Глимепирид Канон



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральное гипогликемическое средство, производное сульфонилмочевины. Стимулирует секрецию инсулина β-клетками поджелудочной железы, увеличивает высвобождение инсулина. Повышает чувствительность периферических тканей к инсулину.

Фармакокинетика

При многократном приеме внутрь в 4 мг/сут C_{max} в сыворотке крови достигается примерно через 2.5 ч и составляет 309 нг/мл; существует линейная зависимость между дозой и C_{max}, а также между дозой и AUC. Прием пищи не оказывает значительного влияния на абсорбцию.

V_d около 8.8 л. Связывание с белками плазмы составляет более 99%

Клиренс - около 48 мл/мин.

Подвергается метаболизму. Гидроксилированный и карбоксилированный метаболиты глимепирида образуются, по-видимому, вследствие метаболизма в печени и обнаруживаются в моче и в кале.

$T_{1/2}$ составляет 5-8 ч. После приема глимепирида в высоких дозах $T_{1/2}$ увеличивается. После однократного приема внутрь дозы глимепирида, меченого радиоактивностью, 58% радиоактивности обнаруживалось в моче и 35% - в кале. Неизмененное активное вещество в моче не обнаруживалось.

$T_{1/2}$ гидроксилированного и карбоксилированного метаболитов глимепирида составляли, соответственно, около 3-6 ч и 5-6 ч.

У пациентов с нарушениями функции почек (с низким КК) наблюдалась тенденция к увеличению клиренса

глимепирида и к снижению его средних концентраций в сыворотке крови. Таким образом, у данной категории пациентов не имеется дополнительного риска кумуляции глимепирида.

Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа (инсулиннезависимый) в случае неэффективности диетотерапии и физических нагрузок.

Относится к болезням:

- Инсульт

Противопоказания:

Сахарный диабет 1 типа (инсулинзависимый), кетоацидоз, прекома, кома, печеночная недостаточность, почечная недостаточность (в т.ч. больные, находящиеся на гемодиализе), беременность, лактация, повышенная чувствительность к глимепириду, другим производным сульфонилмочевины и сульфаниламидам.

Способ применения и дозы:

Начальную и поддерживающую дозу устанавливают индивидуально на основании результатов регулярного контроля уровня глюкозы в крови и в моче.

Начальная доза составляет 1 мг 1 раз/сут. При необходимости суточная доза может быть постепенно увеличена (на 1 мг за 1-2 недели) до 4-6 мг.

Максимальная доза составляет 8 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: гипогликемия, гипонатриемия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, ощущение дискомфорта в эпигастрии, боли в животе, диарея, повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз, желтуха, гепатит (вплоть до развития печеночной недостаточности).

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

Со стороны органа зрения: преходящие нарушения зрения.

Аллергические реакции: зуд, крапивница, кожная сыпь; редко - диспноэ, падение АД, анафилактический шок, аллергический васкулит, фотосенсибилизация.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности. В случае планируемой беременности или при наступлении беременности женщину следует перевести на инсулин.

В период лактации следует перевести женщину на инсулин.

В *экспериментальных исследованиях* установлено, что глимепирид выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиление гипогликемического действия глимепирида возможно при одновременном применении с инсулином или другими гипогликемическими препаратами, ингибиторами АПФ, аллопуринолом, анаболическими стероидами и мужскими половыми гормонами, хлорамфениколом, производными кумарина, циклофосфамидом, дизопирамидом, фенфлурамином, фенирамидолом, фибратами, флуоксетином, гуанетидином, изофосфамидами, ингибиторами МАО, миконазолом, ПАСК, пентоксифиллином (при инъекционном введении в высоких дозах), фенилбутазоном,

азапропазоном, оксифенбутазоном, пробенецидом, хинолонами, салицилатами, сульфинпиразоном, сульфаниламидами, тетрациклинами.

Ослабление гипогликемического действия глимепирида возможно при одновременном применении с ацетазоламидом, барбитуратами, кортикостероидами, диазоксидом, диуретиками, эпинефрином (адреналином) и другими симпатомиметиками, глюкагоном, слабительными средствами (после длительного применения), никотиновой кислотой (в высоких дозах), эстрогенами и прогестогенами, фенотиазином, фенитоином, рифампицином, гормонами щитовидной железы.

При одновременном применении блокаторы гистаминовых H_2-рецепторов, клонидин и резерпин способны как потенцировать, так и снижать гипогликемическое действие глимепирида.

На фоне применения глимепирида возможно усиление или ослабление действия производных кумарина.

Этанол может усиливать или ослаблять гипогликемическое действие глимепирида.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с сопутствующими заболеваниями эндокринной системы, воздействующими на углеводный обмен (в т.ч. нарушения функции щитовидной железы, аденогипофизарная или адренокортикальная недостаточность).

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

Следует учитывать, что симптомы гипогликемии могут быть сглажены или совсем отсутствовать у пожилых пациентов, пациентов с НЦД или получающих одновременное лечение бета-адреноблокаторами, клонидином, резерпином, гуанетидином или другими симпатолитиками.

При достижении компенсации сахарного диабета повышается чувствительность к инсулину; в связи с этим в процессе лечения может снизиться потребность в глимепириде. Во избежание развития гипогликемии необходимо своевременно снизить дозу или отменить глимепирид. Коррекцию дозы также следует проводить при изменении массы тела пациента или при изменении его образа жизни, либо при появлении других факторов, способствующих развитию гипо- или гипергликемии.

При переходе на глимепирид с другого препарата необходимо принимать во внимание степень и продолжительность эффекта предшествующего гипогликемического средства. Может возникнуть необходимость во временном прекращении лечения во избежание аддитивного эффекта.

В первые недели лечения может повыситься риск развития гипогликемии, что требует особо строгого наблюдения за больным. К факторам, способствующим развитию гипогликемии, относятся: нерегулярное, неполноценное питание; изменения привычной диеты; употребление алкоголя, особенно в сочетании с пропуском приема пищи; изменение привычного режима физических нагрузок; одновременное применение других лекарственных средств. Гипогликемия может быть быстро купирована немедленным приемом углеводов.

В период лечения необходим регулярный контроль уровня глюкозы в крови и моче, а также концентрации гликированного гемоглобина.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности (в т.ч. больным, находящимся на гемодиализе).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности.

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