Глюренорм



Код АТХ:

- A10BB08

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Гликвидон

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 цвета, гладкие, круглые, со скошенными краями, с риской на одной стороне и с гравировкой "57C" по обе стороны риски; на другой стороне выгравирован логотип фирмы.

	1 таб.
гликвидон	30 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 134.6 мг, крахмал кукурузный высушенный - 70 мг, крахмал кукурузный растворимый - 5 мг, магния стеарат - 0.4 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемический препарат для перорального применения, производное сульфонилмочевины II поколения. Обладает панкреатическим и внепанкреатическим эффектами. Стимулирует секрецию инсулина, потенцируя глюкозо-опосредованный путь образования инсулина. В опытах на животных было показано, что Глюренорм уменьшает инсулинорезистентность в печени и жировой ткани посредством увеличения рецепторов к инсулину, а также стимуляции пострецепторного механизма, опосредованного инсулином.

Гипогликемический эффект развивается через 60-90 минут после приема внутрь, максимум действия наступает через 2-3 ч и длится около 8-10 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь однократной дозы гликвидона (15 мг или 30 мг) препарат быстро и практически полностью (80-95%) всасывается из ЖКТ, достигая концентрации в плазме 0.65 мкг/мл (диапазон 0.12-2.14 мкг/мл). Среднее время достижения C_{max} препарата в плазме составляет 2 ч 15 мин (диапазон: 1.25-4.75 ч). Значение $AUC_{0-\infty}$ составляет 5.1 мкг×ч/мл (диапазон: 1.5-10.1 мкг×ч/мл).

Не имеется различий в фармакокинетических показателях у пациентов с сахарным диабетом и у здоровых лиц.

Распределение

Гликвидон имеет высокое сродство к белкам плазмы (>99%). Нет данных о возможном прохождении гликвидона или его метаболитов через ГЭБ или плаценту. Нет данных о возможности проникновения гликвидона в грудное молоко.

Метаболизм

Гликвидон полностью метаболизируется печенью, главным образом гидроксилированием и деметилированием. Метаболиты гликвидона не имеют или имеют слабо выраженную фармакологическую активность по сравнению с исходным веществом.

Выведение

Основная часть метаболитов выводится через кишечник. Почками выводится лишь небольшая часть метаболитов. В исследованиях показано, что после приема внутрь около 86% меченного изотопом препарата (^{14}C) выводится через кишечник. Независимо от дозы и способа введения, почками выводится около 5% (в виде метаболитов) от введенного количества препарата. Уровень выведения Глюренорма почками остается минимальным даже при регулярном назначении.

$T_{1/2}$ составляет 1.2 ч (в диапазоне - 0.4-3.0 ч), конечный $T_{1/2}$ составляет, приблизительно, 8 ч (в диапазоне - 5.7-9.4 ч).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов и пациентов среднего возраста фармакокинетические показатели аналогичны.

Основная часть препарата выводится через кишечник. Есть данные о том, что метаболизм препарата не изменяется у пациентов с печеночной недостаточностью. Выведение гликвидона почками незначительно, у пациентов с нарушением функции почек препарат не накапливается.

Показания к применению:

— сахарный диабет 2 типа у пациентов среднего и пожилого возраста (при неэффективности диетотерапии).

Относится к болезням:

- Сахарный диабет

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа;

— диабетический ацидоз, кетоацидоз, прекома и кома;

— состояние после резекции поджелудочной железы;

— острая перемежающаяся порфирия;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— некоторые острые состояния (например, инфекционные заболевания или большие хирургические операции);

— редкие наследственные заболевания, такие как галактоземия, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— беременность;

— период лактации (период грудного вскармливания);

— возраст до 18 лет (в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности препарата в данной возрастной группе);

— повышенная чувствительность к сульфаниламидам.

С *осторожностью*

— лихорадочный синдром;

— заболевания щитовидной железы (с нарушением функции);

— дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;

— алкоголизм.

Способ применения и дозы:

Препарат применяют внутрь. Необходимо соблюдать рекомендации врача относительно дозы препарата и соблюдения диеты. Не следует прекращать прием препарата без консультации с врачом.

Начальная доза Глюренорма обычно составляет 1/2 таб. (15 мг) во время завтрака. Препарат необходимо принимать в начале еды. После приема Глюренорма, прием пищи не следует пропускать.

Если прием 1/2 таб. (15 мг) не приводит к адекватному улучшению, после консультации с врачом, дозу следует постепенно увеличить. Если суточная доза Глюренорма не превышает 2 таб. (60 мг), она может быть назначена в 1 прием, во время завтрака.

При назначении более высокой дозы, лучший эффект может быть достигнут при приеме суточной дозы, разделенной на 2-3 приема. В этом случае самая высокая доза должна быть принята за завтраком. Увеличение дозы более 4 таб. (120 мг)/сут обычно не приводит к дальнейшему увеличению эффективности.

Максимальная суточная доза - 4 таб. (120 мг).

Пациенты с нарушением функции почек

Около 5% метаболитов препарата выводится почками. У пациентов с нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

Прием дозы, превышающей 75 мг, у пациентов с нарушением функции печени требует тщательного контроля состояния пациента. Препарат не следует назначать пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени, т.к. 95% дозы метаболизируется в печени и выводится через кишечник.

Комбинированная терапия

При недостаточном клиническом эффекте монотерапии препаратом Глюренорм может быть рекомендовано только дополнительное назначение метформина.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, сонливость, парестезия, чувство усталости.

Со стороны органа зрения: нарушения аккомодации.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия, экстрасистолия, сердечно-сосудистая недостаточность, гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, запор, диарея, чувство дискомфорта в области живота, сухость полости рта, холестаз.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь, зуд, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, реакция фотосенсибилизации.

Прочие: боль в грудной клетке.

Передозировка:

Передозировка производными сульфонилмочевины может привести к гипогликемии.

Симптомы: тахикардия, повышенное потоотделение, чувство голода, сердцебиение, тремор, головная боль, бессонница, раздражительность, нарушение речи и зрения, двигательное беспокойство и потеря сознания.

Лечение: в случае появления симптомов гипогликемии следует принять внутрь глюкозу (декстрозу) или продукты, богатые углеводами. При тяжелой гипогликемии (потеря сознания, кома) в/в вводят декстрозу. После восстановления сознания - прием легкоусвояемых углеводов (во избежание повторного развития гипогликемии).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Нет данных по применению гликвидона у женщин в период беременности и грудного вскармливания.

Неизвестно, проникает ли гликвидон или его метаболиты в грудное молоко. У беременных женщин с сахарным диабетом необходим тщательный мониторинг концентрации глюкозы в плазме. Прием пероральных антидиабетических средств у беременных женщин не обеспечивает должного контроля уровня углеводного обмена. Поэтому применение препарата Глюренорм в период беременности и кормления грудью противопоказано.

В случае возникновения беременности или при планировании беременности в период применения препарата Глюренорм, препарат следует отменить и перейти на инсулин.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможно усиление гипогликемического действия при одновременном назначении гликвидона и ингибиторов АПФ, аллопуринола, анальгетиков и НПВС, противогрибковых препаратов, хлорамфеникола, кларитромицина, клофибрата, производных кумарина, фторхинолонов, гепарина, ингибиторов МАО, сульфинпиразона, сульфониламидов, тетрациклинов и трициклических антидепрессантов, циклофосфамида и его производных, инсулина и пероральных гипогликемических средств.

Бета-адреноблокаторы, симпатолитики (включая клонидин), резерпин и гуанетидин могут усиливать гипогликемический эффект и одновременно маскировать симптомы гипогликемии.

Возможно уменьшение гипогликемического действия при одновременном назначении гликвидона и аминоглутетимида, симпатомиметиков, ГКС, тиреоидных гормонов, глюкагона, тиазидных и "петлевых" диуретиков, пероральных контрацептивов, диазоксида, фенотиазина и препаратов, содержащих никотиновую кислоту.

Барбитураты, рифампицин и фенитоин также могут уменьшать гипогликемический эффект гликвидона.

Усиление или ослабление гипогликемического эффекта гликвидона было описано при приеме блокаторов гистаминовых H_2-рецепторов (циметидин, ранитидин) и этанола.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациентам с сахарным диабетом необходимо строго соблюдать рекомендации врача. Особенно тщательный контроль нужен при подборе дозы или при переходе с другого гипогликемического препарата.

Пероральные гипогликемические средства не должны заменять лечебную диету, которая позволяет контролировать массу тела пациента. Пропуск приема пищи или несоблюдение рекомендаций врача может значительно снизить концентрацию глюкозы в крови и привести к потере сознания. При приеме таблетки до еды, а не как рекомендовано, в начале еды, влияние препарата на концентрацию глюкозы в крови более выражено, что повышает риск развития гипогликемии.

При появлении симптомов гипогликемии необходимо незамедлительно принять пищу, содержащую сахар. В случае сохраняющегося гипогликемического состояния следует немедленно обратиться к врачу.

Физическая нагрузка может усилить гипогликемическое действие.

Алкоголь или стресс могут усиливать или уменьшать гипогликемическое действие производных сульфонилмочевины.

Применение производных сульфонилмочевины у пациентов, страдающих недостаточностью глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы, может привести к гемолитической анемии. Т.к. Глюренорм относится к производным сульфонилмочевины, необходимо соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы и, по возможности, необходимо принять решение о смене препарата.

Одна таблетка преапарата Глюренорм содержит 134.6 мг лактозы (538.4 мг лактозы в максимальной суточной дозе). Пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как галактоземия, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, не должны принимать Глюренорм.

Гликвидон относится к производным сульфонилмочевины короткого действия и поэтому применяется у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с повышенным риском гипогликемии, например, у пожилых пациентов и пациентов с нарушением функции почек.

Поскольку выведение гликвидона почками незначительно, Глюренорм может применяться у пациентов с почечными нарушениями и диабетической нефропатией. Однако лечение пациентов с тяжелой почечной недостаточностью следует проводить под тщательным медицинским наблюдением.

Есть данные, что применение гликвидона у пациентов с сахарным диабетом 2 типа, имеющих сопутствующие заболевания печени, эффективно и безопасно. Только выведение неактивных метаболитов у таких пациентов несколько задерживается. Однако пациентам с сахарным диабетом и сопутствующими тяжелыми нарушениями функции печени назначение препарата не рекомендуется.

Во время клинических исследований выявлено, что применение препарата Глюренорм в течение 18 и 30 месяцев не приводило к увеличению массы тела, даже были отмечены случаи снижения массы тела на 1-2 кг. В сравнительных исследованиях с другими производными сульфонилмочевины было доказано, что у пациентов, принимающих Глюренорм более года, нет значительных изменений массы тела.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных о влиянии препарата на способность к управлению транспортными средствами и механизмами. Однако пациенты должны быть предупреждены о таких проявлениях гипогликемии как сонливость, головокружение, нарушение аккомодации, которые могут возникнуть на фоне приема препарата. Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами. При гипогликемических состояниях следует избегать управления транспортными средствами и механизмами.

При нарушениях функции почек

Так как основная часть препарата выводится через кишечник, у пациентов с нарушением функции почек препарат не накапливается. Следовательно, гликвидон может безопасно назначаться пациентам с риском развития хронической нефропатии.

Около 5% метаболитов препарата выводится почками. В клиническом исследовании - сравнении пациентов с сахарным диабетом и нарушениями функции почек разной степени тяжести и пациентов с сахарным диабетом без нарушений функции почек, прием Глюренорма в дозе 40-50 мг приводил к аналогичному влиянию на уровень глюкозы крови. Накопление препарата и/или гипогликемические симптомы не отмечались. Таким образом, у пациентов с нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при острой печеночной порфирии, тяжелой печеночной недостаточности.

Прием дозы, превышающей 75 мг, у пациентов с нарушением функции печени требует тщательного контроля за состоянием пациента. Препарат не следует назначать пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени, так как 95% дозы метаболизируется в печени и выводится через кишечник. В клинических исследованиях у пациентов с сахарным диабетом и нарушениями функции печени разной степени тяжести (включая острый цирроз печени с портальной гипертензией) Глюренорм не вызывал дальнейшего ухудшения функции печени, частота побочных эффектов не увеличивалась, гипогликемические реакции не выявлялись.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов и пациентов среднего возраста фармакокинетические показатели аналогичны.

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям в возрасте до 18 лет (в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности препарата в данной возрастной группе);

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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