

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Глюкозамин, 200 мг/мл, раствор для внутримышечного введения в комплекте с растворителем.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Раствор А: одна ампула (2 мл) содержит действующего вещества – глюкозамина сульфата 400 мг (в виде глюкозамина сульфата натрия хлорида 502,5 мг).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутримышечного введения.

Раствор А — прозрачный раствор от бесцветного до светло-коричневого цвета; раствор Б — прозрачный бесцветный раствор; раствор А+Б — прозрачный раствор от бесцветного до светло-коричневого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

– Облегчение симптомов боли (от легкой до умеренной) при адекватно диагностированном остеоартрите коленного сустава.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Перед применением смешать раствор Б (растворитель 1 мл) с раствором А (раствор препарата 2 мл) в одном шприце.

Приготовленный раствор препарата(раствор А+Б) вводить внутримышечно по 3 мл или 6 мл 3 раза в неделю в течение 4–6 недель.

Наличие желтоватой окраски раствора в ампуле А не влияет на эффективность и переносимость лекарственного препарата.

Препарат Глюкозамин не предназначен для лечения острого болевого синдрома. Облегчение симптомов (особенно, уменьшение болевых ощущений) может происходить только после нескольких недель лечения, а в некоторых случаях после более длительного времени. Если через 2–3 месяца применения не произошло никакого облегчения симптомов, необходимо пересмотреть лечение.

Особые группы пациентов

Пожилые пациенты

Никаких фармакокинетических исследований не проводилось для пациентов пожилого возраста.

Пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью

Никаких специальных исследований у пациентов с почечной или печеночной недостаточностью не проводилось (см. раздел 4.4).

Дети и подростки

Безопасность и эффективность препарата у детей и подростков не установлена.

Способ применения

Препарат предназначен исключительно для внутримышечного введения. Препарат не предназначен для внутривенного введения.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к глюкозамин сульфату или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- аллергия на моллюсков, так как действующее вещество (глюкозамин) получают из панцирей моллюсков и ракообразных.

В состав инъекционной формы препарата входит вспомогательное вещество лидокаин, который имеет следующие противопоказания:

- острая сердечная недостаточность;
- нарушения проводимости сердца;
- гиперчувствительность к лидокаину.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Глюкозамин может изменять гликемический профиль. Пациентам с непереносимостью глюкозы рекомендуется контролировать уровень глюкозы в крови и, при необходимости, определение потребности в инсулине до начала и периодически во время лечения (см. раздел 4.8).

У пациентов с известным фактором риска сердечно-сосудистых заболеваний рекомендуется мониторинг уровня липидов крови, поскольку у пациентов, получавших глюкозамин в нескольких случаях наблюдалась гиперхолестеринемия.

Описаны случаи обострения симптомов бронхиальной астмы после начала приема глюкозамина (эти симптомы разрешались после отмены глюкозамина) (см. раздел 4.8). Таким образом, пациенты, страдающие бронхиальной астмой и начавшие лечение глюкозамином, должны быть информированы о возможном ухудшении симптомов заболевания.

Никаких специальных исследований у пациентов с почечной или печеночной недостаточностью не проводилось. Тем не менее, применение глюкозамина у пациентов с тяжелой печеночной или почечной недостаточностью необходимо проводить под наблюдением врача.

Необходимо проконсультироваться с врачом, чтобы исключить наличие заболеваний суставов, для которых предусмотрены другие методы лечения.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Не проводилось особых исследований по изучению лекарственного взаимодействия.

Пероральные антикоагулянты

Не смотря на ограниченные данные о возможных лекарственных взаимодействиях с глюкозамином, сообщалось об увеличении показателя МНО (международное нормализованное отношение) при применении с антагонистами витамина К, вводимыми пероральным путем. Следовательно, пациенты, получающие пероральные антагонисты витамина К, должны тщательно контролироваться в начале или в конце терапии глюкозамином.

Тетрациклины

Одновременное применение тетрациклинов и глюкозамином может влиять на концентрацию тетрациклинов в сыворотке, но клиническая значимость этого взаимодействия, вероятно, ограничена.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Данные относительно применения препарата у беременных женщин отсутствуют, поэтому применение лекарственного препарата во время беременности не рекомендуется.

Лактация

Данные относительно применения препарата в период лактации отсутствуют, поэтому применение лекарственного препарата в период лактации не рекомендуется. Данные о попадании глюкозамина в грудное молоко отсутствуют.

Фертильность

Данные отсутствуют, применение препарата должно быть приостановлено у женщин, которые испытывают трудности с зачатием или которые проходят обследование в отношении бесплодия.

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

Исследования относительно воздействия препарата на способность управлять автомобилем и другими механизмами не проводились. Во время лечения глюкозамином могут развиваться головокружение, сонливость, усталость, головная боль или нарушение зрения, в таком случае, управления автотранспортом или работы с другими механизмами следует избегать.

4.8. Нежелательные реакции

Табличное резюме нежелательных реакций

Инъекционные формы глюкозамина из-за содержания лидокаина могут иногда вызывать тошноту и рвоту.

Нежелательные реакции перечислены в соответствии с системно-органной классификацией и частотой встречаемости: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\,000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1\,000$), очень редко ($< 1/10\,000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Системно-органный классификация	Частота	Нежелательные реакции
Нарушения со стороны иммунной системы	частота неизвестна	Аллергические реакции (повышенная чувствительность)
Нарушения метаболизма и питания	частота неизвестна	Неадекватный контроль гликемии при сахарном диабете (см. раздел 4.4)
Психические расстройства	частота неизвестна	Бессонница
Нарушения со стороны нервной системы	часто	Головная боль, сонливость
	частота неизвестна	Головокружение
Нарушения со стороны органа зрения	частота неизвестна	Нарушение зрения
Нарушения со стороны сердца	частота неизвестна	Аритмии, в том числе тахикардия
Нарушения со стороны сосудов	нечасто	Приливы
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	частота неизвестна	Бронхиальная астма/ухудшение течения астмы
Желудочно-кишечные нарушения	часто	Тошнота, боли в животе, нарушение пищеварения, диспепсия, метеоризм, запор и диарея, тяжесть в желудке и боль в верхней части живота
	частота неизвестна	Рвота
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей	частота неизвестна	Желтуха
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	нечасто	Эритема, зуд, сыпь
	частота неизвестна	Ангioneвротический отёк, крапивница, выпадение волос
Общие нарушения и реакции в месте введения	часто	Усталость
	частота неизвестна	Отёк/периферический отёк, реакции в месте инъекции
Лабораторные и инструментальные данные	частота неизвестна	Повышение «печеночных» ферментов, уровня глюкозы в крови, повышение артериального давления, колебания показателя международного нормализованного отношения.

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 национальную систему сообщения о нежелательных реакциях.

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

220037, г. Минск, Товарищеский пер., 2а

Телефон: +375 (17) 242-00-29

Факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

<http://www.rceth.by>

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

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

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

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

Республика Казахстан

РГП на ПХВ «Национальный центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» КМ и ФК МЗ РК

010000, г. Астана, ул. А. Иманова, 13 (БЦ «Нурсаулет 2»)

Телефон: +7 (7172) 235-135

Электронная почта: farm@dari.kz

Сайт: <http://www.ndda.kz>

4.9. Передозировка

Случаи передозировки (случайной или умышленной) неизвестны. В случаях передозировки следует остановить применение препарата и провести симптоматическое лечение, направленное на восстановление водно-электролитного баланса.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: другие нестероидные противовоспалительные и противоревматические препараты.

Код АТХ: M01AX05.

Механизм действия

Глюкозамина сульфат представляет собой соль аминокислоты глюкозамина, который является эндогенным компонентом и предпочтительным субстратом для синтеза гликозаминогликанов и протеогликанов суставного хряща и синовиальной жидкости.

Фармакодинамические эффекты

Глюкозамина сульфат оказывает анаболическое и антикатаболическое действие на метаболизм хряща. Глюкозамин предотвращает синтез NO (оксида азота) и PGE₂ (простагландина E₂) и высвобождение цитокинов, которые поддерживают воспаление и деградацию хряща.

В исследованиях *in vitro* было показано, что глюкозамин регулирует метаболизм хондроцитов, ингибируя сигнальный путь IL-1 β (интерлейкин-1 β) и блокируя активацию и ядерную транслокацию NF- κ B (ядерного фактора транскрипции). NF- κ B регулирует экспрессию провоспалительных генов, которые определяют синтез цитокинов, металлопротеаз, хемокинов и молекул адгезии, выделяющихся при воспалении. В хондроцитах ингибирование NF- κ B, индуцированное IL-1 β , вызывает снижение экспрессии и синтеза COX2, что определяет высвобождение PGE₂, который поддерживает воспаление. Доклинические исследования показали начало резистентности к инсулину, вызванной глюкозамином, что не подтверждено клиническими исследованиями.

Клиническая эффективность и безопасность

В 8 клинических исследованиях у пациентов с остеоартритом коленного сустава было обнаружено, что глюкозамин превосходит плацебо в отношении уменьшения боли [стандартизированная разница средних значений (SMD) -1,11 (ДИ 95 %: -1,66 - -0,57)].

Было обнаружено, что глюкозамин превосходит плацебо в 5 клинических исследованиях, где использовался алгофункциональный индекс Лекена [стандартизированная разница средних значений (SMD) -0,47 (ДИ 95 %: -0,82 - -0,12)].

Безопасность и эффективность глюкозамина сульфата были подтверждены в краткосрочных и долгосрочных клинических исследованиях (6 месяцев и 3 года соответственно). В 2 клинических исследованиях глюкозамин замедлял рентгенологическое прогрессирование остеоартроза коленного сустава после 3 лет лечения [стандартизированная разница средних значений (SMD) 0,32 (ДИ 95 %: 0,05-0,58)].

5.2. Фармакокинетические свойства

Глюкозамин – относительно небольшая молекула (молекулярная масса 179), которая легко растворима в воде и гидрофильных органических растворителях.

Доступная информация по фармакокинетике внутримышечного вводимого глюкозамина ограничена. Абсолютная биодоступность неизвестна. Объем распределения составляет примерно 5 литров, а период полувыведения после внутривенного введения – примерно 2 часа. Примерно 38 % внутривенно вводимой дозы выводится с мочой в неизменном виде.

Абсорбция

После ежедневного перорального приема 1 500 мг глюкозамина сульфата здоровыми добровольцами в условиях голодания, максимальные концентрации в плазме в стационарном состоянии (C_{max} , cc) в среднем составили через 3 ч (T_{max}) около $1\,602 \pm 423$ нг/мл между 1,5–4 ч (медиана: 3 ч, t_{max}) и AUC составила $14\,564 \pm 4\,138$ нг·ч/мл. В исследованиях *in vitro* и *in vivo* было показано, что фармакокинетика глюкозамина линейна. Биодоступность глюкозамина низкая ввиду эффекта первого прохождения. Абсолютная биодоступность глюкозамина у человека после перорального приема составила 44 %. Прием пищи не влияет на биодоступность.

Распределение

После пероральной абсорбции, глюкозамин распределяется в различных сосудистых компартментах, в том числе синовиальной жидкости. Глюкозамин не связывается с белками плазмы крови.

Метаболизм

Глюкозамин в основном метаболизируется путем превращения в гексозамин, независимо от системы цитохромов.

Экскреция

Период полувыведения глюкозамина из плазмы составляет 15 ч и выделение с мочой и калом.

Фармакокинетика у различных категорий пациентов

Пациенты с нарушением функции почек и/или печени

Исследования фармакокинетики глюкозамина у пациентов, с почечной или печеночной недостаточностью не проводились.

Дети и подростки

Исследования фармакокинетики глюкозамина у детей и подростков не проводилось.

Пожилые пациенты

Исследования фармакокинетики у пожилых пациентов не проводились.

5.3. Доклинические данные по безопасности

В исследованиях острой, подострой и хронической токсичности глюкозамина сульфат переносился хорошо.

В исследованиях *in vitro* не было выявлено мутагенного действия глюкозамина сульфата.

На данный момент исследования канцерогенности не проводились.

В исследованиях на крысах не было установлено влияние на фертильность, на внутриутробное и постнатальное развитие. Отсутствие влияния было подтверждено в исследованиях, проведенных на кроликах.

Глюкозамин в условиях *in vitro* снижает секрецию инсулина, вероятно, за счет ингибирования глюкокиназы в бета-клетках. В исследованиях на крысах внутривенное введение глюкозамина вызывало резистентность к инсулину.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Раствор А:

- лидокаина гидрохлорид (в виде лидокаина гидрохлорида моногидрата);
- раствор 1 М хлористоводородной кислоты;
- вода для инъекций.

Раствор Б:

- диэтаноламин;
- вода для инъекций.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (пачка) для защиты от света при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

Ампула А: по 2 мл в ампулы из прозрачного светозащитного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой излома.

Ампула Б: по 1 мл в ампулы из прозрачного бесцветного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой излома.

5 ампул с раствором А в комплекте с 5 ампулами с раствором Б вместе с ножом или скарификатором для вскрытия ампул и листком-вкладышем помещают в пачку из картона (№5).

В случае использования ампул с кольцом излома или с насечкой и точкой излома вложение ножа или скарификатора для вскрытия ампул не предусматривается.

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

Утилизация

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Республика Беларусь

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов»

222518, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64

Тел/факс +375 (177) 73-56-12, 74-42-80.

Электронная почта: market@borimed.com

**8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Глюкозамин, раствор для внутримышечного введения, доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>