

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Голда, 30 мг, таблетки с модифицированным высвобождением.

Голда, 60 мг, таблетки с модифицированным высвобождением.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: гликлазид.

Голда, 30 мг, таблетки с модифицированным высвобождением

Каждая таблетка содержит 30 мг гликлазида.

Голда, 60 мг, таблетки с модифицированным высвобождением

Каждая таблетка содержит 60 мг гликлазида.

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

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с модифицированным высвобождением.

Голда, 30 мг, таблетки с модифицированным высвобождением

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета с фаской.

Голда, 60 мг, таблетки с модифицированным высвобождением

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета с фаской и риской. Таблетку можно разделить на равные дозы.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Голда показан к применению у взрослых пациентов в возрасте от 18 лет:

- 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 гликлазида может составлять от 30 мг до 120 мг в один прием.

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

Начальная доза

Начальная рекомендуемая доза (в том числе для лиц пожилого возраста ≥ 65 лет) гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 30 мг в сутки (1 таблетка гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 30 мг или $\frac{1}{2}$ таблетки гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 60 мг). 1 таблетка препарата Голда, таблетки с модифицированным высвобождением, 60 мг, эквивалентна 2 таблеткам препарата Голда, таблетки с модифицированным высвобождением, 30 мг.

В случае адекватного контроля препарат Голда может применяться 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 препаратом в ранее назначенной дозе. Исключение составляют пациенты, у которых концентрация глюкозы крови не снизилась после 2-х недель терапии. В таких случаях доза препарата может быть увеличена через 2 недели после начала приема.

Максимальная рекомендуемая суточная доза препарата составляет 120 мг.

Переход от терапии гликлазидом таблетки с немедленным высвобождением 80 мг к терапии гликлазидом, таблетки с пролонгированным высвобождением

1 таблетка гликлазида с немедленным высвобождением в дозировке 80 мг может быть заменена 1 таблеткой гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 30 мг или $\frac{1}{2}$ таблетки гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 60 мг. При переводе пациентов от терапии гликлазидом (таблетки с немедленным высвобождением) в дозировке 80 мг на терапию гликлазидом таблетки с пролонгированным высвобождением рекомендуется тщательный гликемический контроль.

Переход от терапии другим гипогликемическим лекарственным средством к терапии гликлазидом

Гликлазид может применяться вместо другого перорального гипогликемического препарата (ПГП). При переводе на гликлазид пациентов, получающих другие ПГП, следует учитывать их дозу и период полувыведения. Как правило, переходного периода при этом не требуется. Начальная доза гликлазида с пролонгированным высвобождением должна составлять 30 мг (1 таблетка гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 30 мг или $\frac{1}{2}$ таблетки гликлазида с пролонгированным высвобождением в дозировке 60 мг) и затем должна титроваться в зависимости от концентрации глюкозы крови.

При замене гликлазидом с пролонгированным высвобождением производных сульфонилмочевины с длительным периодом полувыведения для того, чтобы избежать гипогликемии, вызванной аддитивным эффектом двух ПГП, можно прекратить их прием на несколько дней. Начальная доза гликлазида с пролонгированным высвобождением при этом также составляет 30 мг и при необходимости может быть повышена в дальнейшем, как описано выше.

Комбинированный приём с другим гипогликемическим лекарственным средством

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

При неадекватном гликемическом контроле показана инсулинотерапия под тщательным врачебным наблюдением.

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

Коррекции дозы гликлазида для пациентов старше 65 лет не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью

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

Пациенты с риском развития гипогликемии

У пациентов, относящихся к группе риска развития гипогликемии (при недостаточном или несбалансированном питании, наличии тяжелых или плохо компенсированных эндокринных расстройств [гипофизарная и надпочечниковая недостаточность, гипотиреоз, прекращение терапии глюкокортикостероидами после их длительного применения и/или применения в высоких дозах], тяжелых заболеваний сердечно-сосудистой системы [тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелый атеросклероз сонных артерий, распространенный атеросклероз]), рекомендуется использовать минимальную дозу (30 мг) гликлазида с пролонгированным высвобождением.

Профилактика осложнений сахарного диабета

Для достижения интенсивного гликемического контроля можно постепенно увеличивать дозу гликлазида до 120 мг/сутки в дополнение к диете и физическим упражнениям до достижения целевого значения HbA_{1c}. Следует помнить о риске развития гипогликемии. Кроме того, к терапии можно добавить другие ПГП, например, метформин, ингибитор альфа-глюкозидазы, производное тиазолидиндиона или инсулин.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Голда у детей в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

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

Рекомендуется проглотить таблетку целиком, не разжевывая и не измельчая.

При пропуске очередного приема препарата Голда нельзя принимать более высокую дозу в следующий прием. Прием препарата продолжают в обычной дозе на следующий день.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к гликлазиду, другим производным сульфонилмочевины, сульфаниламидам или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- сахарный диабет 1 типа;
- диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, диабетическая кома;
- почечная или печеночная недостаточность тяжелой степени (в этих случаях показана инсулинотерапия);
- прием миконазола (см. раздел 4.5.);
- беременность и период грудного вскармливания.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Гипогликемия

При приеме производных сульфонилмочевины, в том числе и гликлазида, может развиваться гипогликемия, в некоторых случаях - в тяжелой и продолжительной форме, требующая госпитализации и внутривенного введения раствора декстрозы в течение нескольких дней.

Препарат 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 при употреблении пищи, бедной углеводами. Гипогликемия чаще развивается при низкокалорийной диете, после продолжительных или энергичных физических упражнений, после употребления алкоголя или при приеме нескольких гипогликемических лекарственных средств одновременно. Как правило, симптомы гипогликемии проходят после приема пищи, богатой углеводами (например, нескольких кусочков сахара). Следует иметь в виду, что приём сахарозаменителей не способствует устранению симптомов гипогликемии. Опыт применения других производных сульфонилмочевины свидетельствует о том, что гипогликемия может рецидивировать, несмотря на эффективное первоначальное купирование этого состояния. В случае выраженных и продолжительных симптомов гипогликемии, даже в случае временного улучшения состояния после приёма 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 препарата Голда;
- некоторые эндокринные расстройства: заболевания щитовидной железы, гипопитарная и надпочечниковая недостаточность;
- одновременный прием некоторых лекарственных средств (см. раздел 4.5.).

Почечная и печеночная недостаточность

У пациентов с печеночной и/или почечной недостаточностью тяжелой степени могут изменяться фармакокинетические и/или фармакодинамические свойства 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 и условиях, способствующих ее развитию. Пациента необходимо информировать о потенциальном риске и преимуществах предлагаемого лечения.

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

Недостаточный гликемический контроль

Гликемический контроль у пациентов, получающих терапию ПГП, может быть недостаточным в следующих случаях: лихорадка, травмы, инфекционные заболевания или большие хирургические вмешательства. При данных состояниях может возникнуть необходимость в прекращении терапии гликлазидом и проведении инсулинотерапии.

У многих пациентов эффективность ПГП, в том числе гликлазида, имеет тенденцию снижаться 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 (изменение концентрации глюкозы в крови)

Сообщалось об изменениях концентрации глюкозы в крови, включая как гипогликемию, так и гипергликемию у пациентов с сахарным диабетом, получающих одновременно терапию фторхинолонами, особенно у пациентов пожилого возраста. Всем пациентам при совместном применении гликлазида и фторхинолонов рекомендуется проведение тщательного мониторинга концентрации глюкозы в крови.

Лабораторные тесты

Для оценки гликемического контроля рекомендуется регулярное определение концентрации глюкозы крови натощак и гликированного гемоглобина (HbA1c). 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 оценить возможность назначения гипогликемического препарата другой группы.

Пациенты с порфирией

Описаны случаи обострения порфирии при применении других производных сульфонилмочевины у таких пациентов.

Вспомогательные вещества

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

Данный лекарственный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на таблетку, то есть, по сути, «не содержит натрия».

Дети

Применение гликлазида у детей и подростков в возрасте до 18 лет противопоказано (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности применения гликлазида в данной популяции).

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

Противопоказанные сочетания

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

Нерекомендуемые сочетания

Фенилбутазон

При системном введении усиливает гипогликемический эффект производных сульфонилмочевины (вытесняет их из связи с белками плазмы крови и/или замедляет их выведение из организма).

Предпочтительнее использовать другой противовоспалительный препарат. Если прием фенилбутафона необходим, пациент должен быть предупрежден о необходимости гликемического контроля. При необходимости дозу гликлазида следует корректировать во время приема фенилбутафона 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 соблюдения мер предосторожности

Прием гликлазида в комбинации с некоторыми лекарственными средствами, другими гипогликемическими средствами (инсулином, акарбозой, метформином, тиазолидиндионами, ингибиторами дипептидилпептидазы-4, агонистами рецепторов глюкагоноподобного пептида-1 [ГПП-1]), бета-адреноблокаторами, флуконазолом, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (каптоприлом, эналаприлом), блокаторами H₂-гистаминовых рецепторов, ингибиторами моноаминоксидазы, сульфаниламидами, кларитромицином и нестероидными противовоспалительными препаратами сопровождается усилением гипогликемического эффекта и риском развития гипогликемии.

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

Нерекомендуемые сочетания

Даназол

Обладает диабетогенным эффектом. В случае если прием данного препарата необходим, пациенту рекомендуется тщательный контроль глюкозы крови. 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 соблюдения мер предосторожности

Хлорпромазин

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

Глюкокортикостероиды (системное и местное применение: внутрисуставное, наружное, ректальное введение) и тетракозактид

Повышают концентрацию глюкозы крови с возможным развитием кетоацидоза (снижение толерантности к углеводам). Рекомендуется тщательный гликемический контроль, особенно в начале лечения. При необходимости совместного применения препаратов может потребоваться коррекция дозы гликлазида во время терапии глюкокортикостероидами и после ее прекращения.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин

При внутривенном введении бета-2 адреномиметики способствуют повышению концентрации глюкозы крови.

Необходимо уделять особое внимание важности самостоятельного гликемического контроля. При необходимости рекомендуется перевести пациента на инсулинотерапию.

Препараты зверобоя продырявленного (*Hypericum perforatum*)

Экспозиция гликлазида снижается на фоне совместного применения с растительными препаратами, содержащими зверобой продырявленный. Необходимо обратить внимание пациента на необходимость контроля концентрации глюкозы в крови.

Фторхинолоны

В случае совместного приема гликлазида и фторхинолонов возможно развитие дисгликемии (изменение концентрации глюкозы крови: гипергликемия, гипогликемия).

Сочетания, которые должны быть приняты во внимание

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Опыт применения гликлазида во время беременности отсутствует. Данные о применении других производных сульфонилмочевины во время беременности ограничены.

В исследованиях на лабораторных животных тератогенные эффекты гликлазида выявлены не были.

Для снижения риска развития врожденных пороков необходим оптимальный контроль (проведение соответствующей терапии) сахарного диабета.

Пероральные гипогликемические препараты в период беременности не применяются. Инсулин является препаратом выбора для терапии сахарного диабета у беременных.

При планировании беременности или диагностировании беременности на фоне применения гликлазида, прием препарата Голда следует прекратить и перевести пациентку на инсулинотерапию.

Лактация

На настоящий момент нет данных о проникновении гликлазида или его метаболитов в грудное молоко. Учитывая риск развития гипогликемии у ребенка, находящегося на грудном вскармливании, применение гликлазида в период грудного вскармливания противопоказано.

Фертильность

Исследование репродуктивной токсичности не показали влияния гликлазида на фертильность

или репродуктивную токсичность у крыс обоего пола.

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

Прием препарата Голда не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Однако, в связи с возможным развитием гипогликемии при применении 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

Учитывая опыт применения гликлазида и других производных сульфонилмочевины, следует помнить о возможности развития следующих нежелательных реакций.

Гипогликемия

Как и другие препараты группы сульфонилмочевины, гликлазид может вызывать гипогликемию в случае нерегулярного приёма пищи и особенно, если приём пищи пропущен. Возможные симптомы гипогликемии: головная боль, сильное чувство голода, тошнота, рвота, повышенная утомляемость, нарушение сна, раздражительность, 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 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 тяжелой или длительной гипогликемии показана неотложная медицинская помощь, возможно, с госпитализацией, даже при наличии эффекта от приема углеводов.

Описание отдельных нежелательных реакций

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

Реже отмечаются следующие нежелательные реакции:

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.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, отек Квинке, эритема, макулопапулезная сыпь, буллезные реакции (такие как синдром

Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и аутоиммунные буллезные нарушения) и, в исключительных случаях: лекарственная сыпь с эозинофилией и системной симптоматикой [DRESS-синдром];

Следующие нежелательные реакции обычно обратимы в случае прекращения терапии:

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

Нежелательные реакции, характерные для терапии препаратами сульфонилмочевины

Как и на фоне приема других производных сульфонилмочевины отмечались следующие нежелательные реакции: эритроцитопения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, панцитопения, аллергический васкулит, гипонатриемия. Отмечалось повышение активности «печеночных» ферментов, нарушение функции печени (например, с развитием холестаза и желтухи) и гепатит, проявления уменьшались со временем 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.

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

Телефон: +7 800 550 99 03

Адрес электронной почты: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке производных сульфонилмочевины, в том числе и гликлазида, может развиваться гипогликемия.

При развитии гипогликемии средней тяжести без нарушения сознания или неврологических симптомов 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 скорой медицинской помощи и немедленная госпитализация.

Лечение

В случае гипогликемической комы или при подозрении на нее пациенту внутривенно струйно вводят 50 мл 20–30 % раствора декстрозы (глюкозы). Затем внутривенно капельно вводят 10 % раствор декстрозы 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 48 последующих часов. По прошествии данного периода времени 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: средства для лечения сахарного диабета; гипогликемические средства, кроме инсулинов; производные сульфонилмочевины.

Код АТХ: A10BB09.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Гликлазид является производным сульфонилмочевины, пероральным гипогликемическим препаратом, который отличается от аналогичных препаратов наличием N-содержащего гетероциклического кольца с эндоциклической связью.

Гликлазид снижает концентрацию глюкозы в крови, стимулируя секрецию инсулина β -клетками островков Лангерганса поджелудочной железы. Повышение концентрации постпрандиального инсулина и С-пептида сохраняется после 2 лет терапии.

Помимо влияния на углеводный обмен гликлазид оказывает гемоваскулярное действие.

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 и введением глюкозы.

Гемоваскулярное действие

Гликлазид снижает риск тромбозов мелких сосудов, влияя на механизмы, которые могут обуславливать развитие осложнений при сахарном диабете: частичное ингибирование агрегации и адгезии тромбоцитов и снижение концентрации факторов активации тромбоцитов (бета-тромбоглобулина, тромбоксана B2), а также на восстановление фибринолитической активности сосудистого эндотелия и повышение активности тканевого активатора плазминогена.

Интенсивный гликемический контроль при применении гликлазида ($HbA_{1c} < 6,5 \%$) достоверно уменьшает частоту микро- и макрососудистых осложнений сахарного диабета 2 типа в сравнении со стандартным гликемическим контролем за счет значимого снижения основных микрососудистых осложнений на 14 %, возникновения и прогрессирования нефропатии на 21 %, появления микроальбуминурии на 9 %, макроальбуминурии на 30 % и развития осложнений со стороны почек на 11 %. Преимущества интенсивного гликемического контроля на фоне приема гликлазида не зависят от эффективности проводимой гипотензивной терапии.

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, средний уровень HbA1c 6,5 %) по сравнению с группой стандартного контроля (средний уровень 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, выходя на плато через 6–12 часов. Индивидуальная вариабельность низкая.

Прием пищи не влияет на степень абсорбции гликлазида. Взаимосвязь между принятой дозой (до 120 мг) и площадью под фармакокинетической кривой «концентрация - время» является линейной.

Распределение

С белками плазмы крови связывается приблизительно 95 % гликлазида. Объем распределения – около 30 л. Прием гликлазида 1 раз в сутки обеспечивает поддержание эффективной концентрации гликлазида в плазме крови более 24 часов.

Биотрансформация

Гликлазид метаболизируется преимущественно в печени. Активные метаболиты в плазме крови не определяются.

Элиминация

Гликлазид выводится, главным образом, почками. Выведение осуществляется в виде метаболитов, менее 1 % выводится почками в неизмененном виде. Активные метаболиты в плазме крови отсутствуют. Период полувыведения гликлазида составляет, в среднем, от 12 до 20 часов.

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста не наблюдается существенных изменений фармакокинетических параметров.

Дети

Фармакокинетика у детей и подростков до 18 лет не изучалась.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

лактозы моногидрат
гипромеллоза 2208

карбоксиметилкрахмал натрия типа С
магния стеарат
кремния диоксид коллоидный

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке производителя при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

Первичная упаковка лекарственного препарата для дозировки 30 мг

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной марки ЭП-73 и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60, 70, 80, 90, 100, 120, 150, 180, 200 или 300 таблеток в банку полимерную с крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия. Свободное пространство заполняют ватой медицинской. На банки наклеивают этикетки из бумаги этикеточной или писчей, или из полимерных материалов, самоклеящиеся.

Первичная упаковка лекарственного препарата для дозировки 60 мг

По 7 и 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной марки ЭП-73 и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 25, 30, 40, 50, 60, 70, 75, 80, 84, 90, 100, 120, 125, 140, 150, 180, 250 или 300 таблеток в банку полимерную с крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия. Свободное пространство заполняют ватой медицинской. На банки наклеивают этикетки из бумаги этикеточной или писчей, или из полимерных материалов, самоклеящиеся.

Вторичная упаковка лекарственного препарата

По 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок №10 вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона для потребительской тары подгрупп хромовый или хром-эрзац или другого аналогичного качества. На пачку может наклеиваться этикетка с маркировкой из бумаги этикеточной или писчей, самоклеящаяся. Дополнительно на пачку могут наклеивать один или два прозрачных фиксирующих стикера из полимерных материалов. Пачки помещают в транспортную тару.

По 2, 4, 6, 8 или 10 контурных ячейковых упаковок №7 вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона для потребительской тары подгрупп хромовый или хром-эрзац или другого аналогичного качества. На пачку может наклеиваться этикетка с маркировкой из бумаги этикеточной или писчей, самоклеящаяся. Дополнительно на пачку могут наклеивать один или два прозрачных фиксирующих стикера из полимерных материалов. Пачки помещают в транспортную тару.

По 1 банке вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона для потребительской тары подгрупп хромовый или хром-эрзац или другого аналогичного качества. На пачку может наклеиваться этикетка с маркировкой из бумаги этикеточной или писчей, самоклеящаяся.

Дополнительно на пачку могут наклеивать один или два прозрачных фиксирующих стикера из полимерных материалов. Пачки помещают в транспортную тару.

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
ООО «Фармасинтез-Тюмень»
625059, Тюменская обл., г. Тюмень, тракт Велижанский 7 км, д. 2
Тел.: 8 (345) 239-38-56
Адрес электронной почты: info-pst@pharmasyntez.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей следует направлять по адресу:

Российская Федерация
ООО «Фармасинтез-Тюмень»
625059, Тюменская обл., г. Тюмень, тракт Велижанский 7 км, д. 2
Тел.: 8-800-100-15-50
Адрес электронной почты: info-pst@pharmasyntez.com

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Голда 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).