Глимепирид



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 белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
глимепирид	2 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, натрия лаурилсульфат, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
глимепирид	3 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, натрия лаурилсульфат, магния стеарат, краситель солнечный закат желтый (Е110), краситель хинолиновый желтый водорастворимый (Е104).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемический препарат для перорального применения - производное сульфонилмочевины III поколения.

Глимепирид действует, главным образом, стимулируя секрецию и высвобождение инсулина из β-клеток поджелудочной железы (*панкреатическое действие*). Как и у других производных сульфонилмочевины, в основе этого эффекта лежит увеличение реакции β-клеток поджелудочной железы на физиологическую стимуляцию глюкозой, при этом количество секретируемого инсулина значительно меньше, чем при действии традиционных препаратов - производных сульфонилмочевины. Наименьшее стимулирующее влияние глимепирида на секрецию инсулина обеспечивает и меньший риск развития гипогликемии. В дополнение к этому, глимепирид обладает *внепанкреатическим действием* - способностью улучшать чувствительность периферических тканей (мышечной, жировой) к действию собственного инсулина, снижать поглощение инсулина печенью; ингибирует продукцию глюкозы в печени. Глимепирид избирательно ингибирует циклооксигеназу и снижает превращение арахидоновой кислоты в тромбоксан A_2, 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 перикисного окисления липидов, это способствует антиатерогенному действию препарата.

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

Фармакокинетика

I Ери многократном приеме глимепирида в суточной дозе 4 мг максимальная концентрация в сыворотке крови (C_{milx}) достигается примерно через 2,5 часа и составляет 309 нг/мл; существует линейное соотношение между дозой и C_{max}, а также между дозой и AUC(площадь иод кривой «концентрация-время»). При приеме внутрь глимепирида его биодоступность составляет 100%. Прием нищи не оказывает существенного влияния на всасывание, за исключением незначительного замедления скорости абсорбции. Для глимепирида характерен очень низкий объем распределения (около 8,8 л), приблизительно равный объему распределения альбумина, высокая степень связывания с белком (более 99%) и низкий клиренс (около 48 мл/мин).

После однократного приема внутрь дозы глимепирида почками выводится 58% и через кишечник - 35%. Неизмененное вещество в моче не обнаруживалось. Период полувыведения при плазменных концентрациях препарата в сыворотке, соответствующих многократному режиму дозирования, составляет 5-8 часов. После приема высоких доз период полувыведения несколько увеличивается.

В моче и фекалиях выявляются два неактивных метаболита, по всей вероятности образующиеся в результате метаболизма в печени, один из них является гидроксипроизводным, а другой - карбоксипроизводным. После приема внутрь глимепирида терминальный период нолувыведения этих метаболитов составляет 3-5 часов и 5-6 часов, соответственно.

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

У пациентов с нарушениями функции почек (с низким клиренсом креатинина) наблюдалась 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 белком. Таким образом, у данной категории пациентов не имеется дополнительного риска кумуляции препарата.

Показания к применению:

— лечение сахарного диабета 2 типа при неэффективности ранее назначенной диеты и физической нагрузки.

При неэффективности монотерапии глимепиридом, возможно его применение в комбинированной терапии с метформином или с инсулином.

Относится к болезням:

- Инсулинома
- Инсульт

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа;

— диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома и кома;

— состояния, сопровождающиеся нарушением всасывания пищи и развитием гипогликемии (инфекционные заболевания);

— лейкопения;

— тяжелые нарушения функции печени;

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

— непереносимость лактозы, лактазная недостаточность, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— беременность;

— лактация;

— детский возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к глимепириду или к какому-либо неактивному компоненту препарата, к другим производным сульфонилмочевины или к сульфаниламидным препаратам (риск развития реакций гиперчувствительности).

С *осторожностью:* состояния, требующие перевода больного на инсулинотерапию (обширные ожоги, тяжелые множественные травмы, большие хирургические вмешательства, а также нарушения всасывания пищи и лекарственных средств в ЖКТ - кишечная непроходимость, парез желудка).

Способ применения и дозы:

Препарат применяется 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 препарат назначают по 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 в сутки. Дозы свыше 4 мг/сут эффективны только в исключительных случаях. Максимальная рекомендованная суточная доза - 6 мг.

Время и кратность приема суточной дозы определяется врачом с учетом образа жизни больного. Суточная доза назначается в 1 прием непосредственно перед или во время плотного завтрака, или первого основного приема пищи.

Таблетки принимают целиком, не разжевывая, с достаточным количеством жидкости (около 0.5 стакана). Не рекомендуется пропускать прием пищи после употребления глимепирида.

Продолжительность лечения

Лечение глимепиридом длительное, под контролем содержания глюкозы в крови и моче.

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 желаемого уровня гликемического контроля, вплоть до максимальной суточной дозы. Комбинированная терапия должна проводиться под тщательным медицинским наблюдением.

Применение в комбинации с инсулином

В случаях, когда не удается достигнуть гликемического контроля приемом максимальной дозы глимепирида в 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 па 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 (например, хлорпропамида) 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: в редких случаях 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 его начале) могут наблюдаться транзиторные нарушения зрения, обусловленные изменением концентрации глюкозы в крови.

Со стороны системы органов пищеварения: иногда могут отмечаться тошнота, рвота, ощущение тяжести или дискомфорта в эпигастрии, боли в животе, диарея, очень редко приводящие к прекращению лечения; в редких случаях - повышение активности печеночных ферментов, холестаз, желтуха, гепатит (вплоть до развития печеночной недостаточности).

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

Аллергические реакции: иногда возможно появление крапивницы (зуд, кожная сыпь). Такие реакции бывают, как правило, умеренно выраженными, но могут прогрессировать, сопровождаясь падением АД, диспноэ, вплоть до развития анафилактического шока. При появлении крапивницы следует немедленно обратиться к врачу. Возможна перекрестная аллергия с другими производными сульфонилмочевины, сульфаниламидами, также возможно развитие аллергического васкулита.

Прочие: в исключительных случаях возможно развитие головных болей, астении, гипонатриемии, фотосенсибилизации, поздней кожной порфирии.

Отдельные побочные действия (тяжелая гипогликемия, серьезные изменения картины крови, тяжелые аллергические реакции, печеночная недостаточность), могут при определенных обстоятельствах представлять собой угрозу для жизни пациента. В случае развития нежелательных или тяжелых реакций больному необходимо сразу же информировать о них лечащего врача и не продолжать прием препарата без его рекомендации.

Передозировка:

После приема внутрь большой дозы глимепирида 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. Могут возникать: усиление потоотделения, чувство тревоги, тахикардия, повышение АД, ощущение сердцебиения, боли 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 включает индукцию 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.

При лечении гипогликемии, развившейся вследствие случайного приема глимепирида грудными или маленькими

детьми, для того, чтобы избежать гипергликемии, следует контролировать дозу декстрозы (50 мл 40% раствора) и непрерывно мониторировать концентрацию глюкозы в крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Глимепирид противопоказан к применению у беременных женщин. В случае планируемой беременности или при наступлении беременности женщину следует перевести на инсулинотерапию.

Т.к. глимепирид, по-видимому, проникает в грудное молоко, то его не следует назначать женщинам в период лактации. В таком случае, необходимо перейти на инсулинотерапию или прекратить кормление грудью.

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, хинолоновыми антибиотиками, салицилатами и 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 ацетазол амидом, 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, фенотиазинами, 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 таких симпатолитических средств, как бета-адреноблокаторы. клонидин, гуанетидин и резерпин, 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 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. Коррекция дозы должна проводиться также при изменении массы тела больного, его образа жизни, или при появлении других факторов, способствующих повышению риска развития гипо- или гипергликемии.

Адекватная диета, регулярные и достаточные физические упражнения и, при необходимости, снижение массы тела

имеют такое же важное значение для достижения оптимального контроля уровня глюкозы в крови, как и регулярный прием глимепирида. Клиническими симптомами гипергликемии являются: увеличение частоты мочеиспусканий, сильная жажда, сухость во рту и сухость кожных покровов.

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. Ее возможными симптомами являются: головная боль, чувство голода, тошнота, рвота, чувство усталости, сонливость, нарушения сна, беспокойство, агрессивность, нарушения концентрации внимания и реакций, депрессия, спутанность сознания, речевые и зрительные расстройства, афазия, тремор, парез, сенсорные нарушения, головокружение, потеря самоконтроля, делирий, церебральные судороги, спутанность или потеря сознания, включая коматозное состояние, поверхностное дыхание, брадикардия. Кроме этого, в результате адренергического механизма обратной связи могут возникать такие симптомы как холодный, липкий пот, беспокойство, тахикардия, повышение АД, стенокардия и нарушения сердечного ритма. К факторам, способствующим развитию гипогликемии, относятся:

— нежелание или (особенно в пожилом возрасте) недостаточная способность больного к сотрудничеству с врачом;

— неполноценное, нерегулярное питание, пропуск приемов пищи, голодание, изменение привычной диеты;

— дисбаланс между физической нагрузкой и потреблением углеводов;

— употребление алкоголя, особенно в сочетании с пропуском приема пищи;

— нарушение функции почек;

— тяжелое нарушение функции печени;

— передозировка глимепирида;

— некоторые некомпенсированные заболевания эндокринной системы, оказывающие влияние на углеводный обмен (например, нарушения функции щитовидной железы, гипофизарная недостаточность или недостаточность коры надпочечников);

— одновременное применение некоторых других лекарственных средств.

Врач должен быть информирован об указанных выше факторах и об эпизодах гипогликемии, поскольку они требуют особо строгого наблюдения за больным. При наличии таких факторов, повышающих риск развития гипогликемии, следует скорректировать дозу глимепирида или всю схему лечения. Это необходимо сделать также в случае интеркуррентного заболевания или изменения образа жизни больного.

Симптомы гипогликемии могут быть сглажены или совсем отсутствовать у пожилых, у больных с вегетативной нейропатией или получающих одновременное лечение бета-адреноблокаторами, клонидином, резерпином, гуанетидином или другими симпатолитическими средствами. 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.

Из опыта применения других препаратов сульфонилмочевины известно, что, несмотря на начальный успех купирования гипогликемии, возможен ее рецидив. В связи с этим, необходимо непрерывное и тщательное наблюдение за больным. Тяжелая гипогликемия требует немедленного лечения под наблюдением врача, а при определенных обстоятельствах и госпитализации больного.

Если больного с сахарным диабетом, лечат разные врачи (например, во время пребывания в больнице после несчастного случая, при заболевании в выходные дни), он должен обязательно сообщить им о своем заболевании и о предшествующем лечении.

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

В начале лечения, при переходе с одного лекарственного средства на другое, или при нерегулярном приеме глимепирида может иметь место, обусловленное гипо- или гипергликемией, снижение концентрации внимания и

скорости психомоторных реакций больного. Это может отрицательно сказаться на способности к управлению автотранспортом или к управлению различными машинами и механизмами.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек (в т.ч. у больных, находящихся на гемодиализе).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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