крови и наблюдение за пациентом необходимо проводить как минимум в течение последующих 48 ч. После чего, в зависимости от состояния пациента, лечащий врач решает вопрос о необходимости дальнейшего наблюдения.

Диализ неэффективен ввиду выраженного связывания гликлазида с белками плазмы крови.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: гипогликемическое средство для перорального применения группы сульфонилмочевины II поколения.

Код АТХ: A10BB09

Механизм действия

Гликлазид является производным сульфонилмочевины, гипогликемическим препаратом для приема внутрь, отличается от других производных сульфонилмочевины наличием N-содержащего гетероциклического кольца с эндоциклической связью.

Гликлазид снижает концентрацию глюкозы в крови, стимулируя секрецию инсулина β -клетками островков Лангерганса. Повышение концентрации постпрандиального инсулина и С-пептида сохраняется после 2 лет терапии. Помимо влияния на углеводный обмен гликлазид оказывает гемоваскулярные эффекты.

Фармакодинамические эффекты

Влияние на секрецию инсулина

При сахарном диабете 2 типа гликлазид восстанавливает ранний пик секреции инсулина в ответ на поступление глюкозы и усиливает вторую фазу секреции инсулина. Значительное

повышение секреции инсулина наблюдается в ответ на стимуляцию, обусловленную приемом пищи или введением декстрозы (глюкозы).

Гемоваскулярные эффекты

Гликлазид снижает риск тромбозов мелких сосудов, влияя на механизмы, которые могут обуславливать развитие осложнений при сахарном диабете 2 типа: частичное ингибирование агрегации и адгезии тромбоцитов и снижение концентрации факторов активации тромбоцитов (β -тромбоглобулина, тромбоксана B_2), а также на восстановление фибринолитической активности сосудистого эндотелия и повышение активности тканевого активатора плазминогена.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После приема внутрь гликлазид полностью абсорбируется. Концентрация гликлазида в плазме крови возрастает постепенно в течение первых 6 часов, уровень плато поддерживается от 6 до 12 часов. Внутрииндивидуальная вариабельность низкая.

Прием пищи не влияет на скорость или степень абсорбции гликлазида.

Распределение

С белками плазмы связывается приблизительно 95 % гликлазида. Объем распределения – около 30 л. Прием лекарственного препарата Диабеталонг в дозе 60 мг один раз в сутки обеспечивает поддержание эффективной концентрации гликлазида в плазме крови более 24 часов.

Биотрансформация

Гликлазид метаболизируется преимущественно в печени. Активные метаболиты в плазме отсутствуют.

Элиминация

Гликлазид выводится, главным образом, почками, выведение осуществляется в виде метаболитов, менее 1 % выводится почками в неизмененном виде. Период полувыведения гликлазида составляет в среднем от 12 до 20 часов.

Фармакокинетическая-фармакодинамическая зависимость

Взаимосвязь между принятой дозой (до 120 мг) и площадью под фармакокинетической кривой «концентрация - время» является линейной.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста не наблюдается существенных изменений фармакокинетических параметров.

5.3. Данные доклинической безопасности

Доклинические данные, основанные на традиционных исследованиях токсичности и генотоксичности при многократном введении, не выявили специфических рисков для человека. Долгосрочные исследования канцерогенности не проводились. Тератогенных эффектов в исследованиях на животных выявлено не было, но при введении доз, в 25 раз превышающих максимальную рекомендуемую дозу для человека, наблюдалась более низкая масса тела плода. В исследованиях на животных не было выявлено негативного влияния гликлазида на фертильность и репродуктивный потенциал.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат (таблеттоза 80)

Гипромеллоза

Тальк

Кальция стеарат

Кремния диоксид коллоидный (аэросил)

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 в оригинальной упаковке (пачка картонная).

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

10, 20 таблеток в контурные ячейковые упаковки из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой лакированной печатной.

10, 20, 30, 60, 100, 120 таблеток в банки полимерные из полипропилена, полиэтилена низкого давления, укупоренные крышками натягиваемыми с контролем первого вскрытия или крышками навинчиваемыми, или крышками навинчиваемыми с контролем первого вскрытия из полиэтилена высокого давления, или полиэтилена низкого давления или смеси полиэтилена низкого давления и полиэтилена высокого давления.

Каждую банку, 1, 2, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или 1, 3, 5, 6 контурных ячейковых упаковок по 20 таблеток с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»).

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: + 7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Публичное акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ПАО «Синтез»).

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7.

Телефон: + 7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru.

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№ (000939)-(РГ-RU)

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: 27.06.2022

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Диабеталонг доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>