Глибенез Ретард



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Глипизид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки с контролируемым высвобождением, покрытые оболочкой белого цвета, двояковыпуклые, с надписью "GXL 5".

	1 таб.
глипизид	5 мг

Вспомогательные вещества: полиэтиленоксид, гидроксипропилметилцеллюлоза, железа оксид красный, магния стеарат, натрия хлорид, целлюлозы ацетат, полиэтиленгликоль, Opadry белый.

30 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.

Таблетки с контролируемым высвобождением, покрытые оболочкой белого цвета, двояковыпуклые, с надписью "GXL 10".

	1 таб.
глипизид	10 мг

Вспомогательные вещества: полиэтиленоксид, гидроксипропилметилцеллюлоза, железа оксид красный, магния стеарат, натрия хлорид, целлюлозы ацетат, полиэтиленгликоль, Opadry белый.

30 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемический препарат, производное сульфонилмочевины.

Снижает уровень глюкозы в крови путем стимуляции секреции инсулина поджелудочной железой; этот эффект зависит от числа функционирующих β-клеток в островках Лангерганса поджелудочной железы. Важное значение имеет стимуляция секреции инсулина глипизидом в ответ на прием пищи. Под влиянием препарата инсулинотропный эффект в ответ на прием пищи у больных сахарным диабетом усиливается. Повышенное высвобождение инсулина и С-пептида в ответ на прием пищи сохраняется в течение по крайней мере 6 месяцев после лечения. Снижение уровня

HbA_{1c} и уровня глюкозы в крови натощак сопоставимо у больных более молодого и пожилого возраста.

Глибенез ретард не оказывает влияния на плазменный профиль липопротеидов у больных сахарным диабетом типа 2, что полностью коррелирует со снижением уровня глюкозы натощак.

Фармакокинетика

Всасывание

Через 2-3 ч после приема препарата концентрация глипизида в плазме крови начинает постепенно возрастать и C_{max} достигается через 6-12 ч.

При последующем применении препарата 1 раз/сут эффективная концентрация глипизида в плазме поддерживается на протяжении 24 ч; уровень ее колебаний от минимальных до максимальных значений в плазме крови меньше, чем при применении таблеток глипизида с обычной скоростью высвобождения 2 раза/сут.

Средняя относительная биодоступность глипизида после приема внутрь таблеток с контролируемым высвобождением в дозе 20 мг по сравнению с обычными таблетками глипизида (10 мг 2 раза/сут) в равновесном состоянии составляет 81±22%. Длительное применение препарата не приводит к кумуляции глипизида. Прием во время еды не оказывает влияния на время всасывания. При однократном приеме препарата непосредственно перед завтраком с обильным содержанием жиров отмечается значимое увеличение среднего значения C_{max} глипизида (на 40%), при этом AUC меняется несущественно.

Распределение

C_{ss} в плазме крови достигается на 5-й день применения препарата. При многократном применении препарата фармакокинетика носит линейный характер в диапазоне доз от 5 до 60 мг, при этом концентрация в плазме крови повышается пропорционально дозе. Однократный прием внутрь 4 таб. Глибенез ретард по 5 мг, 2 таб. по 10 мг и 1 таб. по 20 мг является биоэквивалентным.

Глипизид на 98-99% связывается с белками сыворотки крови, в основном с альбумином.

Метаболизм и выведение

Биотрансформируется в печени. Менее 10% дозы выводится в неизмененном виде с мочой и калом; примерно 90% дозы выводится в виде метаболитов с мочой (80%) и калом (10%).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Для достижения C_{ss} у больных в возрасте старше 65 лет требуется на 1-2 дня больше.

Клиренс глипизида из плазмы может увеличиваться у пациентов с заболеванием печени.

Показания к применению:

— сахарный диабет типа 2 (инсулиннезависимый) при неэффективности адекватной диетотерапии.

Относится к болезням:

- Инсульт
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— сахарный диабет типа 1 (инсулинзависимый);

— диабетический кетоацидоз;

— диабетическая кома и прекома;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к глипизиду или любому другому компоненту препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при выраженном стенозировании какого-либо отдела ЖКТ (патологическом или ятрогенном), при почечной или печеночной недостаточности, при лихорадке, травме, инфекционных заболеваниях, хирургических вмешательствах и прочих состояниях, при которых возможна потеря

контроля над уровнем глюкозы в крови (может потребоваться отмена препарата и назначение инсулина).

Способ применения и дозы:

Дозу препарата следует подбирать индивидуально. Таблетки следует принимать внутрь целиком, запивая достаточным количеством жидкости. Таблетки нельзя разжевывать, делить на части или разламывать.

Начальная доза составляет 5 мг/сут во время завтрака. При необходимости дозу препарата повышают с учетом уровня глюкозы в крови на 5 мг с интервалом, по крайней мере, в несколько дней. Эффективный контроль над уровнем глюкозы в крови обеспечивается при применении препарата 1 раз/сут. Максимальная доза составляет 20 мг/сут.

Пациентов, получающих глипизид в виде таблеток с обычной скоростью высвобождения в дозе от 5 до 20 мг/сут, можно перевести на прием Глибенез ретард 1 раз/сут в эквивалентной общей суточной дозе или ниже таковой.

Во избежание гипогликемических реакций у больных группы риска, включая **пожилых** пациентов, ослабленных и истощенных больных, а также у пациентов, нерегулярно принимающих пищу, и у больных с **нарушением функции почек или печени** поддерживающие дозы должны быть более умеренными по сравнению с рекомендованными выше.

Больных со стабильным течением сахарного диабета типа 2 можно перевести с *инсулина* на прием Глибенеза ретард, при этом следует соблюдать следующие рекомендации.

Если потребность в инсулине не превышает 20 МЕ/сут, его можно отменить и назначить Глибенез ретард в обычных дозах.

Если потребность в инсулине превышает 20 МЕ/сут, дозу инсулина следует снизить на 50% и назначить Глибенез ретард в обычных дозах. Возможность последующего снижения дозы инсулина зависит от индивидуальной реакции больного на лечение. В обоих случаях повышать дозу препарата Глибенез ретард следует с интервалом в несколько дней.

В течение периода отмены инсулина больным необходимо самостоятельно контролировать уровень глюкозы в крови и немедленно обратиться к врачу при наличии каких-либо отклонений этих показателей от нормы. В некоторых случаях, особенно когда пациент получает более 40 МЕ инсулина/сут, на время его перевода на терапию таблетированными гипогликемическими препаратами желательна госпитализация.

При переводе больных с приема *другого препарата группы сульфонилмочевины* на Глибенез ретард необходимо тщательное наблюдение в течение по крайней мере 2 недель с целью выявления гипогликемии (путем контроля симптомов или уровня глюкозы крови). При переводе больных на Глибенез ретард рекомендуется назначать его в умеренной дозе.

При назначении *комбинированной терапии* в случае добавления к Глибенезу ретард другого гипогликемического препарата его следует назначать в более низких дозах и под контролем уровня глюкозы в крови; при добавлении Глибенеза ретард к другому гипогликемическому препарату, можно начать применение Глибенеза ретард с дозы 5 мг.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, гемолитическая анемия, апластическая анемия, панцитопения.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (может быть тяжелой, длительной и в некоторых случаях может привести к коме), гипонатриемия, возможны дисульфирамоподобные реакции, повышение уровня остаточного азота, мочевины и креатинина (связь этих изменений с приемом Глибенез ретард не установлена).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: спутанность сознания, головная боль, тремор, затуманенность и ухудшение зрения (эти симптомы обычно являются преходящими, не требуют отмены препарата и могут быть проявлением симптомов гипогликемии).

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, тошнота, рвота, запор или диарея, дискомфорт в эпигастральной области, метеоризм, холестатическая желтуха, токсический гепатит, печеночная порфирия, незначительное или умеренное повышение активности печеночных трансаминаз, ЩФ.

Аллергические реакции: сыпь, зуд, крапивница, макуло-папулезная сыпь.

Прочие: недомогание.

При применении производных сульфонилмочевины могут также наблюдаться многоформная эритема, фотосенсибилизация, поздняя кожная (симптоматическая) порфирия, эозинофилия, полиурия и дизурия.

Передозировка:

Данных о передозировке препарата Глибенез ретард нет.

Симптомы. При передозировке производных сульфонилмочевины, включая глипизид, может наблюдаться гипогликемия. Возможны тяжелые гипогликемические реакции, сопровождающиеся комой, судорогами или другими неврологическими нарушениями.

Лечение. При легких проявлениях гипогликемии без потери сознания или неврологических симптомов необходимо назначить глюкозу внутрь и скорректировать дозу препарата и/или характер принимаемой пищи. Тщательное наблюдение за пациентом следует продолжать до тех пор, пока не будет уверенности в том, что пациент находится вне опасности. Тяжелые гипогликемические реакции, хотя они возникают нечасто, требуют экстренной медицинской помощи и немедленной госпитализации. Если диагностирована или подозревается гипогликемическая кома, больному следует быстро ввести в/в концентрированный (50%) раствор декстрозы (глюкозы) с последующей инфузией 10% раствора декстрозы со скоростью, обеспечивающей поддержание уровня глюкозы в крови более 100 мг/дл. Больных следует тщательно наблюдать в течение не менее 24-48 ч, т.к. гипогликемия может возобновиться после исчезновения ее клинических признаков. Учитывая активное связывание глипизида с белками, диализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат можно назначать при беременности только в случае, когда ожидаемая польза превосходит возможный риск для плода, при этом препарат следует отменить по крайней мере за месяц до ожидаемых родов и назначить другую терапию для поддержания уровня глюкозы в крови как можно ближе к нормальному значению.

Неизвестно, выводится ли глипизид с грудным молоком. Однако, учитывая, что некоторые производные сульфонилмочевины поступают в грудное молоко (что обусловливает возможный риск развития гипогликемии у новорожденных, находящихся на грудном вскармливании) необходимо решить, следует ли прекратить кормление грудью или отменить препарат, принимая во внимание его значение для матери. Если препарат отменяют, а диетотерапия не позволяет обеспечить адекватный контроль уровня глюкозы в крови, следует назначить терапию инсулином.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с миконазолом отмечается усиление гипогликемического эффекта Глибенеза ретард, которое может привести к появлению симптомов гипогликемии и даже коме.

При одновременном применении Глибенеза ретард с флуконазолом возможно развитие гипогликемии вследствие увеличения периода полувыведения глипизида.

При одновременном применении Глибенеза ретард с НПВС (в т.ч. фенилбутазоном) наблюдается повышение гипогликемического эффекта глипизида за счет вытеснения его из связи с белками плазмы и/или снижения его выведения.

При одновременном приеме высоких доз ацетилсалициловой кислоты гипогликемический эффект Глибенеза ретард усиливается (гипогликемическое действие ацетилсалициловой кислоты).

При одновременном применении с Глибенезом ретард все бета-адреноблокаторы маскируют некоторые симптомы гипогликемии, например, сердцебиение и тахикардию. Большинство некардиоселективных бета-адреноблокаторов повышают частоту и тяжесть гипогликемии.

На фоне одновременного приема ингибиторов АПФ может наблюдаться усиление гипогликемического эффекта Глибенеза ретард, вследствие чего может потребоваться снижение его дозы.

Одновременное применение блокаторов гистаминовых H_2-рецепторов (например, циметидина) может потенцировать гипогликемический эффект глипизида.

Гипогликемическое действие Глибенеза ретард может усиливаться при одновременном приеме с ингибиторами МАО и препаратами, характеризующимися высокой степенью связывания с белками плазмы (в т.ч сульфониламиды, хлорамфеникол, пробенецид и кумарины). При назначении или отмене последних на фоне приема Глибенеза ретард следует тщательно контролировать уровень глюкозы в крови.

При одновременном применении Глибенеза ретард с этанолом наблюдается усиление гипогликемического действия, которое может привести к гипогликемической коме.

При одновременном применении Глибенеза ретард с фенотиазинами (в т.ч. хлорпромазином) в высоких дозах (более

100 мг/сут) наблюдается повышение уровня глюкозы в крови (уменьшение высвобождения инсулина).

При одновременном применении Глибенеза ретард с ГКС повышается уровень глюкозы в крови.

При одновременном применении Глибенеза ретард с симпатомиметиками (в т.ч. ритодрином, сальбутамолом, тербуталином) наблюдается повышение уровня глюкозы в крови вследствие стимуляции β_2-адренорецепторов.

При одновременном применении Глибенеза ретард с тиазидными и другими диуретиками, гормонами щитовидной железы, эстрогенами, гестагенами, пероральными контрацептивами, фенитоином, никотиновой кислотой, блокаторами кальциевых каналов, изониазидом может наблюдаться гипергликемия.

Особые указания и меры предосторожности:

На фоне приема препарата может развиться тяжелая гипогликемия, которая может привести к коме и потребовать госпитализации. При развитии тяжелой гипогликемии больным проводят адекватную терапию глюкозой и наблюдают в течение не менее 24-48 ч.

Для предупреждения гипогликемии важное значение имеют правильный подбор дозы, инструктирование пациентов, а также регулярный и своевременный прием углеводов (в т.ч. во время завтрака) в случае задержки приема пищи, при недостаточном ее потреблении или несбалансированном приеме углеводов.

Почечная или печеночная недостаточность могут повлиять на распределение глипизида, а также снизить активность глюконеогенеза. Оба эти эффекта повышают риск серьезных гипогликемических реакций. Пожилые, ослабленные и истощенные больные, а также пациенты с заболеваниями щитовидной железы (гипотиреоз или гипертиреоз), с надпочечниковой или гипофизарной недостаточностью особенно чувствительны к гипогликемическому действию препаратов данной группы. Гипогликемию бывает трудно распознать у пожилых людей и пациентов, принимающих бета-адреноблокаторы. Риск гипогликемии повышается при недостаточной калорийности пищи, после тяжелой или длительной физической нагрузки, при приеме алкоголя или при применении более одного гипогликемического препарата. Поэтому при подобных состояниях может потребоваться более частый контроль уровня глюкозы в крови и коррекция дозы препарата.

В период приема препарата необходимо регулярно контролировать уровень глюкозы в крови. В соответствии со стандартными подходами к терапии следует определять и уровень гликозилированного гемоглобина.

Когда пациент с сахарным диабетом, компенсированным на фоне терапии гипогликемическими препаратами, подвергается воздействию стресса (лихорадка, травма, инфекция или хирургическое вмешательство), то контроль над уровнем глюкозы в крови может быть утрачен. В таких случаях может потребоваться отмена препарата Глибенез ретард и назначение инсулина.

Со временем у многих пациентов эффективность любого перорального гипогликемического препарата (в т.ч. и Глибенеза ретард) снижается, что может быть результатом прогрессирования сахарного диабета или снижения чувствительности к лекарственному средству. Этот феномен называют вторичной резистентностью, которую следует отличать от первичной резистентности, когда препарат у конкретного пациента с самого начала не дает эффекта. Прежде чем диагностировать вторичную резистентность, необходимо оценить правильность подбора дозы и строгость соблюдения диеты.

Если у пациентов с нарушением функции почек или печени развивается гипогликемия, то она может оказаться длительной и потребовать адекватного лечения.

В случае развития холестатической желтухи следует прекратить лечение препаратом.

Значительное сокращение времени удерживания препарата в ЖКТ может повлиять на фармакокинетический профиль и, соответственно, на клиническую эффективность препарата. Поэтому необходимо соблюдать осторожность при назначении Глибенеза ретард пациентам с выраженным стенозированием какого-либо отдела ЖКТ в анамнезе (патологического или ятрогенного).

Пациенты и их родственники должны быть проинформированы о причинах развития гипогликемии, о риске, симптомах и лечении этого заболевания, а также о первичной и вторичной резистентности к препарату.

В препарате Глибенез ретард активный ингредиент окружен нерастворимой оболочкой, которая специально предназначена для медленного высвобождения и всасывания препарата в организме. После завершения этого процесса пустая оболочка таблетки выводится из организма. Пациентов не должен беспокоить тот факт, что они могут обнаружить в кале остатки оболочки в форме таблетки.

Пациентов следует информировать о возможном риске и преимуществах лечения с применением данного препарата, об альтернативных методах терапии, а также о важности соблюдения диеты, программы регулярных физических упражнений и регулярного определения уровня глюкозы в крови.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у детей не изучались.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Влияние препарата на способность к вождению автомобиля и работе с механизмами не изучалось. Однако больные должны знать симптомы гипогликемии и соблюдать осторожность при вождении автомобиля и работе с механизмами.

При нарушениях функции почек

Во избежание гипогликемических реакций у больных с **нарушением функции почек** поддерживающие дозы должны быть более умеренными по сравнению с рекомендованными выше.

При нарушениях функции печени

Во избежание гипогликемических реакций у больных с **нарушением функции печени** поддерживающие дозы должны быть более умеренными по сравнению с рекомендованными выше.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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