Старликс



Код АТХ:

- A10BX03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Нателинид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
нателинид	60 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, натрия кроскармеллоза, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид (Е171), тальк, макрогол, кремния диоксид коллоидный безводный, оксид железа красный (Е172).

12 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
12 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
12 шт. - упаковки ячейковые контурные (7) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
нателинид	120 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, натрия кроскармеллоза, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид (Е171), тальк, макрогол, кремния диоксид коллоидный безводный, железа оксид желтый (Е172).

12 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
12 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
12 шт. - упаковки ячейковые контурные (7) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральный гипогликемический препарат, производное фенилаланина. Нателинид представляет собой производное аминокислоты фенилаланина, отличающееся по своим химическим и фармакологическим свойствам от

других противодиабетических средств. Препарат восстанавливает раннюю секрецию инсулина, что приводит к уменьшению постпрандиальной концентрации глюкозы в крови и уровня гликозилированного гемоглобина (HbA_{1c}).

Ранняя секреция инсулина в ответ на стимуляцию глюкозой – это жизненно важный механизм, обеспечивающий поддержание нормального уровня глюкозы в крови. При сахарном диабете 2 типа наблюдается нарушение/отсутствие этой фазы секреции инсулина. Под влиянием натеглинида, принятого до еды, происходит восстановление ранней (или первой) фазы секреции инсулина. Механизм этого явления заключается в быстром и обратимом взаимодействии препарата с K^+ -АТФ–зависимыми каналами β–клеток поджелудочной железы. Селективность натеглинида в отношении K^+ -АТФ–зависимых каналов β–клеток поджелудочной железы в 300 раз превосходит таковую в отношении каналов сердца и сосудов.

Натеглинид, в отличие от других пероральных гипогликемических средств, вызывает выраженную секрецию инсулина в пределах первых 15 мин после приема пищи, благодаря чему сглаживаются постпрандиальные колебания ("пики") концентрации глюкозы в крови. В последующие 3-4 ч уровень инсулина возвращается к исходным значениям, таким образом удается избежать развития постпрандиальной гиперинсулинемии, которая может приводить к отсроченной гипогликемии.

Секреция инсулина β–клетками поджелудочной железы, вызванная натеглинидом, зависит от уровня концентрации глюкозы в крови, то есть по мере снижения концентрации глюкозы уменьшается секреция инсулина. Наоборот, одновременный прием пищи или инфузия раствора глюкозы приводит к выраженному повышению секреции инсулина. Способность Старликса при низких концентрациях глюкозы в крови незначительно влиять на секрецию инсулина является дополнительным фактором, предупреждающим развитие гипогликемии, например, в случаях пропуска приема пищи.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме таблетки Старликса до еды натеглинид быстро абсорбируется из ЖКТ. Время достижения C_{max} составляет менее 1 ч. Биодоступность препарата около 72%. Для таких показателей как AUC и C_{max} фармакокинетика натеглинида в диапазоне доз от 60 мг до 240 мг имеет линейный характер при назначении больным сахарным диабетом 2 типа 3 раза/сут в течение одной недели. Значения T_{max} не зависят от дозы препарата.

Распределение

Связывание натеглинида с белками сыворотки (преимущественно с альбумином и в меньшей степени – с кислым α_1 -гликопротеином) составляет 97-99%. Степень связывания с белками не зависит от концентрации натеглинида в плазме в изученном диапазоне - 0.1-10 мкг/мл. V_d при достижении равновесного состояния составляет около 10 л.

Метаболизм

Натеглинид в значительной степени метаболизируется в печени с участием микросомальных изоферментов цитохрома P_{450} (на 70% изоферментом CYP2C9, на 30% - CYP3A4). Образующиеся в результате реакций гидроксилирования 3 основных метаболита натеглинида имеют в несколько раз меньшую, по сравнению с исходным веществом, фармакологическую активность.

Выведение

Натеглинид выводится из организма довольно быстро – в течение первых 6 ч после приема внутрь с мочой выводится около 75% принятой дозы. Выведение осуществляется преимущественно с мочой (примерно 83% от дозы), в основном в виде метаболитов. Около 10% выводится с калом. В изученном диапазоне доз (до 240 мг 3 раза/сут) кумуляции не отмечено. $T_{1/2}$ составляет 1.5 ч.

При назначении натеглинида после еды отмечается замедление его абсорбции – удлиняется T_{max} , уменьшается значение C_{max} , при этом полнота абсорбции (величина AUC) не изменяется. В связи с вышеизложенным рекомендуется применять Старликс до еды.

Не было выявлено каких-либо клинически значимых различий фармакокинетических параметров натеглинида у больных мужского и женского пола.

Показания к применению:

—сахарный диабет 2 типа (инсулиннезависимый) – при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок.

Старликс можно применять как в виде монотерапии, так и в комбинации с гипогликемическими препаратами с другим механизмом действия, например, метформином.

Относится к болезням:

- Гипогликемия
- Инсульт
- Сахарный диабет

Противопоказания:

—сахарный диабет 1 типа (инсулинзависимый);

—диабетический кетоацидоз;

—выраженные нарушения функции печени (в связи с отсутствием данных клинических исследований для данной популяции пациентов);

—беременность;

—лактация (грудное вскармливание);

—детский возраст (в связи с отсутствием данных клинических исследований для данной возрастной группы пациентов);

—повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Старликс следует принимать перед едой. Промежуток времени между приемом препарата и приемом пищи не должен превышать 30 мин. Как правило, препарат принимают непосредственно перед едой.

При применении Старликса в качестве монотерапии рекомендуемая доза составляет 120 мг 3 раза/сут (перед завтраком, обедом и ужином). Если при таком режиме дозирования не удается достичь желаемого эффекта, разовую дозу можно увеличить до 180 мг. Коррекция режима дозирования проводится на основании регулярно определяемых показателей гликозилированного гемоглобина (HbA_{1c}). Учитывая, что главное терапевтическое воздействие Старликса заключается в снижении прандиальной концентрации глюкозы в крови (именно эта концентрация определяет значение показателя HbA_{1c}), для оценки терапевтической эффективности препарата можно также использовать такой показатель как концентрация глюкозы в крови через 1-2 ч после еды.

Пациентам, получающим монотерапию Старликсом и нуждающимся в присоединении другого гипогликемического препарата, дополнительно может быть назначен метформин. Наоборот, пациентам, уже получающим терапию метформином, в качестве дополнительного средства может быть назначен Старликс в дозе 120 мг 3 раза/сут (перед приемами пищи). Если на фоне лечения метформином значение HbA_{1c} приближается к желаемому (менее 7.5%), доза Старликса может быть меньше - по 60 мг 3 раза/сут.

Не выявлено каких-либо различий в показателях эффективности и безопасности Старликса у пациентов пожилого возраста и общей популяцией. Кроме того, возраст больных не влиял на фармакокинетические параметры Старликса. Поэтому для пациентов пожилого возраста специальной коррекции режима дозирования не требуется.

Эффективность и безопасность применения Старликса у детей еще не изучены, поэтому его назначение детям не рекомендуется.

У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени коррекция режима дозирования не требуется. Не рекомендуется применять препарат у больных с тяжелыми нарушениями функции печени, поскольку пока отсутствуют данные клинических исследований.

У пациентов с нарушениями функции почек разной степени тяжести (в т.ч. находящихся на гемодиализе) коррекция режима дозирования не требуется.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: после назначения натеглинида, как и при применении других гипогликемических препаратов, были отмечены симптомы, предположительно свидетельствующие о развитии гипогликемии, такие как повышенная потливость, тремор, головокружение, повышенный аппетит, сердцебиение, тошнота, слабость, недомогание. Обычно эти явления были выражены слабо и легко купировались приемом углеводов. По данным клинических исследований, значения концентрации глюкозы в крови менее 3.3 ммоль/л имели место у 2.4% больных из числа тех, у кого были отмечены вышеперечисленные клинические проявления.

Прочие: редко - повышение уровней печеночных ферментов в крови (обычно слабо выраженное и преходящее); реакции повышенной чувствительности (сыпь, зуд, крапивница).

В группе больных, получавших Старликс, и группе больных, получавших плацебо, с одинаковой частотой были отмечены такие нежелательные явления как боли в животе, диспепсия, диарея, головная боль, инфекции

дыхательных путей.

Передозировка:

Случаи передозировки Старликса до настоящего времени не описаны.

Симптомы: исходя из знаний о механизме действия препарата, можно предположить, что основным следствием передозировки будет гипогликемия с клиническими проявлениями различной тяжести.

Лечение: тактика лечения гипогликемии определяется выраженностью симптомов. При сохраненном сознании и отсутствии неврологических проявлений показан прием раствора глюкозы/сахара внутрь, а также коррекция дозы препарата и/или приемов пищи. При тяжелой гипогликемии, сопровождающейся неврологическими проявлениями (кома, судороги), показано в/в введение раствора глюкозы. Применение гемодиализа для выведения натеглинида из кровотока неэффективно из-за его высокого связывания с белками плазмы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Опыт применения Старликса при беременности в настоящее время отсутствует, поэтому оценить его безопасность не представляется возможным. Применять препарат при беременности не следует.

В доклинических исследованиях было показано, что натеглинид выделяется с грудным молоком. Хотя в настоящее время нет данных о том, выделяется ли натеглинид с грудным молоком у человека, его не следует назначать кормящим матерям из-за риска развития гипогликемии у младенца в случае, если какое-либо, даже небольшое, количество препарата выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В исследованиях in vitro было показано, что натеглинид в значительной степени метаболизируется изоферментами цитохрома P_{450} – CYP2C9 (70%) и CYP3A4 (30%). С другой стороны, судя по способности натеглинида подавлять in vitro метаболизм толбутамида, он сам является потенциальным ингибитором CYP2C9 in vivo. Какого-либо влияния натеглинида на активность изофермента CYP3A4 в опытах in vitro обнаружено не было. В целом, натеглинид не обладает сколько-нибудь существенным потенциалом для клинически значимых фармакокинетических взаимодействий.

Натеглинид не влияет на фармакокинетические свойства варфарина (субстрат для CYP3A4 и CYP2C9), диклофенака (субстрат для CYP2C9), троглитазона (индуктор CYP3A4) и дигоксина. Таким образом, при одновременном назначении Старликса и таких препаратов как варфарин, диклофенак, троглитазон и дигоксин коррекция доз не требуется. Также не было выявлено клинически значимых фармакокинетических взаимодействий Старликса с другими пероральными противодиабетическими препаратами, такими как метформин и глибенкламид.

Поскольку натеглинид имеет высокое связывание с белками плазмы, в опытах in vitro было изучено его взаимодействие с рядом высоко связывающихся с белками препаратов, такими как фуросемид, пропранолол, каптоприл, никардипин, правастатин, варфарин, фенитоин, ацетилсалициловая кислота, глибенкламид и метформин. Показано, что эти препараты не влияют на связь натеглинида с белками плазмы. Аналогичным образом, натеглинид не вытесняет из связи с белком пропранолол, глибенкламид, никардипин, варфарин, фенитоин и ацетилсалициловую кислоту.

Следует учитывать, что некоторые препараты влияют на метаболизм глюкозы, поэтому при их одновременном назначении с гипогликемическими препаратами, и в т.ч. Старликсом, возможны изменения концентрации глюкозы и требуется врачебное наблюдение. Гипогликемическое действие может усиливаться при одновременном назначении с НПВС, салицилатами, ингибиторами МАО, неселективными бета-адреноблокаторами. Напротив, гипогликемическое действие может быть ослаблено при одновременном назначении тиазидных диуретиков, глюкокортикоидов, симпатомиметиков, препаратов тиреоидных гормонов.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении Старликса для лечения больных сахарным диабетом 2 типа (инсулиннезависимым) следует соблюдать меры предосторожности в отношении возникновения гипогликемии. Риск развития гипогликемии на фоне приема Старликса (как и других гипогликемических препаратов) выше у пациентов пожилого возраста, со сниженной массой тела, при наличии надпочечниковой или гипофизарной недостаточности. Снижение концентрации глюкозы в крови может быть спровоцировано приемом алкоголя, усиленной физической нагрузкой, а также одновременным приемом другого гипогликемического препарата.

Одновременный прием бета-адреноблокаторов может маскировать проявления гипогликемии.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, работающим с механизмами и управляющим автотранспортом, следует предпринимать особые меры предосторожности для профилактики гипогликемии.

При нарушениях функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек разной степени тяжести (в т.ч. находящихся на гемодиализе) коррекция режима дозирования не требуется.

При нарушениях функции печени

У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени коррекция режима дозирования не требуется. Не рекомендуется применять препарат у больных с тяжелыми нарушениями функции печени, поскольку пока отсутствуют данные клинических исследований.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан в детском возрасте (в связи с отсутствием данных клинических исследований для данной возрастной группы пациентов).

Условия хранения:

Препарат следует хранить при температуре не выше 30°С в оригинальной упаковке, в недоступном для детей месте. Препарат не следует использовать по истечении срока годности, обозначенного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

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