

Кселевия



Код АТХ:

- [A10BH01](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Ситаглиптин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр^{МНН}](#) [Википедия^{МНН}](#)
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#)

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой бежевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "277" на одной стороне и гладкие на другой.

	1 таб.
ситаглиптина фосфата моногидрат	128.5 мг,
что соответствует содержанию ситаглиптина	100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 123.8 мг, кальция гидрофосфат неизмельченный - 123.8 мг, кроскармеллоза натрия - 8 мг, магния стеарат - 4 мг, натрия стеарилфумарат - 12 мг.

Состав оболочки: опадрай II бежевый, 85F17438 - 16 мг (поливиниловый спирт - 40%, титана диоксид (E171) - 21.56%, макрогол 3350 (полиэтиленгликоль) - 20.2%, тальк - 14.8%, железа оксид желтый (E172) - 3.07%, железа оксид красный (E172) - 0.37%).

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Метаболики](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральное гипогликемическое средство, высоко селективный ингибитор дипептидилпептидазы 4 (ДПП-4).

Ситаглиптин отличается по химической структуре и фармакологическому действию от аналогов глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1), инсулина, производных сульфонилмочевины, бигуанидов, агонистов γ -рецепторов, активируемых пролифератором пероксисом (PPAR- γ), ингибиторов альфа-глюкозидазы, аналогов амилина. Ингибируя ДПП-4,

ситаглиптин повышает концентрацию 2 известных гормонов семейства инкретинов: ГПП-1 и глюкозо-зависимого инсулиноотропного пептида (ГИП). Гормоны семейства инкретинов секретируются в кишечнике в течение суток, их уровень повышается в ответ на прием пищи. Инкретины являются частью внутренней физиологической системы регуляции гомеостаза глюкозы. При нормальном или повышенном уровне глюкозы крови гормоны семейства инкретинов способствуют увеличению синтеза инсулина, а также его секреции β -клетками поджелудочной железы за счет сигнальных внутриклеточных механизмов, ассоциированных с циклическим АМФ.

ГПП-1 также способствует подавлению повышенной секреции глюкагона α -клетками поджелудочной железы. Снижение концентрации глюкагона на фоне повышения уровня инсулина способствует уменьшению продукции глюкозы печенью, что в итоге приводит к уменьшению гликемии.

При низкой концентрации глюкозы крови перечисленные эффекты инкретинов на выброс инсулина и уменьшение секреции глюкагона не наблюдаются. ГПП-1 и ГИП не влияют на выброс глюкагона в ответ на гипогликемию. В физиологических условиях активность инкретинов ограничивается ферментом ДПП-4, который быстро гидролизует инкретины с образованием неактивных продуктов.

Ситаглиптин предотвращает гидролиз инкретинов ферментом ДПП-4, тем самым увеличивая плазменные концентрации активных форм ГПП-1 и ГИП. Повышая уровень инкретинов, ситаглиптин увеличивает глюкозозависимый выброс инсулина и способствует уменьшению секреции глюкагона. У пациентов с сахарным диабетом типа 2 с гипергликемией эти изменения секреции инсулина и глюкагона приводят к снижению уровня гликированного гемоглобина HbA_{1c} и уменьшению плазменной концентрации глюкозы, определяемой натощак и после нагрузочной пробы.

У пациентов с сахарным диабетом 2 типа прием одной дозы ситаглиптина приводит к ингибированию активности фермента ДПП-4 в течение 24 ч, что приводит к увеличению уровня циркулирующих инкретинов ГПП-1 и ГИП в 2-3 раза, нарастанию плазменной концентрации инсулина и С-пептида, снижению концентрации глюкагона в плазме крови, уменьшению гликемии натощак, а также уменьшению гликемии после нагрузки глюкозой или пищевой нагрузки.

Фармакокинетика

Фармакокинетика ситаглиптина изучена у здоровых лиц и пациентов с сахарным диабетом 2 типа.

После приема внутрь препарата в дозе 100 мг у здоровых лиц отмечается быстрая абсорбция ситаглиптина с достижением C_{max} через 1-4 ч. AUC увеличивается пропорционально дозе и составляет у здоровых субъектов $8.52 \text{ мкмоль} \times \text{ч}$ при приеме внутрь в дозе 100 мг, C_{max} составляла 950 нмоль. Абсолютная биодоступность ситаглиптина составляет приблизительно 87%. Внутри- и межиндивидуальные коэффициенты варибельности AUC ситаглиптина незначительны. Одновременный прием жирной пищи не влияет на фармакокинетику ситаглиптина.

Плазменная AUC ситаглиптина увеличивалась приблизительно на 14% после следующего приема препарата в дозе 100 мг по достижению равновесного состояния после приема первой дозы. После однократного приема препарата в дозе 100 мг средний V_d ситаглиптина у здоровых добровольцев составлял приблизительно 198 л. Связывание ситаглиптина с белками плазмы составляет 38%.

Метаболизируется лишь незначительная часть поступившего в организм препарата. После введения ^{14}C -меченного ситаглиптина внутрь приблизительно 16% радиоактивного препарата экскретировалось в виде его метаболитов. Были обнаружены следы 6 метаболитов ситаглиптина, вероятно не обладающие ДПП-4-ингибирующей активностью. В исследованиях *in vitro* было выявлено, что первичным ферментом, участвующим в ограниченном метаболизме ситаглиптина, является CYP3A4 с участием CYP2C8.

Приблизительно 79% ситаглиптина выводится в неизменном виде с мочой. В течение 1 недели после приема препарата здоровыми добровольцами ^{14}C -меченный ситаглиптин выводился: с мочой - 87% и калом - 13%. $T_{1/2}$ ситаглиптина при приеме внутрь в дозе 100 мг составляет приблизительно 12.4 ч. Почечный клиренс составляет приблизительно 350 мл/мин.

Выведение ситаглиптина осуществляется первично путем экскреции почками по механизму активной канальцевой секреции. Ситаглиптин является субстратом для транспортера органических анионов человека третьего типа (hOAT-3), который и может быть вовлечен в процесс выведения ситаглиптина почками. Ситаглиптин также является субстратом р-гликопротеина, который также может участвовать в процессе почечной элиминации ситаглиптина.

Показания к применению:

Монотерапия: в качестве дополнения к диете и физическим нагрузкам для улучшения контроля над гликемией при сахарном диабете 2 типа;

Комбинированная терапия: сахарный диабет 2 типа для улучшения контроля над гликемией в комбинации с метформином или агонистами PPAR- γ (например, тиазолидиндионом), когда диета и физическая нагрузка в сочетании с монотерапией перечисленными средствами не приводят к адекватному контролю над гликемией.

Относится к болезням:

- [Сахарный диабет](#)
- [ТИА](#)

Противопоказания:

Сахарный диабет 1 типа; диабетический кетоацидоз; беременность; период лактации (грудного вскармливания); дети и подростки в возрасте до 18 лет; повышенная чувствительность к ситаглиптину.

Способ применения и дозы:

Внутрь. Разовая доза - 100 мг 1 раз/сут.

При почечной недостаточности требуется коррекция режима дозирования.

Побочное действие:

Со стороны дыхательной системы: инфекции верхних дыхательных путей (100 мг - 6.8%, 200 мг - 6.1%, плацебо - 6.7%), назофарингит (100 мг - 4.5%, 200 мг - 4.4%, плацебо - 3.3%).

Со стороны ЦНС: головная боль (100 мг - 3.6%, 200 мг - 3.9%, плацебо - 3.6%).

Со стороны пищеварительной системы: диарея (100 мг - 3%, 200 мг - 2.6%, плацебо - 2.3%), боли в животе (100 мг - 2.3%, 200 мг - 1.3%, плацебо - 2.1%), тошнота (100 мг - 1.4%, 200 мг - 2.9%, плацебо - 0.6%), рвота (100 мг - 0.8%, 200 мг - 0.7%, плацебо - 0.9%), диарея (100 мг - 3%, 200 мг - 2.6%, плацебо - 2.3%).

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия (100 мг - 2.1%, 200 мг - 3.3%, плацебо - 1.8%).

Со стороны эндокринной системы: гипогликемия (100 мг - 1.2%, 200 мг - 0.9%, плацебо - 0.9%).

Со стороны лабораторных показателей: при дозах 100 мг/сут и 200 мг/сут - увеличение мочевой кислоты приблизительно на 0.2 мг/дл по сравнению с плацебо (средний уровень 5-5.5 мг/дл) у пациентов, получавших препарат в дозе 100 мг/сут и 200 мг/сут. Случаев развития подагры не зарегистрировано.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Было отмечено небольшое увеличение AUC (11%), а также средней C_{max} (18%) дигоксина при совместном применении с ситаглиптином. Это увеличение не считается клинически значимым.

Было отмечено увеличение AUC и C_{max} ситаглиптина на 29% и 68% соответственно у пациентов при совместном применении ситаглиптина в разовой дозе 100 мг и циклоспорина (мощного ингибитора Р-гликопротеина) в разовой дозе 600 мг. Данные изменения фармакокинетических параметров ситаглиптина не считаются клинически значимыми.

Особые указания и меры предосторожности:

Диагнозы

- Аденогенитальный синдром
- Акромегалия
- Гестационный сахарный диабет
- Гинекомастия у мужчин

Кселевия

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Источник: <http://drugs.thead.ru/Kseleviya>