

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Гликлазид Пролонг-АКОС, 30 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением.

Гликлазид Пролонг-АКОС, 60 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: гликлазид.

Гликлазид Пролонг-АКОС, 30 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением

Каждая таблетка содержит 30 мг гликлазида.

Вспомогательные вещества, наличие которых нужно учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 87 мг (см. разделы 4.3. и 4.4.).

Гликлазид Пролонг-АКОС, 60 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением

Каждая таблетка содержит 60 мг гликлазида.

Вспомогательные вещества, наличие которых нужно учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 174 мг (см. разделы 4.3. и 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с пролонгированным высвобождением

Гликлазид Пролонг-АКОС, 30 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской.

Допускается наличие мраморности.

Гликлазид Пролонг-АКОС, 60 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением

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

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС показан для применения у взрослых.

- Сахарный диабет 2 типа при недостаточной эффективности диетотерапии, физических нагрузок и снижения массы тела.

- Профилактика осложнений сахарного диабета 2 типа: 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

Начальная доза

Начальная рекомендуемая доза (в том числе для пациентов пожилого возраста ≥ 65 лет) – 30 мг в сутки (1 таблетка дозировкой 30 мг или 1/2 таблетки дозировкой 60 мг).

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, 90 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 гликлазида может быть увеличена через 2 недели после начала приема.

Максимальная рекомендуемая суточная доза гликлазида составляет 120 мг.

1 таблетка лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС, таблетки с пролонгированным высвобождением 60 мг, эквивалентна 2 таблеткам лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС, 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 Гликлазид Пролонг-АКОС таблетки с пролонгированным высвобождением 30 мг и 60 мг

1 таблетка лекарственного препарата, содержащего гликлазид в дозировке 80 мг, может быть заменена 1 таблеткой лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС 30 мг с пролонгированным высвобождением или 1/2 таблетки лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС 60 мг с пролонгированным высвобождением. При переводе пациентов с лекарственного препарата, содержащего гликлазид в дозировке 80 мг, на лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС 60 мг рекомендуется тщательный контроль гликемии.

Переход с другого гипогликемического лекарственного средства на лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС таблетки с пролонгированным высвобождением 30 мг и 60 мг

Лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС таблетки с пролонгированным высвобождением 30 мг и 60 мг может применяться вместо другого перорального гипогликемического лекарственного препарата. При переводе на лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС пациентов, получающих другие пероральные гипогликемические препараты, следует учитывать их дозу и период полувыведения. Как правило, переходного периода при этом не требуется. Начальная доза должна составлять 30 мг (1 таблетка дозировкой 30 мг или 1/2 таблетки дозировкой 60 мг) и затем должна титроваться в зависимости от концентрации глюкозы крови.

При замене производных сульфонилмочевины с длительным периодом полувыведения лекарственным препаратом Гликлазид Пролонг-АКОС во избежание гипогликемии, вызванной аддитивным эффектом двух гипогликемических средств, можно прекратить их прием на несколько дней. Начальная доза лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС при этом также составляет 30 мг (1 таблетка дозировкой 30 мг или 1/2 таблетки дозировкой 60 мг) и при необходимости может быть повышена в дальнейшем, как описано выше.

Комбинированный прием с другим гипогликемическим лекарственным средством
Лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС может применяться в сочетании с бигуанидами, ингибиторами альфа-глюкозидазы или инсулином.

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

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 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) лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС.

Профилактика осложнений сахарного диабета 2 типа

Для достижения интенсивного гликемического контроля можно постепенно увеличивать дозу лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС до 120 мг/сутки в дополнение к диете и физическим нагрузкам до достижения целевой концентрации HbA1c. Следует помнить о риске развития гипогликемии. Помимо этого, к терапии можно добавить другие гипогликемические лекарственные средства, например, метформин, ингибитор альфа-глюкозидазы, производное тиазолидиндиона или инсулин.

Дети

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

Способ применения

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

Суточная доза может составлять 30–120 мг (1–4 таблетки дозировкой 30 мг или 1/2–2 таблетки дозировкой 60 мг) в один прием.

Рекомендуется проглотить таблетку или половину таблетки целиком, не разжевывая и не измельчая.

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

Как и в отношении других гипогликемических лекарственных средств, дозу гликлазида в каждом случае необходимо подбирать индивидуально, в зависимости от концентрации глюкозы крови и HbA1c.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к гликлазиду или к любым вспомогательным веществам, перечисленным в разделе 6.1, другим производным сульфонилмочевины, сульфаниламидам;
- сахарный диабет 1 типа;
- диабетическая прекома и кома, диабетический кетоацидоз;
- почечная недостаточность тяжелой степени или печеночная недостаточность тяжелой степени (в этих случаях рекомендуется применять инсулин);
- применение миконазола (см. раздел 4.5);

- беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6);
- возраст до 18 лет;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении.

С осторожностью

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

Особые указания

Гипогликемия

При приеме производных сульфонилмочевины, в том числе и гликлазида, может развиваться гипогликемия (см. раздел 4.8.), в некоторых случаях – в тяжелой и продолжительной форме, требующей госпитализации и внутривенного введения раствора глюкозы в течение нескольких дней.

Препарат может быть назначен только тем пациентам, которые питаются регулярно (включая завтрак). Очень важно поддерживать достаточное поступление углеводов с пищей, так как риск развития гипогликемии возрастает при нерегулярном или недостаточном питании, а также при потреблении пищи, бедной углеводами. Гипогликемия чаще развивается при низкокалорийной диете, после продолжительных или энергичных физических нагрузок, после употребления алкоголя или при приеме нескольких гипогликемических лекарственных средств одновременно.

Во избежание развития гипогликемии необходим тщательный индивидуальный подбор препаратов и режима дозирования, а также предоставление пациенту подробных инструкций.

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;

- передозировка лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС;
- некоторые эндокринные расстройства: заболевания щитовидной железы, гипофизарная и надпочечниковая недостаточность;
- одновременный прием некоторых лекарственных средств (см. раздел 4.5.).

Почечная и печеночная недостаточность

У пациентов с печеночной или тяжелой почечной недостаточностью 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.

Информация для пациентов

Необходимо проинформировать пациента, а также членов его семьи о риске развития гипогликемии, ее симптомах, условиях, способствующих ее развитию, и лечении.

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

Недостаточный гликемический контроль

На гликемический контроль у пациентов, получающих терапию гипогликемическими средствами, может влиять следующее: одновременный прием препаратов зверобоя продырявленного (см. раздел 4.5.), лихорадка, травмы, инфекционные заболевания или хирургические вмешательства. При данных состояниях может возникнуть необходимость в назначении инсулина.

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 назначении не дает ожидаемого клинического эффекта. Прежде чем диагностировать у пациента вторичную лекарственную резистентность, необходимо оценить адекватность подбора дозы и соблюдение пациентом предписанной диеты.

Дисгликемия (изменения концентрации глюкозы в крови)

Сообщалось об изменениях концентрации глюкозы в крови, включая как гипогликемию, так и гипергликемию, у пациентов с сахарным диабетом 2 типа, совместно получающих терапию фторхинолонами, особенно у пациентов пожилого возраста. Таким образом, всем пациентам, одновременно принимающим гликлазид и фторхинолоны, рекомендуется проводить тщательный мониторинг концентрации глюкозы в крови.

Лабораторные тесты

Для оценки гликемического контроля рекомендуется регулярное определение концентрации HbA1c или концентрации глюкозы в венозной крови натощак. Также целесообразно регулярно проводить самоконтроль гликемии.

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 лекарственного препарата не из группы производных сульфонилмочевины.

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат Гликлазид Пролонг-АКОС не следует применять у пациентов с редкими наследственными состояниями, связанными с непереносимостью галактозы, врожденной недостаточностью лактазы и нарушением всасывания глюкозы-галактозы.

Пациенты с порфирией

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Препараты и вещества, способствующие увеличению риска развития гипогликемии

Одновременное применение противопоказано

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

Комбинации, не рекомендуемые к применению

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 или предупредить пациента о риске развития гипогликемии и обратить внимание на важность самоконтроля концентрации глюкозы в крови. 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 сахароснижающие средства (инсулин, акарбоза, метформин, тиазолидиндионы, ингибиторы дипептидилпептидазы-4, агонисты рецепторов ГПП-1); бета-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

Комбинации, не рекомендуемые к применению

Даназол: обладает диабетогенным эффектом. В случае, если применение данного препарата необходимо, пациенту рекомендуется обратить внимание на важность контроля концентрации глюкозы в крови и моче. При необходимости совместного приема препаратов рекомендуется подбор дозы гипогликемического средства как во время приема даназола, так и после его отмены.

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. Об этом необходимо предупредить пациента и обратить внимание на важность контроля гликемии. При необходимости совместного приема препаратов рекомендуется подбор дозы гипогликемического средства как во время приема нейролептика, так и после его отмены.

Глюкокортикостероиды (системное и местное применение: внутрисуставное, накожное, ректальное введение) и тетракозактид: повышают концентрацию глюкозы в 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 глюкокортикостероидов, так и после их отмены.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин (внутривенное введение): бета-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: экспозиция гликлазида снижается на фоне совместного применения с препаратами зверобоя продырявленного. Необходимо обратить внимание пациента на важность контроля концентрации глюкозы в крови.

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

Сочетание препаратов, требующее особого внимания и осторожности

Фторхинолоны: в случае совместного приема гликлазида и фторхинолона пациенты должны быть предупреждены о риске развития дисгликемии и о важности контроля концентрации глюкозы в крови.

Сочетания препаратов, требующие внимания

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

Принимая во внимание отсутствие данных о поступлении гликлазида в грудное молоко и 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

Гликлазид не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами.

В связи с возможным развитием гипогликемии при приеме гликлазида, 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

Наиболее частой нежелательной реакцией, связанной с применением гликлазида, является гипогликемия.

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

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

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

При тяжелом или длительном эпизоде гипогликемии показана неотложная медицинская помощь, возможно, с госпитализацией, даже при наличии эффекта от приема углеводов.

Резюме нежелательных реакций

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 органа зрения: могут возникать преходящие зрительные расстройства, вызванные изменением концентрации глюкозы крови, особенно в начале терапии.

Желудочно-кишечные нарушения: боль в животе, тошнота, рвота, диспепсия, диарея, запор. Прием препарата во время завтрака позволяет избежать этих симптомов или минимизировать их.

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

Эти явления обычно обратимы в случае прекращения терапии.

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

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

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 (Росздравнадзор)

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

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке производными сульфонилмочевины может развиваться гипогликемия.

При возникновении умеренных симптомов гипогликемии без нарушения сознания или неврологической симптоматики следует увеличить прием углеводов с пищей, уменьшить дозу препарата и/или изменить диету. Пристальное 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 срочной медицинской помощи с немедленной госпитализацией.

Лечение

В случае гипогликемической комы или при подозрении на нее пациенту внутривенно струйно вводят 50 мл 20–30 % раствора глюкозы. Затем внутривенно капельно вводят 10 % раствор глюкозы для поддержания концентрации глюкозы в крови выше 1 г/л.

Необходимо проводить тщательный контроль концентрации глюкозы крови и наблюдение за пациентом. В зависимости от состояния пациента лечащий врач решает вопрос о необходимости дальнейшего наблюдения.

Диализ неэффективен ввиду выраженного связывания гликлазида с белками плазмы.

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, который отличается от аналогичных препаратов наличием N-содержащего гетероциклического кольца с эндоциклической связью.

Гликлазид снижает концентрацию глюкозы крови, стимулируя секрецию инсулина β -клетками островков Лангерганса. Повышение концентрации постпрандиального инсулина и C-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 препарат 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 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 (бета-тромбоглобулина, тромбоксана В2), а также на восстановление фибринолитической активности сосудистого эндотелия и повышение активности тканевого активатора плазминогена.

Интенсивный гликемический контроль, основанный на применении гликлазида (концентрация гликированного гемоглобина (HbA1c) < 6,5 %), достоверно снижает микро- и макрососудистые осложнения сахарного диабета 2 типа, в сравнении со стандартным гликемическим контролем (исследование ADVANCE).

Стратегия интенсивного гликемического контроля предусматривала назначение гликлазида и повышение его дозы на фоне (или вместо) стандартной терапии перед добавлением к ней другого гипогликемического лекарственного средства (например, метформина, ингибитора альфа-глюкозидазы, производного тиазолидиндиона или инсулина). Средняя суточная доза гликлазида у пациентов в группе интенсивного контроля составляла 103 мг, максимальная суточная доза составляла 120 мг.

На фоне применения гликлазида в группе интенсивного гликемического контроля (средняя продолжительность наблюдения 4,8 лет, средняя концентрация HbA1c 6,5 %) по сравнению с группой стандартного контроля (средняя концентрация HbA1c 7,3 %) показано значимое снижение на 10 % относительного риска комбинированной частоты макро- и микрососудистых осложнений.

Преимущество было достигнуто за счет значимого снижения относительного риска: основных микрососудистых осложнений на 14 %, возникновения и прогрессирования нефропатии на 21 %, возникновения микроальбуминурии на 9 %, макроальбуминурии на 30 % и развития почечных осложнений на 11 %.

Преимущества интенсивного гликемического контроля на фоне приема гликлазида не зависели от преимуществ, достигнутых на фоне гипотензивной терапии.

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. Индивидуальная 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 гликлазида в дозе 30 или 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.

Линейность (нелинейность)

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

Лица 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.

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

Акционерное общество «АЛИУМ»

142279, Московская обл., г. Серпухов, п. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2

Тел.: +7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Акционерное общество «АЛИУМ»

142279, Московская обл., г. Серпухов, п. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2

Тел.: +7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(002545)-(РГ-RU)

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации: 14.06.2023

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Гликлазид Пролонг-АКОС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org>.