

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Алоглиптин, 12,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Алоглиптин, 25 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: алоглиптин.

Алоглиптин, 12,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 12,5 мг алоглиптина (в виде бензоата).

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

Алоглиптин, 25 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 25 мг алоглиптина (в виде бензоата).

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

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Алоглиптин, 12,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Капсуловидные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, на поперечном разрезе ядро от белого до почти белого цвета.

Алоглиптин, 25 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Капсуловидные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, на поперечном разрезе ядро от белого до почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Сахарный диабет 2 типа

Для улучшения гликемического контроля при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок:

– у взрослых в возрасте от 18 лет в качестве монотерапии, в комбинации с другими пероральными гипогликемическими средствами или с инсулином.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Рекомендуемая доза препарата Алоглиптин составляет 25 мг 1 раз в сутки в качестве монотерапии или в дополнение к метформину, тиазолидиндиону, производным

сульфонилмочевины или инсулину, или в качестве трехкомпонентной комбинации с метформином, тиазолидиндионом или инсулином.

При назначении препарата Алоглиптин в дополнение к метформину или тиазолидиндиону дозу последних препаратов следует оставить без изменения.

При комбинировании препарата Алоглиптин с производным сульфонилмочевины или инсулином дозу последних целесообразно уменьшить для снижения риска развития гипогликемии.

В связи с риском развития гипогликемии следует соблюдать осторожность при назначении трехкомпонентной комбинации препарата Алоглиптин с метформином и тиазолидиндионом. В случае развития гипогликемии возможно рассмотреть уменьшение дозы метформина или тиазолидиндиона.

Эффективность и безопасность алоглиптина при приеме в тройной комбинации с метформином и производным сульфонилмочевины окончательно не установлены.

Пропущенная доза

В случае если пациент пропустил прием препарата Алоглиптин, он должен принять пропущенную дозу как можно быстрее. Недопустим прием двойной дозы препарата Алоглиптин в один и тот же день.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Пациентам с легкой почечной недостаточностью (клиренс креатинина от > 50 до ≤ 80 мл/мин) коррекции дозы препарата Алоглиптин не требуется. У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (клиренс креатинина от ≥ 30 до ≤ 50 мл/мин) доза препарата Алоглиптин составляет 12,5 мг 1 раз в сутки.

Алоглиптин не должен применяться у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью и пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, нуждающихся в гемодиализе (клиренс креатинина < 30 мл/мин). Алоглиптин не изучался у пациентов, проходящих перитонеальный диализ.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется проводить оценку функции почек до начала лечения препаратом Алоглиптин и периодически в процессе лечения.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Не требуется коррекции дозы препарата Алоглиптин у пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести (от 5 до 9 баллов по шкале Чайлд-Пью). Препарат не исследовался у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью), поэтому он не должен применяться у данной группы пациентов.

Лица пожилого возраста (старше 65 лет)

Не требуется коррекции дозы препарата Алоглиптин у пациентов старше 65 лет. Тем не менее следует особенно тщательно подбирать дозу алоглиптина в связи с потенциальной возможностью снижения функции почек у данной группы пациентов.

Дети

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

Способ применения

Внутрь.

Препарат Алоглиптин может приниматься независимо от приема пищи. Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая, запивая водой.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к алоглиптину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- серьезные реакции гиперчувствительности к любому ингибитору дипептидилпептидазы-4 (ДПП-4) в анамнезе, в том числе анафилактические реакции, анафилактический шок и ангионевротический отек;
- сахарный диабет 1 типа;
- диабетический кетоацидоз;
- хроническая сердечная недостаточность (функциональный класс III–IV по классификации хронической сердечной недостаточности Нью-Йоркской кардиологической ассоциации);
- тяжелая печеночная недостаточность (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) из-за отсутствия клинических данных о применении;
- тяжелая почечная недостаточность;
- беременность, период грудного вскармливания – в связи с отсутствием клинических данных по применению.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

При применении препарата следует соблюдать осторожность при следующих состояниях:

- Острый панкреатит в анамнезе (см. раздел 4.4., подраздел «Острый панкреатит»).
- У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (см. раздел 4.4., подраздел «Почечная недостаточность»).
- В комбинации с производным сульфонилмочевины или инсулином (см. раздел 4.4., подраздел «Применение с другими гипогликемическими препаратами»).
- Прием трехкомпонентной комбинации препарата Алоглиптин с метформином и тиазолидиндионом (см. раздел 4.4., подраздел «Применение с другими гипогликемическими препаратами»).

Применение с другими гипогликемическими препаратами

С целью уменьшения риска развития гипогликемии рекомендуется снижение дозы производных сульфонилмочевины, инсулина или комбинации пиоглитазона (тиазолидиндиона) с метформином при одновременном применении с препаратом Алоглиптин (см. раздел 4.2.).

Неизученные комбинации

Эффективность и безопасность применения препарата Алоглиптин в комбинации с ингибиторами натрийзависимых переносчиков глюкозы 2 типа или аналогами глюкагоноподобного пептида и в тройной комбинации с метформином и производными сульфонилмочевины не исследовались.

Почечная недостаточность

Так как пациентам с почечной недостаточностью средней степени тяжести требуется проводить коррекцию дозы препарата Алоглиптин, рекомендуется проводить оценку функции почек до начала и периодически в течение лечения (см. раздел 4.2.).

Опыт применения алоглиптина у пациентов, находящихся на гемодиализе, ограничен. Препарат Алоглиптин не должен применяться у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, а также у пациентов с терминальной стадией хронической почечной недостаточностью, требующей гемодиализа (см. раздел 4.2.). Алоглиптин не изучался у пациентов, проходящих перитонеальный диализ.

Острый панкреатит

Применение ингибиторов ДПП-4 связано с потенциальным риском развития острого панкреатита. В обобщенном анализе 13 клинических исследований применения алоглиптина

в дозе 25 мг/сут, 12,5 мг/сут, препарата сравнения и плацебо частота развития острого панкреатита составила 2, 1, 1 или 0 случаев на 1000 пациенто-лет в каждой группе соответственно. В исследовании сердечно-сосудистых исходов частота выявления острого панкреатита у пациентов, проходивших лечение алоглиптином или плацебо, составила 3 и 2 случая на 1000 пациенто-лет соответственно. Пациенты должны быть проинформированы о характерных симптомах острого панкреатита: стойкая сильная боль в животе, которая может иррадиировать в спину. При подозрении на развитие острого панкреатита прием препарата Алоглиптин прекращают; при подтверждении острого панкреатита прием препарат не возобновляют. Нет данных о том, существует ли повышенный риск развития панкреатита на фоне приема препарата Алоглиптин у пациентов с панкреатитом в анамнезе. Поэтому пациентам с панкреатитом в анамнезе следует соблюдать осторожность.

Печеночная недостаточность

Были получены постмаркетинговые сообщения о нарушениях функции печени, включая печеночную недостаточность при приеме алоглиптина. Их связь с применением препарата не была установлена. Однако пациентов необходимо тщательно обследовать на наличие возможных отклонений функции печени. Если обнаружены отклонения в функции печени и альтернативная этиология их возникновения не установлена, следует рассмотреть возможность прекращения лечения препаратом.

Буллезный пемфигоид

В пострегистрационном периоде наблюдения были получены сообщения о буллезном пемфигоиде у пациентов, принимающих ингибиторы ДПП-4, включая алоглиптин. При подозрении на буллезный пемфигоид применение препарата должно быть прекращено.

Вспомогательные вещества

Лактоза

Препарат в дозировке 12,5 мг содержит лактозу. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

Натрий

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Влияние других лекарственных препаратов на алоглиптин

Алоглиптин в основном выводится из организма в неизменном виде почками и в незначительной степени метаболизируется ферментной системой цитохрома (CYP) P450.

В исследованиях по взаимодействию с другими лекарственными средствами на фармакокинетику алоглиптина не оказывали клинически значимого эффекта следующие препараты: гемфиброзил (ингибитор CYP2C8/9), флуконазол (ингибитор CYP2C9), кетоконазол (ингибитор CYP3A4), циклоспорин (ингибитор р-гликопротеина), ингибитор α-глюкозидазы, дигоксин, метформин, циметидин, пиоглитазон или atorвастатин.

Влияние алоглиптина на другие лекарственные препараты

В исследованиях *in vitro* показано, что алоглиптин не ингибирует и не индуцирует изоформы CYP 450 в концентрациях, достигаемых при приеме алоглиптина в рекомендуемой дозе 25 мг. Взаимодействия с изоформами CYP 450 не ожидается и выявлено не было.

В исследованиях *in vitro* выявлено, что алоглиптин не является ни субстратом, ни ингибитором почечных транспортеров органических анионов человека первого (OAT1) и третьего (OAT3) типов и почечных транспортеров органических катионов человека второго (OCT2) типа.

Кроме того, данные клинических исследований не указывают на взаимодействие с ингибиторами или субстратами р-гликопротеина.

В клинических исследованиях по взаимодействию с другими лекарственными средствами алоглиптин не оказывал клинически значимого влияния на фармакокинетику следующих препаратов: кофеина, (R)- и (S)-варфарина, пиоглитазона, глибенкламида, толбутамида, декстрометорфана, аторвастатина, мидазолама, пероральных контрацептивов (норэтиндрон и этинилэстрадиол), дигоксина, фексофенадина, метформина или циметидина. Основываясь на этих данных, алоглиптин не ингибирует изоферменты системы цитохрома CYP1A2, CYP3A4, CYP2D6, CYP2C9, р-гликопротеин и OCT2.

Алоглиптин не оказывал воздействия на протромбиновый индекс или международное нормализованное отношение (МНО) у здоровых добровольцев при одновременном приеме с варфарином.

Прием алоглиптина в комбинации с метформином, или пиоглитазоном (тиазолидиндион), или ингибитором α -глюкозидазы, или глибенкламидом (производное сульфонилмочевины) не показал клинически значимых фармакокинетических взаимодействий.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Исследований применения алоглиптина у беременных женщин не проводилось. Исследования на животных не показали прямого или непрямого негативного воздействия алоглиптина на репродуктивную систему. Однако в целях предосторожности применение препарата Алоглиптин во время беременности противопоказано.

Лактация

Отсутствуют данные о проникновении алоглиптина в грудное молоко у людей. Исследования на животных показали, что алоглиптин проникает в грудное молоко, поэтому нельзя исключить риск возникновения побочных эффектов у грудных детей. В связи с этим применение препарата в период грудного вскармливания противопоказано.

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

Препарат Алоглиптин не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Тем не менее необходимо учитывать риск развития гипогликемии при применении препарата в сочетании с другими гипогликемическими препаратами (производные сульфонилмочевины, инсулин или комбинированная терапия с пиоглитазоном и метформином) и соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения побочных эффектов определялась в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Инфекции и инвазии

часто – инфекции верхних дыхательных путей, назофарингит.

Нарушения со стороны иммунной системы

частота неизвестна – реакции гиперчувствительности, включая анафилактическую реакцию.

Нарушения метаболизма и питания

часто – гипогликемия в случае совместного применения с производными сульфонилмочевины или препаратами инсулина.

Нарушения со стороны нервной системы

часто – головная боль.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

часто – боль в эпигастральной области, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, диарея; частота неизвестна – острый панкреатит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

частота неизвестна – нарушение функции печени, в том числе печеночная недостаточность.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

часто – зуд, сыпь;

частота неизвестна – эксфолиативные кожные заболевания, включая синдром Стивенса-Джонсона, полиморфная эритема, ангионевротический отек, крапивница, буллезный пемфигоид.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

частота неизвестна – интерстициальный нефрит.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

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

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

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

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

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

4.9. Передозировка

Максимальная доза алоглиптина в клинических исследованиях составляла 800 мг/сут у здоровых добровольцев и 400 мг/сут у пациентов с сахарным диабетом 2 типа в течение 14 дней. Это в 32 и 16 раз соответственно превышает рекомендуемую суточную дозу 25 мг алоглиптина.

Симптомы

Какие-либо серьезные нежелательные явления при приеме препарата в этих дозах отсутствовали.

Лечение

При передозировке может быть рекомендовано промывание желудка и симптоматическое лечение. Алоглиптин слабо диализируется. В клинических исследованиях только 7 % дозы удалялось из организма в течение 3-часового сеанса диализа. Данных об эффективности перитонеального диализа алоглиптина нет.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения сахарного диабета; гипогликемические средства, кроме инсулинов; ингибиторы дипептидилпептидазы-4 (ДПП-4).

Код АТХ: A10BH04.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Алоглиптин является сильнодействующим и высокоселективным ингибитором ДПП-4. Его избирательность в отношении ДПП-4 более чем в 10 000 раз превосходит его действие в отношении других родственных ферментов, включая ДПП-8 и ДПП-9. ДПП-4 является основным ферментом, участвующим в быстром разрушении гормонов семейства инкретинов: глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1) и глюкозозависимого инсулиотропного полипептида (ГИП).

Гормоны семейства инкретинов секретируются в кишечнике, их концентрация повышается в ответ на прием пищи. ГПП-1 и ГИП увеличивают синтез инсулина и его секрецию бета-клетками поджелудочной железы. ГПП-1 также ингибирует секрецию глюкагона и уменьшает продукцию глюкозы печенью. Поэтому, повышая концентрацию инкретинов, алоглиптин увеличивает глюкозозависимую секрецию инсулина и уменьшает секрецию глюкагона при повышенной концентрации глюкозы в крови. У пациентов с сахарным диабетом 2 типа с гипергликемией эти изменения секреции инсулина и глюкагона приводят к снижению концентрации гликозилированного гемоглобина HbA1c и уменьшению концентрации глюкозы в плазме крови как натощак, так и постприандально.

Клиническая безопасность

Сердечно-сосудистая безопасность

Согласно обобщенному анализу данных из 13 исследований, общая частота смертельных случаев от сердечно-сосудистых заболеваний, нефатальных случаев инфаркта миокарда и нефатальных случаев инсульта оказалась сопоставимой у пациентов, проходивших лечение 25 мг алоглиптина, активным контролем или плацебо.

Кроме того, проводилось проспективное рандомизированное исследование безопасности сердечно-сосудистых исходов EXAMINE (NCT00968708) с участием 5380 пациентов с сопутствующим высоким сердечно-сосудистым риском для изучения влияния алоглиптина в сравнении с плацебо (при добавлении к стандартному лечению) на серьезные нежелательные сердечно-сосудистые явления (МАСЕ), включая время до возникновения первого явления, такого как смерть от сердечно-сосудистого заболевания, нефатальный инфаркт миокарда (ИМ) и нефатальный инсульт, у пациентов, недавно перенесших (от 15 до 90 дней) острое коронарное явление. В начале исследования средний возраст пациентов составил 61 год, средняя продолжительность заболевания сахарным диабетом составила 9,2 лет, а средний уровень HbA1c составил 8,0 %.

Результаты исследования указывали на то, что алоглиптин не повышал риск возникновения МАСЕ по сравнению с плацебо [отношение рисков: 0,96; 1-сторонний 99 % доверительный интервал: 0-1,16]. В группе, получавшей алоглиптин, у 11,3 % пациентов отмечалось МАСЕ по сравнению с 11,8 % пациентов в группе, получавшей плацебо.

Таблица 1. МАСЕ, зарегистрированные в ходе исследования сердечно-сосудистых исходов

	Количество пациентов (%)	
	Алоглиптин 25 мг	Плацебо
	N = 2,701	N = 2,679

Первичная комбинированная конечная точка [первое явление смерти от сердечно-сосудистого заболевания, нефатального ИМ и нефатального инсульта]	305 (11,3)	316 (11,8)
Смерть от сердечно-сосудистого заболевания*	89 (3,3)	111 (4,1)
Нефатальный инфаркт миокарда	187 (6,9)	173 (6,5)
Нефатальный инсульт	29 (1,1)	32 (1,2)
*В целом, умерли 153 участника (5,7 %) в группе, получавшей алоглиптин, и 173 участника (6,5 %) в группе, получавшей плацебо (смертность по любой причине).		

Было зарегистрировано 703 пациента, перенесших явление вторичной комбинированной конечной точки MACE (первое явление смерти от сердечно-сосудистого заболевания, нефатального инфаркта миокарда, нефатального инсульта и неотложной реваскуляризации вследствие нестабильной стенокардии). В группе, получавшей алоглиптин, 12,7 % (344 участника) перенесли явление во вторичной комбинированной конечной точке MACE по сравнению с 13,4 % (359 участников) в группе, получавшей плацебо [отношение рисков = 0,95; 1-сторонний 99 % доверительный интервал: 0-1,14].

Анализ данных исследования EXAMINE установил, что алоглиптин в составе комбинированной терапии СД 2 типа снижал риск достижения комбинированной конечной точки MACE (смерть по причине сердечно-сосудистых заболеваний, нефатальный инсульт и нефатальный инфаркт миокарда) у пациентов с нормальной или умеренно сниженной функцией почек, сердечно-сосудистую смертность и смертность от всех причин.

5.2. Фармакокинетические свойства

Фармакокинетика алоглиптина схожа у здоровых лиц и у пациентов с сахарным диабетом 2 типа.

Абсорбция

Абсолютная биодоступность алоглиптина составляет приблизительно 100 %.

Одновременный прием с пищей с высоким содержанием жиров не оказывал влияние на площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) алоглиптина, поэтому его можно принимать вне зависимости от приема пищи.

У здоровых лиц после однократного перорального приема до 800 мг алоглиптина отмечается быстрая абсорбция препарата с достижением средней максимальной концентрации (среднее TC_{max}) в интервале от 1 до 2 часов с момента приема.

Ни у здоровых добровольцев, ни у пациентов с сахарным диабетом 2 типа не наблюдалось клинически значимой кумуляции алоглиптина после многократного приема.

AUC алоглиптина пропорционально увеличивается при однократном приеме в терапевтическом диапазоне доз от 6,25 мг до 100 мг. Коэффициент вариабельности AUC алоглиптина среди пациентов небольшой (17 %).

AUC (0-inf) алоглиптина после однократного приема была схожа с AUC (0-24) после приема такой же дозы один раз в сутки в течение 6 дней. Это указывает на отсутствие временной зависимости в кинетике алоглиптина после многократного приема.

Распределение

После однократного внутривенного введения алоглиптина в дозе 12,5 мг у здоровых добровольцев объем распределения в терминальной фазе составлял 417 л, что указывает на то, что алоглиптин хорошо распределяется в тканях. Связь с белками плазмы составляет примерно 20-30 %.

Биотрансформация

Алоглиптин не подвергается интенсивному метаболизму, от 60 до 70 % алоглиптина выводится в неизмененном виде почками.

После введения ^{14}C -меченного алоглиптина внутри были определены два основных метаболита: N-деметилованный алоглиптин, М-I (< 1 % исходного вещества), и N-ацетилованный алоглиптин, М-II (< 6 % исходного вещества). М-I является активным метаболитом и высокоселективным ингибитором ДПП-4, схожим по действию с самим алоглиптином; М-II не проявляет ингибирующую активность по отношению к ДПП-4 или другим ДПП ферментам.

В исследованиях *in vitro* было выявлено, что CYP2D6 и CYP3A4 участвуют в ограниченном метаболизме алоглиптина.

Также исследования *in vitro* показывают, что алоглиптин не индуцирует CYP1A2, CYP2C9, CYP2B6 и не ингибирует CYP1A2, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6 или CYP3A4 в концентрациях, достигаемых при рекомендуемой дозе 25 мг алоглиптина. В условиях *in vitro* алоглиптин может в небольшой степени индуцировать CYP3A4, однако в условиях *in vivo* алоглиптин не индуцирует CYP3A4.

Алоглиптин не ингибирует почечные транспортеры органических анионов человека первого (OAT1), третьего (OAT3) типов и почечные транспортеры органических катионов человека второго (OCT2) типа.

Алоглиптин существует преимущественно в виде (R)-энантиомера (> 99 %) и в условиях *in vivo* или в небольших количествах, или вообще не подвергается хиральному преобразованию в (S)-энантиомер. (S)-энантиомер не обнаруживается при приеме алоглиптина в терапевтических дозах.

Элиминация

После перорального приема ^{14}C -меченного алоглиптина 76 % общей радиоактивности было выведено почками и 13 % – через кишечник.

Средний почечный клиренс алоглиптина (170 мл/мин) больше, чем средняя скорость клубочковой фильтрации (около 120 мл/мин), что позволяет предположить, что алоглиптин частично выводится за счет активной почечной экскреции. Средний терминальный период полувыведения алоглиптина ($T_{1/2}$) составляет приблизительно 21 час.

Особые группы пациентов

Почечная недостаточность

Исследование алоглиптина в дозе 50 мг в сутки было проведено у пациентов с различной степенью тяжести хронической почечной недостаточности. Включенные в исследование пациенты были разделены на 4 группы в соответствии с формулой Кокрофта-Голта: пациенты с легкой (клиренс креатинина от 50 до 80 мл/мин), средней степени тяжести (клиренс креатинина от 30 до 50 мл/мин) и тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), а также пациенты с терминальной стадией хронической почечной недостаточности, нуждающиеся в гемодиализе.

AUC алоглиптина у пациентов с легкой почечной недостаточностью увеличивалась приблизительно в 1,7 раз по сравнению с контрольной группой. Тем не менее данное увеличение AUC находилось в пределах допустимого отклонения для контрольной группы, поэтому коррекция дозы препарата у таких пациентов не требуется (см. раздел 4.2.).

Увеличение AUC алоглиптина приблизительно в два раза по сравнению с контрольной группой отмечалось у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести.

Приблизительно четырехкратное увеличение AUC отмечалось у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, а также у пациентов с терминальной стадией хронической почечной недостаточности по сравнению с контрольной группой (пациентам с терминальной стадией почечной недостаточности проводили гемодиализ сразу же после приема алоглиптина. Около 7 % дозы удалялось из организма в течение 3-х часового сеанса диализа). Таким образом, для достижения терапевтической концентрации алоглиптина в плазме крови, сходной с таковой у пациентов с нормальной функцией почек, необходима коррекция дозы у

пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (см. раздел 4.2.). Алоглиптин не рекомендуется принимать пациентам с тяжелой почечной недостаточностью, а также с терминальной стадией почечной недостаточности, требующей проведения гемодиализа.

Печеночная недостаточность

У пациентов со средней степенью тяжести печеночной недостаточности AUC и C_{max} алоглиптина уменьшаются приблизительно на 10 % и 8 % соответственно, по сравнению с пациентами с нормальной функцией печени. Данные значения клинически не значимы. Таким образом, коррекция дозы препарата при легкой и средней степени тяжести печеночной недостаточности (от 5 до 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) не требуется. Нет клинических данных о применении алоглиптина у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью, см. раздел 4.2.).

Лица пожилого возраста

Возраст (65-81 лет), пол, раса, масса тела пациентов не оказывали клинически значимого воздействия на фармакокинетические параметры алоглиптина. Коррекции дозы препарата не требуется (см. раздел 4.2.).

Дети

Фармакокинетика у детей до 18 лет не исследовалась.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Ядро

Маннитол

Целлюлоза микрокристаллическая, тип 101

Гипролоза

Кроскармеллоза натрия

Магния стеарат

Пленочная оболочка

Алоглиптин, 12,5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Готовая система пленочного покрытия желтого цвета, в том числе: гипромеллоза 15 сПз (гидроксипропилметилцеллюлоза 2910), лактозы моногидрат, титана диоксид E171, триацетин, краситель железа оксид желтый E172.

Алоглиптин, 25 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Готовая система пленочного покрытия розового цвета, в том числе: гипромеллоза 15 сПз (гидроксипропилметилцеллюлоза 2910), макрогол, титана диоксид E171, краситель железа оксид красный E172.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (блистер в пачке) для защиты от влаги при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из ламината холодного формования (ориентированный полиамид, мягкая закаленная алюминиевая фольга, поливинилхлорид (ОПА/Ал/ПВХ)) и гибкой упаковки на основе фольги алюминиевой.

По 3 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем в пачку из картона.

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

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод» (ФГУП «ЭНДОФАРМ»)

109052, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Нижегородский, ул. Новохохловская, д. 25, стр. 1

Тел.: +7 (495) 678-00-50

Факс: +7 (495) 911-42-10

Адрес электронной почты: mez@endopharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод» (ФГУП «ЭНДОФАРМ»)

109052, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Нижегородский, ул. Новохохловская, д. 25, стр. 1

Тел.: +7 (495) 678-00-50

Факс: +7 (495) 911-42-10

Адрес электронной почты: pv@endopharm.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Алоглиптин доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на

официальном сайте уполномоченного
(https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 16.04.2026 № 7856
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)
органа (экспертной организации)