

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения и
социального развития
Республики Казахстан
от «12» ___ 04___ 2016 г.
№ _001386_

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства
ДИАБЕТОН® MR**

Торговое название
Диабетон® MR

Международное непатентованное название
Гликлазид

Лекарственная форма
Таблетки с модифицированным высвобождением, 60 мг

Состав
Одна таблетка содержит
активное вещество - гликлазид 60 мг,
вспомогательные вещества: гипромеллоза 100 сП – 160,00 мг, лактозы
моногидрат – 71,36 мг, магния стеарат – 1,6 мг, мальтодекстрин – 22,00 мг,
кремния диоксид коллоидный безводный – 5,04 мг.

Описание
Таблетки белого цвета, продолговатой формы, с линией разлома и гравировкой
«DIA 60» на обеих сторонах

Фармакотерапевтическая группа
Средства для лечения сахарного диабета. Сахароснижающие препараты для
перорального приема. Производные сульфонилмочевины. Гликлазид
Код АТХ А10ВВ09

Фармакологическое действие

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема препарата внутрь гликлазид полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Концентрация гликлазида в плазме прогрессивно возрастает в течение первых 6 часов после приема и достигает плато, которое сохраняется с 6-го по 12-й час. Индивидуальная вариабельность относительно низка. Прием пищи не влияет на степень абсорбции. Объем распределения составляет примерно 30 литров. Связывание с белками плазмы составляет приблизительно 95%. Разовая суточная доза Диабетона[®] MR обеспечивает сохранение эффективной концентрации гликлазида в плазме крови в течение более 24 ч.

Метаболизм

Гликлазид метаболизируется преимущественно в печени. Образующиеся при этом метаболиты не обладают фармакологической активностью. Взаимосвязь между принятой дозой до 120 мг и концентрацией препарата в плазме представляет собой линейную зависимость от времени.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) гликлазида составляет 12-20 часов. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, менее 1% выводится с мочой в неизменном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У лиц пожилого возраста клинически значимых изменений фармакокинетических параметров не выявлено.

Фармакодинамика

Диабетон[®] MR - пероральный гипогликемический препарат из группы производных сульфонилмочевины II поколения, который отличается от аналогичных препаратов наличием N-содержащего гетероциклического кольца с эндоциклической связью.

Диабетон[®] MR снижает уровень глюкозы в крови, стимулируя секрецию инсулина Р-клетками островков Лангерганса. После двух лет лечения сохраняется повышение уровня постпрандиального инсулина и секреция С-пептидов. 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.

Помимо влияния на углеводный обмен, Диабетон[®] MR оказывает влияние на микроциркуляцию. Препарат снижает риск тромбозов мелких сосудов, влияя на два механизма, которые могут быть вовлечены в развитие осложнений при сахарном диабете: на частичное ингибирование агрегации и адгезии тромбоцитов и снижение концентрации факторов активации тромбоцитов (бета-тромбоглобулина, тромбоксана B_2), а также на восстановление фибринолитической активности сосудистого эндотелия и повышение активности тканевого активатора плазминогена.

Показания к применению

- сахарный диабет 2-го типа у взрослых, когда соблюдение диеты, физическая нагрузка и снижение веса оказываются недостаточными для адекватного контроля уровня глюкозы в крови

Способ применения и дозы

Препарат предназначен только для взрослых пациентов.

Таблетку(и) рекомендуется принимать не разжевывая, во время завтрака. В случае пропуска приема очередной дозы на следующий день дозу увеличивать нельзя.

Суточная доза Диабетона[®]MR составляет от 30 до 120 мг (от 1/2 до 2 таблеток). Доза препарата подбирается в зависимости от индивидуальной метаболической реакции пациента.

Рекомендуемая начальная доза составляет 30 мг в день. При эффективном контроле уровня глюкозы эта доза может использоваться в качестве поддерживающей терапии.

При неадекватном контроле уровня глюкозы суточная доза препарата может быть постепенно увеличена до 60, 90 или 120 мг. Интервал между каждым увеличением дозы должен составлять не менее 1 месяца, кроме пациентов у которых уровень глюкозы после 2 недель приема не снизился. В таких случаях дозу можно увеличить спустя 2 недели после начала терапии. Максимальная рекомендуемая доза составляет 120 мг в день.

Переход с таблеток гликлазида 80 мг на таблетки с модифицированным высвобождением Диабетон[®]MR

В случае эффективного контроля концентрация глюкозы в крови пациента таблетками гликлазида 80 мг, их можно заменить на Диабетон[®]MR в соотношении 1 таблетка гликлазида 80 мг = 1/2 таблетки Диабетона[®]MR 60 мг.

Переход с другого гипогликемического препарата на Диабетон[®]MR

При переходе следует учитывать дозировку и период полувыведения предыдущего препарата. Переходный период обычно не требуется. Прием Диабетона[®]MR следует начинать с 30 мг (или 1/2 таблетки Диабетона[®]MR 60 мг) с последующей корректировкой в зависимости от метаболической реакции.

При переходе с других препаратов группы сульфонилмочевины с длительным периодом полувыведения, во избежание аддитивного действия двух препаратов, может потребоваться безмедикаментозный период продолжительностью в несколько дней.

В таких случаях переход на таблетки Диабетона[®]MR следует начинать с рекомендуемой начальной дозы 30 мг с последующим поэтапным увеличением дозы в зависимости от метаболической реакции.

Применение в комбинации с другими противодиабетическими препаратами

Диабетон® MR может назначаться совместно с бигуанидами, ингибиторами альфа-глюкозидазы или инсулином. Одновременный прием инсулина должен быть начат под строгим наблюдением врача.

Пожилые пациенты (старше 65 лет)

Препарат назначается в той же дозе, что и пациентам моложе 65 лет.

Почечная недостаточность

Пациентам с легкими или умеренными нарушениями функции почек препарат назначают в обычных дозах.

Пациентам с повышенным риском развития гипогликемии: при недостаточном или неправильном питании, при тяжелых или слабо компенсированных эндокринных нарушениях (гипопитуитаризм, гипотиреоз, недостаток адренкортикотропного гормона), после продолжительной и/или высокодозированной кортикостероидной терапии, тяжелых сердечно-сосудистых заболеваниях лечение рекомендуется начинать с минимальной суточной дозы 30 мг.

Побочные действия

- гипогликемия (в случае нерегулярного приема или пропуска приемов пищи): головная боль, острое чувство голода, тошнота, рвота, быстрая утомляемость, нарушения сна, возбуждение, замешательство, агрессивность, слабая концентрация внимания, замедление реакции, депрессия, беспомощность, расстройства зрения и речи, афазия, парезы, дрожь, снижение чувствительности, головокружение, брадикардия, судороги, потеря самоконтроля, сонливость, поверхностное дыхание, потеря сознания, бред, приводящие к коме и летальному исходу. Возможно присоединение адренергической симптоматики: липкий пот, чувство тревоги, тахикардия, повышение артериального давления, боль в области сердца, аритмия
- боль в животе, тошнота, рвота, диарея, запоры (могут быть минимизированы приемом лекарственного препарата во время завтрака)
- обратимое повышение уровня печеночных ферментов (АЛТ, АСТ, щелочная фосфатаза), гепатит (редко), гипонатриемия
- кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек, эритема, макуло-папулезные высыпания, буллезные реакции (такие как синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз)
- анемия, лейкопения, тромбоцитопения, гранулоцитопения, панцитопения (обратимые после отмены препарата)
- преходящие нарушения зрения, особенно в начале лечения, в связи с изменениями уровня глюкозы в крови

Противопоказания

- известная повышенная чувствительность к гликлазиду или одному из вспомогательных компонентов препарата, а также к другим препаратам группы сульфонилмочевины или сульфонамидам
- сахарный диабет 1 типа
- диабетический кетоацидоз, прекоматозное состояние и диабетическая кома
- тяжелая почечная или печеночная недостаточность
- терапия миконазолом
- период беременности и лактации

Лекарственные взаимодействия

Совместный прием Диабетона[®] MR и миконазола противопоказан в связи с риском развития гипогликемии, вплоть до гипогликемической комы.

Диабетон[®] MR не рекомендуется применять одновременно с фенилбутаноном и алкоголем ввиду повышения риска развития гипогликемии. В период лечения препаратом необходимо воздерживаться от употребления алкоголя и приема медицинских препаратов, содержащих в составе спирт.

В связи с риском развития гипогликемии следует соблюдать осторожность при одновременном назначении Диабетона[®] MR и противодиабетических препаратов других групп (инсулины, акарбоза, бигуаниды), бета-блокаторов, флуконазола, ингибиторов ангиотензин-конвертирующего фермента (каптоприл, эналаприл), антагонистов H₂-рецепторов, ингибиторов моноаминоксидазы (ИМАО), сульфонамидов и нестероидных противовоспалительных препаратов.

Одновременный прием Диабетона[®] MR и даназола не рекомендуется ввиду риска повышения уровня глюкозы в крови. При необходимости назначения такой комбинации следует тщательно контролировать уровень глюкозы в крови и моче, а в некоторых случаях откорректировать дозу Диабетона[®] MR на время терапии даназолом и после нее.

Ввиду риска развития гипергликемии следует соблюдать осторожность при комбинировании Диабетона[®] MR с хлорпромазином (в дозе > 100 мг в день последний вызывает снижение секреции инсулина). На время терапии хлорпромазином может потребоваться коррекция дозы Диабетона[®] MR.

Глюкокортикостероиды (при системном и местном применении: внутрисуставном, под- или инъекционном, ректальном) и тетракозактид при одновременном приеме с Диабетона[®] MR повышают уровень глюкозы в крови и, вследствие снижения толерантности к углеводам, могут вызвать кетоз. В период лечения и после терапии глюкокортикоидами может потребоваться коррекция дозы Диабетона[®] MR.

Следует соблюдать осторожность при комбинированном приеме Диабетона[®] MR с ритодрином, сальбутамолом и тербуталином (внутривенно) в связи с риском развития гипергликемии. При необходимости следует перейти на инсулинотерапию.

При совместном применении Диабетона[®] MR с антикоагулянтами (варфарин и др.) может наблюдаться усиление антикоагулянтного эффекта.

Особые указания

Гипогликемия

Препарат следует назначать только при условии регулярного приема пищи пациентом (включая завтрак).

Риск возникновения гипогликемии повышается при низкокалорийной диете, после продолжительных или чрезмерных физических нагрузок, употреблении алкоголя или в случае комбинированного приема нескольких гипогликемических препаратов.

Ввиду повышенного риска развития гипогликемии рекомендуется дополнительно регулярно принимать углеводы (если продукты питания принимаются поздно, если потребляется недостаточное количество пищи или, если продукты питания имеют низкое содержание углеводов).

Гипогликемия может развиваться после применения препаратов производных сульфонилмочевины. Некоторые случаи могут быть серьезными и длительными по своей продолжительности. Может потребоваться госпитализация, а также может потребоваться введение глюкозы в течение нескольких дней.

Для снижения риска развития гипогликемических эпизодов требуется тщательный инструктаж пациента.

Факторы, повышающие риск развития гипогликемии:

- Отказ пациента или (особенно у пожилых пациентов) не способность следовать назначенному лечению,
- Неправильное питание, разное время приема пищи, пропускание приемов пищи, периоды голодания или изменение рациона,
- Отсутствие баланса между физическими нагрузками и приемом углеводов,
- Почечная недостаточность,
- Тяжелая печеночная недостаточность,
- Передозировка,
- Определенные эндокринные нарушения: нарушения со стороны щитовидной железы, гипопитуитаризм и недостаточность надпочечников,
- Одновременное применение других лекарственных препаратов.

Почечная и печеночная недостаточность: фармакокинетические и фармакодинамические свойства гликлазида могут измениться у пациентов с печеночной или серьезной почечной недостаточностью. Гипогликемические эпизоды, возникающие у таких пациентов, могут быть длительными по своей продолжительности, в связи с чем следует вести соответствующий контроль.

Пациент должен быть проинформирован о важности соблюдения диеты, необходимости регулярной физической нагрузки и регулярного контроля уровня глюкозы в крови. Больным и членам их семей необходимо разъяснить опасность

гипогликемии, рассказать о ее симптомах, способах лечения и факторах, предрасполагающих к развитию этого осложнения.

Неудовлетворительный контроль уровня глюкозы в крови

Эффективность контроля концентрации глюкозы в крови пациента, получающего противодиабетическую терапию, может снижаться под воздействием следующих факторов: повышении температуры тела, при травмах, инфекциях или хирургических вмешательствах. В некоторых случаях может возникнуть необходимость назначения инсулина.

Гипогликемическая эффективность любого перорального противодиабетического препарата, в том числе Диабетона[®] MR, у многих больных со временем уменьшается в связи с прогрессированием диабета или снижением реакции на препарат (вторичное отсутствие эффекта терапии). Заключение о вторичном отсутствии эффекта терапии можно сделать только после адекватной коррекции дозы и при соблюдении больным режима питания.

Лабораторные тесты

При оценке контроля уровня глюкозы в крови рекомендуется измерение уровня гликированного гемоглобина (или глюкозы в плазме венозной крови натощак).

Назначение препаратов группы сульфонилмочевины пациентам с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы может привести к гемолитической анемии. Следует соблюдать осторожность при назначении Диабетона[®] MR пациентам с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы и рассмотреть возможность альтернативного лечения препаратом другого класса.

Применение в педиатрии

Безопасность и эффективность гликлазида у детей и подростков изучена недостаточно. Данные о применении препарата у этой категории пациентов отсутствуют.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять автотранспортом или потенциально опасными механизмами

Следует проявлять осторожность при управлении автотранспортом или другими механизмами, особенно в начале терапии.

Передозировка

Симптомы: гипогликемия от умеренной до тяжелой степени.

Лечение: симптомы гипогликемии умеренной тяжести без потери сознания или признаков неврологических расстройств, устраняют приемом углеводов, коррекцией дозы и/или изменением питания. Строгий медицинский контроль необходимо продолжать, пока доктор не убедится, что пациент стабилизирован и вне опасности.

Тяжелые эпизоды гипогликемии, сопровождающиеся комой, судорогами или другими неврологическими расстройствами, требуют неотложной помощи и немедленной госпитализации. При наступлении гипогликемической комы или подозрении на нее следует немедленно ввести глюкагон и 50 мл

концентрированного раствора глюкозы (20-30% внутривенно), а затем продолжать инфузию 10% раствора глюкозы со скоростью, обеспечивающей поддержание концентрации глюкозы в крови на уровне более 1 г/л. Пациент должен находиться под строгим наблюдением врача. Гемодиализ не эффективен.

Форма выпуска

По 15 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 2 контурных упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в пачку из картона

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

3 года

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

Les Laboratoires Servier Industrie, Франция

Владелец регистрационного удостоверения

Les Laboratoires Servier, Франция



Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по продукции:

Представительство компании «Ле Лаборатуар Сервье С.А.С.» в РК

050020, г.Алматы, пр-т Достык 310г, Бизнес центр, 3 этаж

Тел.: (727) 386 76 62/63/64/70/71 , Факс: (727) 386 76 67

Электронная почта: kazadinfo@kz.netgrs.com