Актрапид Нм



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 фл.**
инсулин растворимый (человеческий генно-инженерный)	100 МЕ*	1000 МЕ*

Вспомогательные вещества: цинка хлорид, глицерол, метакрезол, натрия гидроксид и/или хлористоводородная кислота (для поддержания уровня pH), вода д/и.

* *1 МЕ соответствует 35 мкг безводного человеческого инсулина.*

10 мл - флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Актрапид НМ - препарат инсулина короткого действия, произведенный методом биотехнологии рекомбинантной ДНК с использованием штамма Saccharomyces cerevisiae. Взаимодействует со специфическим рецептором внешней цитоплазматической мембраны клеток и образует инсулин-рецепторный комплекс. Через активацию биосинтеза цАМФ (в жировых клетках и клетках печени) или, непосредственно проникая в клетку (мышцы), инсулин-рецепторный комплекс стимулирует внутриклеточные процессы, в т. ч. синтез ряда ключевых ферментов (гексокиназа, пируваткиназа, гликогенсинтетаза и др.). Снижение содержания глюкозы в крови обусловлено повышением ее внутриклеточного транспорта, усилением поглощения и усвоения тканями, стимуляцией липогенеза, гликогеногенеза, синтеза белка, снижением скорости продукции глюкозы печенью и др.

Продолжительность действия препаратов инсулина в основном обусловлена скоростью всасывания, которая зависит от нескольких факторов (например, от дозы, способа, места введения и типа диабета). Поэтому профиль действия инсулина подвержен значительным колебаниям, как у различных людей, так и у одного и того же человека.

Действие препарата Актрапид НМ начинается в течение получаса после введения, а максимальный эффект проявляется в течение 1.5-3.5 ч, при этом общая продолжительность действия составляет около 7-8 ч.

.

Фармакокинетика

Всасывание

Полнота всасывания и начало эффекта инсулина зависит от способа введения (подкожно, внутримышечно), места введения (живот, бедро, ягодицы), дозы (объема вводимого инсулина), концентрации инсулина в препарате и др.

Максимальная концентрация (C_{max}) инсулина в плазме достигается в течение 1.5-2.5 ч после подкожного введения.
Распределение

Выраженного связывания с белками плазмы не отмечается, иногда выявляются только циркулирующие антитела к инсулину.

Метаболизм

Человеческий инсулин расщепляется под действием инсулиновой протеазы или инсулин-расщепляющих ферментов, а также, возможно, под действием протеин- дисульфид-изомеразы. Предполагается, что в молекуле человеческого инсулина имеется нескольких участков расщепления (гидролиза); однако ни один из метаболитов, образовавшихся вследствие расщепления, не является активным.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) определяется по скорости всасывания из подкожных тканей. Таким образом, $T_{1/2}$ скорее является мерой всасывания, а не собственно мерой выведения инсулина из плазмы ($T_{1/2}$ инсулина из кровотока равен всего нескольким минутам). Исследования показали, что $T_{1/2}$ составляет около 2-5 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетический профиль препарата Актрапид НМ изучали на немногочисленной группе детей с сахарным диабетом (18 человек) в возрасте 6-12 лет, а также подростков (в возрасте 13-17 лет). Хотя полученные данные считаются ограниченными, но они все же показали, что фармакокинетический профиль препарата Актрапид НМ у детей и подростков сходен с таковым у взрослых. Вместе с тем, были выявлены различия между разными возрастными группами по такому показателю как C_{max}, что еще раз подчеркивает необходимость индивидуального подбора дозы.

Показания к применению:

— сахарный диабет;

— неотложные состояния у больных сахарным диабетом, сопровождающиеся нарушением гликемического контроля.

Относится к болезням:

- Сахарный диабет

Противопоказания:

— гипогликемия;

— гиперчувствительность к человеческому инсулину или к какому-либо компоненту, входящему в состав данного препарата.

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен для п/к и в/в введения.

Доза препарата подбирается индивидуально, с учетом потребностей пациента. Обычно потребность в инсулине составляет от 0.3 до 1 МЕ/кг/сут. Суточная потребность в инсулине может быть выше у пациентов с инсулинорезистентностью (например, в период полового созревания, а также у пациентов с ожирением), и ниже - у пациентов с остаточной эндогенной продукцией инсулина.

Если у пациентов с сахарным диабетом достигается оптимальный контроль гликемии, то осложнения диабета у них, как правило, проявляются позднее. В связи с этим, следует стремиться к оптимизации метаболического контроля, в частности, проводя тщательный мониторинг уровня глюкозы в крови.

Актрапид НМ является инсулином короткого действия и может использоваться в комбинации с инсулинами пролонгированного действия.

Препарат вводится за 30 мин до приема пищи или легкой закуски, содержащей углеводы.

Актрапид НМ обычно вводят п/к, в область передней брюшной стенки. Если это удобно, то инъекции можно делать также в область бедра, в ягодичную область или в область дельтовидной мышцы плеча. При введении препарата в область передней брюшной стенки достигается более быстрое всасывание, чем при введении в другие области.

Выполнение инъекции в складку кожи уменьшает риск попадания в мышцу.

Необходимо менять места инъекций в пределах анатомической области, чтобы предотвратить развитие липодистрофий.

В/м инъекции также возможны, но только по назначению врача.

Актрапид НМ также возможно вводить в/в и такие процедуры может производить только медицинский работник.

Коррекция дозы

При **поражении почек или печени** потребность в инсулине снижается.

Инструкции по порядку использования и обращения с препаратом

Для в/в введения применяются инфузионные системы, содержащие препарат Актрапид НМ 100 МЕ/мл, в концентрациях от 0.05 МЕ/мл до 1 МЕ/мл человеческого инсулина в инфузионных растворах , таких как 0.9% раствор хлорида натрия, 5% и 10% растворы декстрозы, включающие хлорид калия в концентрации 40 ммоль/л; в системе для в/в введения используются инфузионные мешки, изготовленные из полипропилена; эти растворы сохраняют стабильность в течение 24 ч при комнатной температуре.

Хотя эти растворы сохраняют стабильность в течение определенного времени, на начальном этапе отмечается абсорбция некоторого количества инсулина материалом, из которого изготовлен инфузионный мешок. В ходе проведения инфузии необходимо осуществлять контроль уровня глюкозы в крови.

Инструкции по использованию Актрапид НМ, которые необходимо дать пациенту.

Флаконы с препаратом Актрапид НМ могут использоваться только вместе с инсулиновыми шприцами, на которые нанесена шкала, позволяющая отмерять дозу в единицах действия. Флаконы с препаратом Актрапид НМ предназначены только для индивидуального использования.

Перед применением препарата Актрапид ® НМ необходимо: пПроверить этикетку, чтобы убедиться, что выбран правильный тип инсулина; произвести дезинфекцию каучуковой пробки с помощью ватного тампона.

Препарат Актрапид ® НМ нельзя использовать в следующих случаях:

— в инсулиновых насосах;

— пациентам необходимо объяснить, что если на новом, только что полученном из аптеки флаконе, отсутствует защитная крышечка или она сидит неплотно - такой инсулин необходимо вернуть в аптеку;

— если инсулин хранился неправильно, или если он был заморожен.

— если инсулин перестал быть прозрачным и бесцветным.

Техника инъекции

Если пациент использует только один тип инсулина

1.Наберите в шприц воздух в количестве, соответствующем нужной дозе инсулина.

2. Введите воздух во флакон с инсулином. Для этого иглой прокалывают каучуковую пробку и нажимают на поршень.

3. Переверните флакон со шприцем вверх дном.

4. Наберите нужную дозу инсулина в шприц.

5. Выньте иглу из флакона.

6. Удалите воздух из шприца.

7. Проверьте правильность набора дозы инсулина.

8. Сразу же делайте инъекцию.

Если пациенту необходимо смешать Актрапид® НМ с инсулином длительного действия

1. Покатайте флакон с инсулином длительного действия ("мутным") между ладонями до тех пор, пока инсулин не станет равномерно белым и мутным.

2. Наберите в шприц воздух в количестве, соответствующем дозе "мутного" инсулина. Введите воздух во флакон с "мутным" инсулином и выньте иглу из флакона.

3. Наберите в шприц воздух в количестве, соответствующем дозе препарата Актрапид НМ ("прозрачного"). Введите

воздух во флакон с препарата Актрапид НМ.

4. Переверните флакон со шприцем ("прозрачным") вверх дном и наберите нужную дозу препарата Актрапид НМ. Выньте иглу и удалите из шприца воздух. Проверьте правильность набранной дозы.

5. Введите иглу во флакон с "мутным" инсулином.

6. Переверните флакон со шприцем вверх дном.

7. Наберите нужную дозу "мутного" инсулина.

8. Удалите иглу из флакона.

9. Удалите из шприца воздух и проверьте правильность набранной дозы.

10. Сразу же делайте инъекцию набранной смеси инсулина короткого и длительного действия.

Всегда набирайте инсулины короткого и длительного действия в одной и той же последовательности, описанной выше.

Проинструктируйте пациента, как вводить инсулин

1. Двумя пальцами возьмите складку кожи, введите иглу в основание складки под углом около 45 градусов и введите под кожу инсулин.

2. После инъекции игла должна оставаться под кожей как минимум 6 секунд, для того, чтобы убедиться, что инсулин введен полностью.

Побочное действие:

Побочные реакции, отмечавшиеся у пациентов на фоне терапии препаратом Актрапид НМ, преимущественно были дозо-зависимыми и были обусловлены фармакологическим действием инсулина. Как и при применении других препаратов инсулина, наиболее частым побочным эффектом является *гипогликемия.* Она развивается в случаях, когда доза инсулина значительно превышает потребность в нем. В ходе клинических исследований, а также в ходе применения препарата после его выпуска на потребительский рынок было установлено, что частота гипогликемии различна у разных популяций пациентов и при использовании различных режимов дозирования, поэтому указать точные значения частоты не представляется возможным.

При тяжелой гипогликемии могут отмечаться потеря сознания и/или судороги, может произойти временное или постоянное нарушение функции головного мозга и даже смерть. Клинические исследования показали, что частота гипогликемии в целом не различалась у пациентов, получавших человеческий инсулин, и у пациентов, получавших инсулин аспарт.

Ниже приводятся значения частоты побочных реакций, выявленных в ходе клинических исследовании, которые были расценены как связанные с применением препарата Актрапид НМ. Частота определялась следующим образом: нечасто (> 1/1000, < 1/100); очень редко (< 1/10000), включая изолированные спонтанные случаи.

Нарушения со стороны иммунной системы: нечасто - крапивница, сыпь; очень редко - анафилактические реакции. Симптомы генерализованной гиперчувствительности могут включать генерализованную кожную сыпь, зуд, потливость, нарушения со стороны органов ЖКТ, ангионевротический отек, одышку, сердцебиение, снижение АД, обморок /потерю сознания. Реакции генерализованной гиперчувствительности могут создавать угрозу для жизни.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко - периферическая нейропатия. Если улучшение контроля уровня глюкозы в крови было достигнуто очень быстро, может развиться состояние, называемое "острая болезненная невропатия", которое обычно обратимо.

Нарушения со стороны органа зрения: нечасто — нарушения рефракции. Нарушения рефракции обычно отмечаются на начальном этапе инсулинотерапии. Как правило, эти симптомы носят обратимый характер. Очень редко - диабетическая ретинопатия. Если в течение длительного времени обеспечивается адекватный контроль гликемии, то риск прогрессирования диабетической ретинопатии снижается. Однако интенсификация инсулинотерапии с резким улучшением контроля гликемии может приводить к временному усилению выраженности диабетической ретинопатии.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто — липодистрофия. Липодистрофия может развиваться в месте проведения инъекций в том случае, когда не осуществляют постоянную смену места инъекции в пределах одной области тела.

Нарушения со стороны организма в целом, а также реакции в месте введения препарата: нечасто —реакции в месте проведения инъекции. На фоне терапии инсулином могут возникать реакции в месте проведения инъекции (покраснение кожи, припухлость, зуд, болезненность, образование гематомы в месте проведения инъекции). Однако

в большинстве случаев эти реакции носят преходящий характер и в процессе продолжения терапии исчезают. Нечасто — отечность. Отечность обычно отмечается на начальном этапе инсулинотерапии. Как правило, этот симптом носит преходящий характер.

Передозировка:

Специфической дозы, при введении которой можно было бы говорить о передозировке инсулина, не установлено, однако в случаях, когда пациентам вводятся слишком высокие дозы, превосходящие их потребности, возможно развитие состояния *гипогликемии* различной степени тяжести.

Легкую гипогликемию пациент может устранить сам, приняв внутрь сахар или богатые углеводами продукты питания. Поэтому, больным сахарным диабетом рекомендуется постоянно носить с собой сахар, сладости, печенье или сладкий фруктовый сок.

В тяжелых случаях, при потере пациентом сознания, в/в вводят 40 % раствор декстрозы (глюкозы); в/м, п/к - глюкагон (0.5-1 мг). После восстановления сознания пациенту рекомендуют принять пищу, богатую углеводами, для предотвращения повторного развития гипогликемии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ограничений по применению инсулина во время беременности не существует, поскольку инсулин не проникает через плацентарный барьер. Более того, если не проводить лечения сахарного диабета во время беременности, то создается опасность для плода. Поэтому терапию диабета необходимо продолжать и во время беременности.

Как гипогликемия, так и гипергликемия, которые могут развиваться в случаях недостаточно точно подобранной терапии, повышают риск возникновения пороков развития плода и внутриутробной гибели плода. Беременные женщины с диабетом в течение всей беременности должны находиться под наблюдением, у них необходимо осуществлять усиленный контроль уровня глюкозы в крови; такие же рекомендации относятся и к женщинам, которые планируют беременность.

Потребность в инсулине обычно снижается в первом триместре беременности и постепенно увеличивается во втором и третьем триместрах.

После родов потребность в инсулине быстро возвращается к уровню, который отмечался до беременности.

Также не существует ограничений для использования препарата Актрапид НМ в период грудного вскармливания. Проведение инсулинотерапии кормящим матерям не представляет опасности для ребенка. Однако матери может потребоваться корректировка режима дозирования препарата Актрапид НМ и/или диеты.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Имеется ряд лекарственных средств, которые влияют на потребность в инсулине.

Гипогликемическое действие инсулина усиливают пероральные гипогликемические препараты, ингибиторы моноаминооксидазы, ингибиторы АПФ, ингибиторы карбоангидразы, неселективные бета-адреноблокаторы, бромокриптин, сульфонамиды, анаболические стероиды, тетрациклины, клофиорат, кетоконазол, мебендазол, пиридоксин, теофиллин, циклофосфамид, фенфлурамин, препараты лития, препараты, содержащие этанол.

Гипогликемическое действие инсулина ослабляют пероральные контрацептивы, ГКС, тиреоидные гормоны, тиазидные диуретики, гепарин, трициклические антидепрессанты, симпатомиметики, даназол, клонидин, блокаторы кальциевых каналов, диазоксид, морфин, фенитоин, никотин.

Под влиянием резерпина и салицилатов возможно как ослабление, так и усиление действия препарата.

Бета-адреноблокаторы могут маскировать симптомы гипогликемии и затруднять устранение гипогликемии.

Октреотид/ланреотид могут как уменьшать, так и увеличивать потребность в инсулине.

Алкоголь может усиливать и удлинять гипогликемическое действие инсулина.

Несовместимость

Актрапид НМ можно добавлять только к тем соединениям, с которыми он, как известно, совместим. Некоторые препараты (например, препараты, содержащие тиолы или сульфиты) при добавлении к раствору инсулина могут вызвать его деградацию.

Особые указания и меры предосторожности:

При неправильно подобранной дозе или при отмене терапии может развиться гипергликемия, особенно у пациентов с диабетом 1 типа. Первые симптомы гипергликемии обычно проявляются постепенно, в течение нескольких часов или дней. К таким симптомам относятся тошнота, рвота, выраженная сонливость, покрасневшая, сухая кожа, сухость во рту, увеличенное выделение мочи, жажда, потеря аппетита, а также запах ацетона изо рта.

Если не проводить лечение гипергликемия при сахарном диабете 1 типа может приводить к развитию опасного для жизни диабетического кетоацидоза. В случаях значительного улучшения гликемического контроля, например, за счет интенсифицированной инсулинотерапии, могут также изменяться привычные симптомы-предвестники гипогликемии, о чем пациенты должны быть предупреждены.

При сопутствующих заболеваниях, особенно при инфекциях и лихорадочных состояниях, потребность пациентов в инсулине обычно возрастает.

Если пациента переводят с одного вида инсулина на другой, то ранние симптомы- предвестники гипогликемии могут изменяться или становиться менее выраженными, чем те, которые отмечались при введении предшествующего инсулина.

Перевод пациентов на другой тип инсулина или на инсулин другой компании-изготовителя должен осуществляться только под медицинским контролем. При изменении биологической активности, смене компании-изготовителя, типа, вида (животный, человеческий, аналог человеческого инсулина) и/или метода изготовления может потребоваться изменение режима дозирования.

Если необходима корректировка дозы, это можно сделать уже при введении первой дозы или в первые недели или месяцы терапии.

Пропуск приема пищи или незапланированная тяжелая физическая нагрузка могут вызывать гипогликемию.

Если пациенту предстоит путешествие с пересечением часовых поясов, то ему следует проконсультироваться с врачом, поскольку ему придется изменить время введения инсулина и приема пищи.

При добавлении препарата Актрапид НМ в растворы для инфузий, количество инсулина, абсорбируемого инфузионной системой, непредсказуемо, поэтому использование Актрапид НМ в ППИИ не разрешается.

В состав препарата Актрапид НМ входит метакрезол, который может вызывать аллергические реакции.

Влияние на способность управлять автомобилем и работать с механизмами

Способность пациентов к концентрации внимания и скорость реакции могут нарушаться во время гипогликемии и гипергликемии, что может представлять опасность в тех ситуациях, когда эти способности особенно необходимы (например, при управлении автомобилем или работе с машинами и механизмами). Пациентам необходимо рекомендовать предпринимать меры для предупреждения развития гипогликемии и гипергликемии при вождении автомобиля и работе с механизмами. Это особенно важно для пациентов с отсутствием или снижением выраженности симптомов-предвестников развивающейся гипогликемии или страдающих частыми эпизодами гипогликемии. В этих случаях следует рассмотреть целесообразность управления автомобилем.

Доклинические данные по безопасности

В ходе доклинических исследований, включавших исследования токсичности при повторном введении дозы, исследования генотоксичности, канцерогенного потенциала и токсического воздействия на репродуктивную сферу, специфического риска для человека выявлено не было.

При нарушениях функции почек

При **поражении почек** потребность в инсулине снижается.

При нарушениях функции печени

При **поражении печени** потребность в инсулине снижается.

Условия хранения:

Хранить в холодильнике при температуре от 2°С до 8°С (не слишком близко к морозильной камере) в картонной пачке. Не замораживать. Препарат следует защищать от воздействия тепла и солнечного света. Хранить в недоступном для детей месте. Срок годности - 30 месяцев. Не использовать по истечении срока годности.

Для вскрытого флакона: хранить при температуре не выше 25°С в течение 6 недель. Не рекомендуется хранить в холодильнике. Хранить флакон в картонной пачке для зашиты от света.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Aktrapid_Nm