

ИНСУТОН INSUTON

ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ

Инсутон, Insuton

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ

Гликлазид, Gliclazide

ХИМИЧЕСКОЕ НАЗВАНИЕ

N-[[[Гексагидроциклопента[с]пиррол-2(1H)-ил)амино]карбонил] -
4метилфенилсульфона-мид

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с модифицированным высвобождением.

Описание:

Инсутон 30 мг: овальные двояковыпуклые таблетки белого цвета.

Инсутон 60 мг: овальные двояковыпуклые таблетки белого цвета с разделительными рисками с обеих сторон.

СОСТАВ

Таблетка с модифицированным высвобождением содержит

Активное вещество: гликлазид 30 мг или 60 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный безводный, гипромеллоза, магния стеарат.

КОД ПРЕПАРАТА ПО АТХ

A10BB09

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Сульфонамиды, производные мочевины.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

ФАРМАКОДИНАМИКА

Инсутон - пероральное гипогликемическое средство, производное сульфонилмочевины II поколения. Стимулирует секрецию инсулина поджелудочной железой, снижает уровень глюкозы в крови, усиливает инсулиносекреторное действие глюкозы и повышает чувствительность периферических тканей к инсулину. При длительном приеме не вызывает привыкания - сохраняется повышение уровня постпрандиального инсулина и секреция С-пептидов.

Инсутон сокращает промежуток времени от момента приема пищи до начала секреции инсулина. Восстанавливает ранний пик секреции инсулина в ответ на поступление глюкозы (в отличие от других производных сульфонилмочевины, которые оказывают действие, главным образом, в ходе второй стадии секреции). Усиливает вторую фазу секреции инсулина. Уменьшает пик гипергликемии после приема пищи.

Инсутон повышает чувствительность периферических тканей к инсулину, стимулируя активность мышечной гликогенсинтетазы. Снижает образование глюкозы в печени, нормализуя показатели уровня глюкозы натощак.

Помимо влияния на углеводный обмен, гликлазид улучшает микроциркуляцию - снижает риск тромбозов мелких сосудов, влияя на механизмы, 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 В2), а также на восстановление фибринолитической активности сосудистого эндотелия и повышение активности тканевого активатора плазминогена.

Гликлазид обладает антиоксидантными свойствами: снижает уровень липидных пероксидов в плазме, увеличивает активность эритроцитарной супероксиддисмутазы.

Ежедневный прием однократной дозы **Инсутона** обеспечивает эффективную терапевтическую концентрацию гликлазида в плазме крови на протяжении суток за счет формы пролонгированного действия.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

После приема внутрь гликлазид полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на всасывание. Концентрация действующего вещества в плазме крови постепенно возрастает, достигает максимума и выходит на плато через 6-12 часов после приема препарата.

Индивидуальная вариабельность относительно низка. Взаимосвязь между принятой дозой и концентрацией препарата в плазме крови представляет собой линейную зависимость от времени.

Связь с белками плазмы составляет приблизительно 95%.

Метаболизируется в печени и выводится, главным образом, почками. Выведение почками осуществляется преимущественно в виде метаболитов, менее 1% препарата выводится в неизменном виде.

Активные метаболиты в плазме отсутствуют. Период полувыведения составляет примерно 16 часов (от 12 до 20 часов).

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

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- сахарный диабет типа 2 в сочетании с диетотерапией при недостаточной эффективности диеты и физических нагрузок.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Препарат предназначен только для лечения взрослых!

Инсутон принимают внутрь 1 раз в день во время завтрака.

Для пациентов, ранее не получавших лечения, начальная доза составляет 30 мг (в т.ч. для лиц старше 65 лет). Затем дозу подбирают индивидуально до достижения необходимого терапевтического эффекта. Подбор дозы необходимо проводить в соответствии с показателем уровня глюкозы в крови после начала лечения. Каждое следующее изменение дозы может быть предпринято после как минимум двухнедельного периода.

Ежедневная доза препарата может варьировать от 30 до 90-120 мг. Суточная доза не должна превышать 120 мг.

Инсутон может заменять таблетки гликлазида с обычным высвобождением. При пропуске одного или более приемов препарата нельзя принимать более высокую дозу в следующий прием (на следующий день).

При замене другого гипогликемического препарата таблетками **Инсутон** не требуется какого-либо переходного периода времени. Необходимо сначала завершить прием суточной дозы другого препарата и только на следующий день начать принимать **Инсутон**.

Если больной до этого получал терапию препаратами сульфонилмочевины с более длительным периодом полувыведения, то необходимо тщательное наблюдение

(контроль уровня глюкозы крови) в течение 1-2 недель, чтобы избежать гипогликемии как следствия остаточных эффектов предыдущей терапии.

Таблетки **Инсутон** можно применять в сочетании с бигуанидами, ингибиторами альфа-глюкозидазы или инсулином.

Пациентам с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести препарат назначают в таких же дозах, как и пациентам с нормальной функцией почек. При почечной недостаточности тяжелой степени таблетки **Инсутон** противопоказаны.

Пациенты с риском развития гипогликемии

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

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к гликлазиду или какому-либо из вспомогательных веществ препарата, к другим производным сульфаниламочевина, к сульфаниламидам;
- сахарный диабет типа 1;
- диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, диабетическая кома;
- тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность;
- беременность и период лактации;
- возраст до 18 лет;
- прием миконазола;
- врожденная непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Не рекомендуется применять препарат одновременно в комбинации с фенилбутазоном или даназолом.

С осторожностью - пожилой возраст, нерегулярное и/или несбалансированное питание, тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. ИБС, атеросклероз), гипотиреоз, надпочечниковая или гипопитарная недостаточность, гипопитаритаризм, почечная и/или печеночная недостаточность, длительная терапия ГКС, алкоголизм, недостаточность глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Гипогликемия (при нарушении режима дозирования и неадекватной диете): головная боль, повышенная утомляемость, чувство голода, повышенное потоотделение, резкая слабость, сердцебиение, аритмия, повышение артериального давления, сонливость, бессонница, ажитация, агрессивность, тревожность, раздражительность, нарушение концентрации внимания, невозможность сосредоточиться и замедленная реакция, депрессия, нарушение зрения, афазия, тремор, парезы, сенсорные расстройства, головокружение, чувство беспомощности, потеря самоконтроля, делирий, судороги, поверхностное дыхание, брадикардия, потеря сознания, кома.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, абдоминальная боль, запор (выраженность этих симптомов снижается при приеме во время еды); редко - нарушения функции печени (гепатит, холестатическая желтуха - требует отмены препарата, повышение активности «печеночных» трансаминаз, щелочной фосфатазы).

Со стороны органов кроветворения: угнетение костномозгового кроветворения (анемия, тромбоцитопения, лейкопения, гранулоцитопения).

Аллергические реакции: кожный зуд, крапивница, кожная сыпь, в т.ч. макулопапулезная и буллезная), эритема.

Прочие: нарушение зрения.

Общие побочные эффекты производных сульфонилмочевины: эритропения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, панцитопения, аллергический васкулит; жизнеугрожающая печеночная недостаточность.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Лечение препаратом **Инсутон** проводят только в сочетании с низкокалорийной диетой с малым содержанием углеводов. Во время лечения таблетками **Инсутон** у пациента необходимо регулярно определять уровни глюкозы и гликозилированного гемоглобина в крови, содержание глюкозы в моче.

Инсутон может быть назначен только пациентам, получающим регулярное питание, обязательно включающее завтрак и обеспечивающее достаточное поступление углеводов. При назначении препарата следует учитывать, что вследствие приема производных сульфонилмочевины может развиваться гипогликемия, причем в некоторых случаях - в тяжелой и продолжительной форме, требующей госпитализации и введения глюкозы в течение нескольких дней. Гипогликемия чаще развивается при низкокалорийной диете, после продолжительных или энергичных физических упражнений, после употребления алкоголя или во время приема нескольких гипогликемических препаратов одновременно. Во избежание развития гипогликемии необходим тщательный и индивидуальный подбор доз, а также предоставление пациенту полной информации о предлагаемом лечении.

При физическом и эмоциональном перенапряжении, при изменении режима питания необходима коррекция дозы таблеток **Инсутон**.

Особенно чувствительны к действию гипогликемических препаратов: лица пожилого возраста; пациенты, не получающие сбалансированного питания, с общим ослабленным состоянием; больные, страдающие гипофизарно-надпочечниковой недостаточностью. Бета-адреноблокаторы, клонидин, резерпин, гуанетидин могут маскировать клинические проявления гипогликемии.

Следует предупредить пациентов о повышенном риске возникновения гипогликемии в случаях приема этанола, нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП), при голодании.

В случае приема этанола (алкоголя) возможно также развитие дисульфирамоподобного синдрома (боли в животе, тошнота, рвота, головная боль).

Большие хирургические вмешательства и травмы, обширные ожоги, инфекционные заболевания с лихорадочным синдромом могут потребовать отмены пероральных гипогликемических лекарственных средств и назначения инсулинотерапии.

Возможно развитие вторичной лекарственной резистентности (необходимо отличать от первичной, при которой лекарственное средство уже при первом назначении не дает ожидаемого клинического эффекта).

На фоне терапии препаратом **Инсутон** больному необходимо отказаться от употребления алкоголя и/или содержащих этанол препаратов и пищевых продуктов.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ К ВОЖДЕНИЮ АВТОТРАНСПОРТА И УПРАВЛЕНИЮ МЕХАНИЗМАМИ

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И ЛАКТАЦИИ

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. Препаратом выбора для терапии сахарного диабета у беременных является инсулин. Рекомендуется заменить прием пероральных гипогликемических препаратов на инсулинотерапию как в случае планируемой беременности, так и в том случае, если беременность наступила на фоне приема препарата.

Принимая во внимание отсутствие данных о поступлении гликлазида в грудное молоко и риск развития неонатальной гипогликемии, во время терапии препаратом кормление грудью противопоказано.

ПРИМЕНЕНИЕ В ПЕДИАТРИИ

Противопоказан у детей в возрасте до 18 лет.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Гликлазид усиливает действие антикоагулянтов (варфарин), может потребоваться коррекция дозы антикоагулянта.

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

Фенилбутазон (системное введение) усиливает гипогликемический эффект препарата (вытесняет из связи с белками плазмы и/или замедляет выведение из организма), необходим контроль глюкозы в крови и коррекция дозы гликлазида, как во время приема фенилбутафона, так и после его отмены.

Этанол и этанолсодержащие лекарственные средства усиливает гипогликемию, ингибируя компенсаторные реакции, может способствовать развитию гипогликемической комы.

При одновременном приеме с другими гипогликемическими лекарственными средствами (инсулин, акарбоза, бигуаниды), бета-адреноблокаторами, флуконазолом, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (каптоприл, эналаприл), блокаторами H₂-гистаминовых рецепторов (циметидин), ингибиторами моноаминоксидазы, сульфаниламидами и нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП) усиливается гипогликемический эффект и риск гипогликемии.

Даназол - диабетогенный эффект. Необходим контроль уровня глюкозы в крови и коррекция дозы гликлазида, как во время приема даназола, так и после его отмены.

Хлорпромазин в высоких дозах (более 100 мг/сут) увеличивает содержание глюкозы в крови, снижая секрецию инсулина. Необходим контроль глюкозы в крови и коррекция дозы гликлазида, как во время приема хлорпромазина, так и после его отмены.

ГКС (системное, внутрисуставное, наружное, ректальное применение) повышают содержание глюкозы крови с возможным развитием кетоацидоза (снижение толерантности к углеводам). Необходим контроль глюкозы в крови и коррекция дозы гликлазида, как во время приема ГКС, так и после их отмены.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин (внутривенное введение) - повышают содержание глюкозы в крови. Рекомендуется контроль глюкозы в крови и при необходимости - перевод пациента на терапию инсулином.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: гипогликемия, нарушение сознания, гипогликемическая кома.

Лечение: если пациент в сознании, внутрь принять сахар.

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

Если подозревают или диагностируют гипогликемическую кому, больному быстро внутривенно вводят 50 мл 40% раствора декстрозы (глюкозы). Затем внутривенно капельно вводят 5% раствор декстрозы (глюкозы) для поддержания необходимого уровня глюкозы в крови.

После восстановления сознания необходимо дать больному пищу, богатую легкоусвояемыми углеводами (во избежание повторного развития гипогликемии). Тщательный контроль уровня глюкозы в крови и наблюдение за пациентом необходима проводить как минимум в течение 48 последующих часов. По прошествии данного периода времени в зависимости от состояния больного лечащий врач решает вопрос о необходимости дальнейшего наблюдения.

Диализ неэффективен ввиду выраженного связывания гликлазида с белками плазмы.

ФОРМА ВЫПУСКА

Инсутон 30 мг или 60 мг

Таблетки с модифицированным высвобождением.

15 таблеток в блистере.

2 или 4 блистера вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ

3 года от даты производства.

Не применять по истечении срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Отпускается по рецепту.