Глемаз



Код АТХ:

- A10BB12

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Глимепирид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки светло-зеленого цвета, плоские, прямоугольные, с 3 параллельными насечками на всех сторонах по ширине таблетки, которые делят ее на 4 равные части.

	1 таб.
глимепирид	4 мг

Вспомогательные вещества: кроскармеллоза натрия, целлюлоза, магния стеарат, краситель хинолиновый желтый, краситель бриллиантовый голубой, целлюлоза микрокристаллическая.

5 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральный гипогликемический препарат - производное сульфонилмочевины III поколения.

Глимепирид стимулирует секрецию и высвобождение инсулина из β-клеток поджелудочной железы (панкреатическое действие), улучшает чувствительность периферических тканей (мышечной и жировой) к действию собственного инсулина (внепанкреатическое действие).

Панкреатическое действие (высвобождение инсулина)

Производные сульфонилмочевины регулируют секрецию инсулина путем блокады АТФ-зависимых калиевых каналов,

расположенных в цитоплазматической мембране β-клеток поджелудочной железы. Блокируя калиевые каналы, они вызывают деполяризацию β-клеток, что способствует открытию кальциевых каналов и увеличению поступления кальция внутрь клеток. Глимепирид с высокой замещающей скоростью соединяется и отсоединяется от белка β-клеток поджелудочной железы (белок SURX с молекулярной массой 65 кДа), который ассоциируется с АТФ-зависимыми калиевыми каналами, но отличается от обычного места связывания других производных сульфонилмочевины (белок SUR1c молекулярной массой 140 кДа). Указанный процесс приводит к высвобождению инсулина путем экзоцитоза, при этом количество секретируемого инсулина значительно меньше, чем при действии других производных сульфонилмочевины. Наименьшее стимулирующее влияние глимепирида на секрецию инсулина обеспечивает и меньший риск развития гипогликемии.

Экстрапанкреатическая активность

Кроме того, были показаны выраженные экстрапанкреатические эффекты глимепирида (уменьшение инсулинорезистентности, меньшее воздействие на сердечно-сосудистую систему, антиатерогенное, антиагрегантное и антиоксидантное действие), которыми также обладают и другие производные сульфонилмочевины, но в значительно меньшей степени. Усиление утилизации глюкозы из крови периферическими тканями (мышечной и жировой) происходит с помощью специальных транспортных белков (GLUT1 и GLUT4), расположенных в клеточных мембранах. Транспорт глюкозы в эти ткани при сахарном диабете 2 типа является ограниченным по скорости этапом утилизации глюкозы. Глимепирид очень быстро увеличивает количество и активность молекул, транспортирующих глюкозу (GLUT1 и GLUT4), что приводит к увеличению усвоения глюкозы периферическими тканями.

Глимепирид оказывает более слабое ингибирующее влияние на АТФ-зависимые калиевые каналы кардиомиоцитов. При приеме глимепирида сохраняется способность метаболической адаптации миокарда к ишемии.

Глимепирид увеличивает активность гликозил-фосфатидилинозитол-специфической фосфолипазы С, с которой в изолированных мышечных и жировых клетках могут коррелировать вызываемые препаратом липогенез и гликогенез. Глимепирид ингибирует продукцию глюкозы в печени путем увеличения внутриклеточных концентраций фруктозо-1,6-бисфосфата, который в свою очередь ингибирует глюконеогенез.

Глимепирид избирательно ингибирует циклооксигеназу и снижает превращение арахидоновой кислоты в тромбоксан А2, который способствует агрегации тромбоцитов, таким образом оказывая антитромботическое действие. Глимепирид способствует нормализации содержания липидов, снижает уровень малонового альдегида в крови, что ведет к значительному снижению перекисного окисления липидов, это способствует антиатерогенному действию препарата.

Глимепирид повышает концентрацию эндогенного альфа-токоферола, активность каталазы, глутатионпероксидазы и супероксиддисмутазы, что способствует снижению выраженности окислительного стресса в организме больного, который постоянно присутствует при сахарном диабете 2 типа.

Фармакокинетика

Всасывание

При многократном приеме глимепирида в суточной дозе 4 мг C_{max} достигается примерно через 2.5 ч и составляет 352 нг/мл; существует линейное соотношение между дозой и C_{max}, а также между дозой и AUC. При приеме внутрь глимепирида его биодоступность составляет 100%. Прием пищи не оказывает существенного влияния на всасывание, за исключением незначительного замедления скорости абсорбции.

Распределение

Для глимепирида характерен очень низкий V_d (около 9 л), приблизительно равный объему распределения альбумина, высокая степень связывания с белками плазмы (более 99%) и низкий клиренс (около 48 мл/мин).

Глимепирид выделяется с грудным молоком и проникает через плацентарный барьер. Препарат плохо проникает через ГЭБ.

Выведение

После однократного приема внутрь почками выводится 60% принятой дозы глимеприда и через кишечник – 40%. Неизмененное вещество в моче не обнаруживалось. $T_{1/2}$ при плазменных концентрациях препарата в сыворотке, соответствующих многократному режиму дозирования, составляет 5-8 ч. После приема в высоких дозах $T_{1/2}$ несколько увеличивается.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с нарушениями функции почек (с низким КК) наблюдается тенденция к увеличению клиренса глимепирида и к снижению его средних концентраций в сыворотке крови, что по всей вероятности, обусловлено более быстрым выведением препарата вследствие более низкого связывания его с белками плазмы. Таким образом, у данной категории пациентов не имеется дополнительного риска кумуляции препарата.

Показания к применению:

— сахарный диабет 2 типа (в качестве монотерапии или в составе комбинированной терапии с метформином или с инсулином).

Относится к болезням:

- Инсулинома
- Инсульт
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа;

— диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома и кома;

— состояния, сопровождающиеся нарушением всасывания пищи и развитием гипогликемии (в т.ч. инфекционные заболевания);

— лейкопения;

— тяжелые нарушения функции печени;

— тяжелые нарушения функции почек (в т.ч. больные, находящиеся на гемодиализе);

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим производным сульфонилмочевины и сульфаниламидным препаратам.

С *осторожностью* следует назначать препарат при состояниях, требующих перевода больного на инсулинотерапию (обширные ожоги, тяжелые множественные травмы, большие хирургические вмешательства, а также нарушения всасывания пищи и лекарственных средств в ЖКТ, в т.ч. кишечная непроходимость, парез желудка).

Способ применения и дозы:

Препарат применяют внутрь. Начальную и поддерживающую дозы глимепирида устанавливают индивидуально на основании результатов регулярного контроля концентрации глюкозы в крови.

Начальная доза и подбор дозы

В начале лечения Глемаз назначают в дозе 1 мг 1 раз/сут. При достижении оптимального терапевтического эффекта рекомендуется принимать эту дозу в качестве поддерживающей.

В случае отсутствия гликемического контроля, суточная доза должна быть поэтапно увеличена под регулярным контролем концентрации глюкозы в крови (с интервалами в 1-2 недели) до 2 мг, 3 мг или 4 мг/сут. Дозы свыше 4 мг/сут эффективны только в исключительных случаях. Максимальная рекомендованная суточная доза - 8 мг.

Время и кратность приема суточной дозы определяется врачом с учетом образа жизни больного. Суточную дозу назначают в один прием непосредственно перед или во время плотного завтрака, или первого основного приема пищи. Таблетки глимепирида принимают целиком, не разжевывая, с достаточным количеством жидкости (около 0.5 стакана). Не рекомендуется пропускать прием пищи после приема глимепирида.

Продолжительность лечения

Лечение глимепиридом длительное, под контролем содержания глюкозы в крови.

Применение в комбинации с метформином

В случае отсутствия гликемического контроля у больных, принимающих метформин, может быть начата сопутствующая терапия глимепиридом. При сохранении дозы метформина на прежнем уровне лечение глимепиридом начинается с минимальной дозы, а затем доза постепенно увеличивается в зависимости от желаемой концентрации глюкозы в крови, вплоть до максимальной суточной дозы. Комбинированную терапию следует проводить под тщательным медицинским наблюдением.

Применение в комбинации с инсулином

В случаях, когда не удается достигнуть гликемического контроля при приеме препарата Глемаз в максимальной дозе при монотерапии или в комбинации с максимальной дозой метформина, возможна комбинация глимепирида с инсулином. В этом случае последняя, назначенная больному доза глимепирида, остается неизменной. При этом лечение инсулином начинается с минимальной дозы, с возможным последующим постепенным увеличением его дозы под контролем концентрации глюкозы в крови. Комбинированное лечение требует обязательного врачебного контроля.

Перевод больного с другого перорального гипогликемического препарата на глимепирид

При переводе больного с другого перорального гипогликемического препарата на глимепирид начальная суточная доза последнего должна составлять 1 мг (даже в том случае, если больного переводят на глимепирид с максимальной дозы другого перорального гипогликемического препарата). Любое повышение дозы глимепирида следует проводить поэтапно в соответствии с приведенными выше рекомендациями. Необходимо принимать во внимание эффективность, дозу и продолжительность действия используемого гипогликемического средства. В некоторых случаях, особенно при приеме гипогликемических препаратов с большим периодом полувыведения может возникнуть необходимость во временном (в течение нескольких дней) прекращении лечения во избежание аддитивного эффекта, повышающего риск развития гипогликемии.

Перевод больного с инсулина на глимепирид

В исключительных случаях, при проведении инсулинотерапии у больных сахарным диабетом 2 типа, при компенсации заболевания и при сохранной секреторной функции β-клеток поджелудочной железы, возможна замена инсулина глимепиридом. Перевод должен проводиться под тщательным наблюдением врача. При этом перевод больного на глимепирид начинают с минимальной дозы в 1 мг.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: возможно развитие гипогликемических реакций. Эти реакции, главным образом, возникают вскоре после приема препарата, могут иметь тяжелую форму и течение и их не всегда удается легко купировать. Наступление этих симптомов зависит от индивидуальных факторов, таких как особенности питания и дозирование.

Со стороны органа зрения: во время лечения (особенно в начале терапии) могут наблюдаться транзиторные нарушения зрения, обусловленные изменением концентрации глюкозы в крови.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, ощущение тяжести или дискомфорта в эпигастрии, боль в животе, диарея (очень редко приводящие к прекращению лечения), повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз, желтуха, гепатит (вплоть до развития печеночной недостаточности).

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (от умеренной до тяжелой), лейкопения, гемолитическая или апластическая анемия, эритроцитопения, гранулоцитопения, агранулоцитоз и панцитопения.

Аллергические реакции: возможно появление крапивницы, кожной сыпи, зуда. Такие реакции бывают, как правило, умеренно выраженными, но могут прогрессировать, сопровождаясь снижением АД, одышкой, вплоть до развития анафилактического шока. Возможна перекрестная аллергия с другими производными сульфонилмочевины, сульфаниламидами или подобными им веществами, также возможно развитие аллергического васкулита.

Прочие: в единичных случаях - головная боль, астения, гипонатриемия, фотосенсибилизация, поздняя кожная порфирия.

Передозировка:

После приема внутрь глимепирида в высокой дозе возможно развитие гипогликемии продолжительностью от 12 до 72 ч, которая может повториться после первоначального восстановления концентрации глюкозы в крови. В большинстве случаев рекомендуется наблюдение в условиях стационара.

Симптомы гипогликемии: усиление потоотделения, чувство тревоги, тахикардия, повышение АД, ощущение сердцебиения, боль в области сердца, аритмия, головная боль, головокружение, резкое повышение аппетита, тошнота, рвота, апатия, сонливость, беспокойство, агрессивность, нарушение концентрации внимания, депрессия, спутанность сознания, тремор, парезы, нарушение чувствительности, судороги центрального генеза. Иногда клиническая картина гипогликемии может напоминать инсульт. Возможно развитие комы.

Лечение: индукция рвоты, обильное питье с активированным углем (адсорбентом) и натрия пикосульфатом (слабительным). При приеме большого количества препарата показано промывание желудка, с последующим введением натрия пикосульфата и активированного угля. Как можно скорее начинают введение декстрозы, при необходимости в виде в/в струйного введения 50 мл 40% раствора, с последующим инфузионным введением 10% раствора, с тщательным мониторированием концентрации глюкозы в крови. В дальнейшем лечение должно быть

симптоматическим.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Глемаз противопоказан к применению при беременности. В случае планируемой беременности или при наступлении беременности рекомендуется проведение инсулинотерапии.

Т.к. глимепирид выделяется с грудным молоком, Глемаз не следует назначать в период лактации (грудного вскармливания). Рекомендуется проведение инсулинотерапии или прекращение грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение глимепирида с некоторыми лекарственными препаратами может вызвать как усиление, так и ослабление гипогликемического действия препарата. Поэтому другие лекарственные препараты можно принимать только после согласования с врачом.

Усиление гипогликемического действия и связанное с этим возможное развитие гипогликемии может наблюдаться при одновременном применении глимепирида с инсулином, метформином или другими пероральными гипогликемическими препаратами, ингибиторами АПФ, аллопуринолом, анаболическими стероидами и мужскими половыми гормонами, хлорамфениколом, производными кумарина, циклофосфамидом, трофосфамидом и ифосфамидом, фенфлурамином, фибратами, флуоксетином, симпатолитиками (гуанетидином), ингибиторами МАО, миконазолом, пентоксифиллином (при парентеральном введении в высоких дозах), фенилбутазоном, азапропазоном, оксифенбутазоном, пробенецидом, противомикробными средствами - производными хинолона, салицилатами (в т.ч. аминосалициловой кислотой), сульфинпиразоном, некоторыми сульфаниламидами пролонгированного действия, тетрациклинами, тритоквалином, флуконазолом.

Ослабление гипогликемического действия и связанное с этим повышение концентрации глюкозы в крови может наблюдаться при одновременном применении глимепирида с ацетазоламидом, барбитуратами, ГКС, диазоксидом, салуретиками, тиазидными диуретиками, эпинефрином и другими симпатомиметическими средствами, глюкагоном, слабительными средствами (при длительном применении), никотиновой кислотой (в высоких дозах) и производными никотиновой кислоты, эстрогенами и прогестагенами, производными фенотиазина, в т.ч. хлорпромазином, фенитоином, рифампицином, гормонами щитовидной железы, солями лития.

Блокаторы гистаминовых H_2-рецепторов, клонидин и резерпин способны как потенцировать, так и ослаблять гипогликемическое действие глимепирида.

Под действием бета-адреноблокаторов, клонидина, гуанетидина и резерпина, возможно ослабление или отсутствие клинических признаков гипогликемии.

На фоне приема глимепирида может наблюдаться усиление или ослабление действия производных кумарина.

При одновременном применении с лекарственными средствами, угнетающими костномозговое кроветворение, увеличивается риск миелосупрессии.

Однократное или хроническое употребление алкоголя может как усиливать, так и ослаблять гипогликемическое действие глимепирида.

Особые указания и меры предосторожности:

Глимепирид следует принимать в рекомендуемых дозах и в назначенное время. Ошибки в применении препарата, например, пропуск приема, никогда нельзя устранять посредством последующего приема более высокой дозы. Врач и больной должны заранее обговорить меры, которые следует принимать в случае таких ошибок (например, пропуск приема препарата или приема пищи) или в ситуациях, когда невозможен прием очередной дозы препарата в установленное время. Больной должен немедленно информировать врача в случае приема слишком высокой дозы препарата.

Развитие гипогликемии у пациента после приема глимепирида в дозе 1 мг/сут означает возможность контроля гликемии исключительно при помощи диеты.

При достижении компенсации сахарного диабета 2 типа повышается чувствительность к инсулину. В связи с этим в процессе лечения может снизиться потребность в глимепириде. Во избежание развития гипогликемии необходимо временно уменьшить дозу или отменить глимепирид. Коррекцию дозы следует проводиться также при изменении массы тела больного, его образа жизни, или при появлении других факторов, способствующих повышению риска развития гипо- или гипергликемии.

В первые недели лечения может повыситься риск развития гипогликемии, что требует особо тщательного наблюдения за больным. На фоне лечения глимепиридом при нерегулярном приеме пищи или пропуске приема пищи

может развиться гипогликемия.

Симптомы гипогликемии могут быть сглажены или совсем отсутствовать у пожилых, у больных с вегетативной невропатией или получающих одновременное лечение бета-адреноблокаторами, клонидином, резерпином, гуанетидином. Гипогликемия почти всегда может быть быстро купирована немедленным приемом углеводов (глюкозы или сахара, например, в виде кусочка сахара, сладкого фруктового сока или чая). В связи с этим больной должен всегда иметь при себе не менее 20 г глюкозы (4 кусочка сахара). Сахарозаменители неэффективны в лечении гипогликемии.

Во время лечения глимепиридом требуется проведение регулярного контроля функции печени и картины периферической крови (особенно количества лейкоцитов и тромбоцитов).

В стрессовых ситуациях (например, при травме, хирургическом вмешательстве, инфекционных заболеваниях, сопровождающихся лихорадкой) может возникнуть необходимость во временном переводе больного на инсулинотерапию.

Отсутствует опыт применения глимепирида у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени и почек или пациентов, находящихся на гемодиализе. Пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек и печени показан перевод на инсулинотерапию.

Во время лечения глимепиридом необходим регулярный контроль концентрации глюкозы в крови, а также концентрации гликозилированного гемоглобина.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При приеме глимепирида возможно развитие гипогликемии или гипергликемии, таким образом, следует соблюдать осторожность при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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