

Состав

действующее вещество: гликлазид;

1 таблетка с модифицированным высвобождением содержит гликлазида 60 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки с модифицированным высвобождением.

Основные физико-химические свойства:

таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг: белые, овальные двояковыпуклые таблетки с насечкой с обеих сторон, со штампом «G» с одной стороны и «60» с другой стороны от риска с обеих сторон.

Фармакотерапевтическая группа

Противодиабетические средства. Сахароснижающие средства, за исключением инсулинов. Сульфаниламиды, производные мочевины. Гликлазид.

Код АТХ А10В В09.

Фармакодинамика

Гликлазид - это пероральный гипогликемический препарат, производное сульфонилмочевины. От других препаратов отличается наличием гетероциклического кольца, содержащего азот и имеет эндоциклические связи.

Механизм действия

Гликлазид снижает уровень глюкозы в плазме крови вследствие стимуляции секреции инсулина β -клетками островков Лангерганса поджелудочной железы. Повышение уровня постпрандиального инсулина и секреция С-пептида сохраняются даже после 2 лет применения препарата. Кроме указанных метаболических свойств, гликлазид имеет также гемоваскулярные свойства.

Влияние на инсулиносекрецию

У больных диабетом II типа гликлазид восстанавливает ранний пик инсулиносекреции в ответ на поступление глюкозы и повышает вторую фазу

секреции инсулина. Увеличение выделения инсулина происходит в соответствии с принятой пищи или нагрузки глюкозой.

Гемоваскулярного свойства

Гликлазид уменьшает микротромбоз благодаря двум механизмам, которые могут быть задействованы в развитии осложнений сахарного диабета:

- частично ингибирует агрегацию и адгезию тромбоцитов, уменьшает количество маркеров активации тромбоцитов (β -тромбоглобулина, тромбоксан В2);
- влияет на фибринолитическую активность эндотелия сосудов (повышает активность tPA).

Фармакокинетика

Абсорбция

Концентрация гликлазида в плазме крови прогрессивно растет в течение первых 6 часов после приема, после чего достигает постоянного уровня (плато), содержащийся с шестом в двенадцатом часа после применения.

Индивидуальные колебания незначительны.

Гликлазид полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. Прием пищи не влияет на скорость и степень абсорбции.

Распределение

Связывание гликлазида с белками плазмы крови составляет приблизительно 95%. Объем распределения составляет около 30 л. Однократный прием суточной дозы Гликлазид-Тева обеспечивает эффективную концентрацию гликлазида в плазме крови в течение 24 часов.

Метаболизм

Гликлазид метаболизируется в печени и выводится с мочой, менее 1% действующего вещества выводится с мочой в неизмененном виде. Активные метаболиты в плазме крови отсутствуют.

Вывод

Период полувыведения гликлазиду составляет примерно 12-20 часов.

Линейность / нелинейность

Взаимосвязь между принятой дозой до 120 мг и площадью под кривой «концентрация-время» является линейным.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста. У пациентов пожилого возраста не отмечается клинически значимых изменений фармакокинетики препарата.

Показания

Сахарный диабет II типа у взрослых:

- снижение и контроль глюкозы в крови при невозможности нормализовать уровень глюкозы только диетой, физическими упражнениями и снижением массы тела;
- предупреждение осложнений сахарного диабета II типа: снижение риска макро- и микрососудистых осложнений, в том числе новых случаев или ухудшения нефропатии у пациентов с сахарным диабетом II типа, которые лечатся по стратегии интенсивного контроля гликемии.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к гликлазиду или к другим препаратам сульфонилмочевины, сульфаниламидам или к любому компоненту препарата;
- сахарный диабет I типа;
- диабетическая кома и кома, диабетический кетоацидоз (в таких случаях рекомендовано применение инсулина);
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- лечение миконазолом;
- лечение квинолоном;
- период кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При назначении препаратов, одновременное применение с которыми может привести к гипо- или гипергликемии (см. Ниже), нужно предупредить пациента о необходимости тщательного контроля за уровнем глюкозы в крови во время лечения. Может потребоваться коррекция дозы сахароснижающего лекарственного средства во время и после лечения этими препаратами.

Препараты, одновременное назначение с которыми может повысить риск гипогликемии

Противопоказано одновременное применение

Миконазол (для системного применения, гель для полости рта) усиливает гипогликемический эффект с возможным развитием симптомов гипогликемии и даже развитием комы.

Квинолоном усиливает гипогликемический эффект с возможным развитием тяжелой, глубокой, персистирующей гипогликемии, симптомы которой трудно контролировать, или даже с развитием комы, в частности у пациентов пожилого возраста с почечной недостаточностью.

Не рекомендуется одновременное применение

Фенилбутазон (для системного применения) усиливает гипогликемический эффект препаратов сульфонилмочевины (замещает их связь с белками плазмы и / или уменьшает их выведение). Желательно применить другой противовоспалительное средство и обратить внимание пациента на необходимость и важность самоконтроля. В случае необходимости дозирования регулируют во время и после терапии противовоспалительным средством.

Алкоголь повышает риск возникновения гипогликемических реакций (вследствие ингибирования компенсаторных реакций), что может привести к гипогликемической комы. Следует избегать употребления алкоголя и приема препаратов, содержащих алкоголь.

Комбинации, требующие осторожности

При одновременном применении с одним из нижеприведенных препаратов в некоторых случаях может возникнуть гипогликемия вследствие усиления гипогликемического эффекта: другие сахароснижающие препараты (инсулины, акарбоза, бигуаниды (например метформин), тиазолидиндионы, ингибиторы дипептидилпептидазы-4, агонисты рецепторов глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1)), β -блокаторы, флуконазол, ингибиторы АПФ (каптоприл, эналаприл), антагонисты H₂-рецепторов, ингибиторы МАО, сульфаниламиды, кларитромицин и нестероидные противовоспалительные препараты.

Препараты, одновременное назначение с которыми может повысить риск возникновения гипергликемии

Не рекомендуется одновременное применение

Даназол оказывает диабетогенное действие. Если нельзя избежать применения этого активного вещества, пациента следует предупредить о необходимости и важности самостоятельного контроля уровня глюкозы в моче и в крови. Может возникнуть необходимость в коррекции дозы противодиабетических средств во время и после лечения даназолом.

Комбинации, требующие осторожности

Хлорпромазин (нейролептик) при применении в высоких дозах (> 100 мг в сутки) повышает уровень глюкозы в крови (вследствие уменьшения высвобождения инсулина). Пациента следует предупредить о необходимости и важности контроля за уровнем глюкозы в крови. Может возникнуть необходимость в коррекции дозы антидиабетического активного вещества во время и после лечения нейролептиков.

Глюкокортикоиды (для системного и местного применения: внутрисуставные, кожные и ректальные препараты) и тетракозактид повышают уровень глюкозы в крови с возможным развитием кетоацидоза (уменьшают толерантность к углеводам). Пациента следует предупредить о необходимости и важности контроля за уровнем глюкозы в крови, особенно в начале лечения. Может возникнуть необходимость в коррекции дозы противодиабетических средств во время и после лечения глюкокортикоидами.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин (в) повышают уровень глюкозы крови через β_2 -агонистический эффект. Следует предупредить о необходимости контроля за уровнем глюкозы в крови. Если необходимо, пациента следует перевести на инсулин.

Препараты зверобоя (*Hypericum perforatum*) снижают концентрацию гликлазида. Следует подчеркнуть важность контроля за уровнем глюкозы в крови.

Комбинации, которые следует принимать во внимание

Антикоагулянты (например варфарин и др.). При одновременном применении с антикоагулянтами препараты сульфонилмочевины могут усиливать антикоагулянтное действие последних. В случае необходимости дозу антикоагулянтов можно откорректировать.

Особенности применения

Гипогликемия

Этот препарат следует назначать только тем пациентам, которые имеют возможность регулярно питаться (включая завтрак). Важно регулярно

принимать углеводы, поскольку повышение риска гипогликемии возникает в случаях, когда пища принимается поздно, в неадекватном количестве или если эта пища с низким содержанием углеводов. Гипогликемии более вероятно при низкокалорийного питания, длительном или сильной физической нагрузке, употреблении алкоголя или применении комбинации противодиабетических препаратов.

При приеме препаратов сульфонилмочевины может возникать гипогликемия (см. Раздел «Побочные реакции»). Иногда гипогликемия может быть тяжелой и продолжительной. В таком случае может потребоваться госпитализация и назначение глюкозы на несколько дней.

Для снижения риска возникновения эпизодов гипогликемии необходимо принимать во внимание индивидуальные особенности пациентов, давать им четкие объяснения и тщательно подбирать дозу.

Факторы, повышающие риск возникновения гипогликемии:

- пациент отказывается или не может выполнять рекомендации врача (особенно это касается пациентов пожилого возраста);
- неудовлетворительное, нерегулярное питание, пропуски приема пищи, периоды голодания или изменения диеты;
- дисбаланс между физической нагрузкой и употреблением углеводов;
- почечная недостаточность;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- передозировка препарата;
- определенные нарушения эндокринной системы: нарушение функции щитовидной железы, гипопитуитаризм и адреналовая недостаточность;
- одновременное применение алкоголя или определенных лекарственных средств (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Почечная и печеночная недостаточность

Фармакокинетика и / или фармакодинамика гликлазида может меняться у пациентов с печеночной и тяжелой почечной недостаточностью. Эпизоды гипогликемии у таких пациентов могут быть длительными, поэтому требуют соответствующего лечения.

Информация для пациента

Пациента и членов его семьи нужно проинформировать о факторах риска и условия, которые могут способствовать возникновению гипогликемии, о симптомах гипогликемии (см. Раздел «Побочные реакции») и способы их

устранения.

Пациент должен быть проинформирован о важности соблюдения рекомендаций врача относительно диеты, о важности регулярного выполнения физических упражнений и регулярного мониторинга глюкозы крови.

Ухудшение контроля гликемии

У пациентов, получающих сахароснижающие препараты, ухудшение контроля гликемии может быть вызвано: препаратами зверобоя (*Hypericum perforatum*) или любым сопутствующим лечением, которое может влиять на метаболизм гликлазида, инфекцией, лихорадкой, травмой или хирургическим вмешательством. В некоторых случаях может потребоваться назначение инсулина.

Гипогликемическая эффективность любого приема сахароснижающих средств, в том числе гликлазида, может со временем меняться. Это может быть следствием прогрессирования тяжести заболевания или следствием снижения ответа на лечение. Этот феномен известен как вторичная недостаточность, которая отличается от первичной недостаточности, когда препараты неэффективны с самого начала лечения. Перед тем как делать вывод по развитию вторичной недостаточности у пациента, необходимо проверить корректность назначенной дозы и соблюдение пациентом диеты.

Лабораторные показатели

Для оценки контроля уровня глюкозы в крови рекомендуется определять уровень гликозилированного гемоглобина (или уровень глюкозы в крови натощак). Может также быть полезным самостоятельный контроль пациентами уровня сахара в крови.

У пациентов с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (Г6ФДГ) применение препаратов сульфонилмочевины может вызвать гемолитической анемии. Поскольку гликлазид относится к химическому классу препаратов сульфонилмочевины, следует быть осторожными и рассмотреть вопрос о назначении пациентам с Г6ФДГ-недостаточностью альтернативной терапии препаратами, которые не содержат сульфонилмочевины.

Вспомогательные вещества

Это лекарственное средство содержит лактоза. Таблетка с модифицированным высвобождением Гликлазид-Тева 30 мг содержит 54 мг лактозы (в виде моногидрата), а Гликлазид-Тева 60 мг - 108 мг лактозы (в виде моногидрата). Пациентам с редкими наследственными нарушениями переносимости галактозы,

синдромом мальабсорбции глюкозы и галактозы, недостаточностью лактазы Лаппа не следует назначать этот препарат.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Гликлазид-Тева может иметь незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами или работать с другими автоматизированными системами. Пациентам следует знать симптомы гипогликемии, уметь их распознавать и в случае их возникновения быть осторожными во время управления автомобилем или работы с механизмами, особенно в начале лечения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Пероральные сахароснижающие препараты (включая Гликлазид-Тева) не следует применять во время беременности. Опыт применения гликлазида при беременности ограничен (менее 300 случаев применения беременными), также ограничены данные по применению других препаратов сульфонилмочевины. Исследования на животных показали, что гликлазид не оказывает тератогенного действия.

Желательно избегать приема гликлазида во время беременности. Для лечения диабета в период беременности препаратом первого выбора является инсулин.

Контроль за уровнем глюкозы должно быть достигнут еще до планирования беременности для уменьшения риска возникновения аномалий, связанных с неконтролируемым диабетом. При планировании или сразу после установления беременности необходимо перевести женщину с пероральных сахароснижающих препаратов на инсулин.

Кормления грудью. Отсутствуют данные о проникновении гликлазида или его метаболитов в грудное молоко. Гликлазид-Тева противопоказан во время кормления грудью из-за возможности возникновения неонатальной гипогликемии. Нельзя исключить риска для новорожденных и младенцев.

Фертильность. В доклинических исследованиях влияния на фертильность или репродуктивную способность самок и самцов крыс установлено не было.

Способ применения и дозы

Для перорального применения.

Назначается только взрослым.

Суточная доза может изменяться от 30 до 120 мг в сутки (от 1 до 4 таблеток по 30 мг в сутки или от половины до 2 таблеток по 60 мг в сутки).

Таблетка 60 мг может быть разделена на равные части.

Суточную дозу следует принимать однократно во время завтрака.

Половину таблетки или целую таблетку (таблетки) следует глотать целиком (не раздавливать и не разжевывая).

Если больной забыл принять таблетки, не следует увеличивать дозу на следующий день.

Как и все сахароснижающие средства, Гликлазид-Тева требует индивидуального подбора дозы в зависимости от ответа пациента на лечение (уровень глюкозы в крови, гликозилированный гемоглобин HbA1c).

Начальная доза и подбор дозы. Рекомендованная начальная доза составляет 30 мг в сутки. При эффективном контроле за уровнем глюкозы можно продолжать лечение этой дозой. В случае необходимости усиления контроля уровня глюкозы в крови дозу можно последовательно повышать до 60 мг, 90 мг или 120 мг. Повышение дозы рекомендуется проводить постепенно, с интервалом в 1 месяц, кроме случаев, когда не наблюдалось снижения уровня глюкозы крови в течение 2 недель лечения. В таком случае дозу можно увеличить в конце второй недели лечения.

Максимальная рекомендованная суточная доза - 120 мг.

1 таблетка с модифицированным высвобождением препарата Гликлазид-Тева 60 мг эквивалентна 2 таблеткам с модифицированным высвобождением препарата Гликлазид-Тева по 30 мг.

Таблетка с модифицированным высвобождением препарата Гликлазид-Тева 60 мг подлежит разделу, что дает возможность применять препарат в дозе 30 мг (0,5 таблетки) и в дозе 90 мг (1,5 таблетки).

Перевод пациента с препаратов, содержащих гликлазида 80 мг на препарат Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 30 мг. 1 таблетка, содержащая гликлазида 80 мг, соответствует 1 таблетке препарата Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 30 мг. Необходимо тщательно контролировать показатели крови при переводе на препарат Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 30 мг.

Перевод пациента с препаратов, содержащих гликлазида 80 мг на препарат Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг. 1 таблетка, содержащая гликлазида 80 мг, соответствует 0,5 таблетки препарата Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг. Необходимо тщательно контролировать показатели крови при переводе на препарат Гликлазид-Тева, таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг.

Перевод пациента с других пероральных сахароснижающих препаратов на препарат Гликлазид-Тева. При переводе на Гликлазид-Тева нужно принимать во внимание дозировки и период полувыведения предыдущего приема сахароснижающего препарата. Переходный период обычно не требуется. Начинать следует с дозы 30 мг с последующей коррекцией дозы (см. «Начальная доза и подбор дозы»).

При переводе с сахароснижающих препаратов сульфонилмочевины, имеющих длительный период полувыведения, перерыв в лечении на несколько дней может потребоваться для предотвращения суммарного эффекта двух препаратов и развития гипогликемии. Лечение препаратом Гликлазид-Тева начинают с дозы 30 мг в сутки с последующей коррекцией дозы с соблюдением правил лечения и подбора дозы (см. Выше).

Одновременное применение с другими гипогликемическими препаратами. Гликлазид-Тева можно применять в комбинации с бигуанидами, ингибиторами альфа-глюкозидазы или инсулином. При недостижении адекватного контроля глюкозы крови у пациентов, принимающих Гликлазид-Тева, можно начать одновременную терапию инсулином под тщательным медицинским наблюдением.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста (от 65 лет). Режим дозирования такой же, как и у пациентов в возрасте до 65 лет.

Пациенты с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести. Режим дозирования Гликлазид-Тева является таким же, как и у пациентов с нормальной функции почек, но пациент должен находиться под тщательным наблюдением.

Пациенты группы риска возникновения гипогликемии

Факторы риска возникновения гипогликемии:

- недостаточное или плохое питание;

- тяжелые или недостаточно компенсированы нарушения со стороны эндокринной системы (гипотиреозидизмом, гипопитуитаризм и адренокортикотропного недостаточность);
- отмена длительной терапии кортикостероидами и / или терапии высокими дозами кортикостероидов;
- тяжелые заболевания сосудов (тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелая патология сонных сосудов, диффузные заболевания сосудов).

Рекомендуется минимальная начальная доза 30 мг в сутки.

Предупреждение осложнений сахарного диабета II типа. Согласно результатам исследований необходимо придерживаться стратегии интенсивного контроля гликемии (уровень HbA1c $\leq$ 6,5%). Стратегия интенсивного контроля гликемии предусматривает постепенное повышение дозы препарата до 120 мг в сутки. Повышение дозы следует проводить под контролем уровня HbA1c с соблюдением строгих рекомендаций относительно диеты и физических упражнений, контролируя риск развития гипогликемии. Также возможно добавление других сахароснижающих препаратов, таких как метформин, акарбоза, тиазолидиндионы или инсулин.

Дети

Безопасность и эффективность препарата у детей и подростков (в возрасте до 18 лет) не установлены. Не рекомендуется назначать Гликлазид-Тева детям из-за отсутствия данных по применению препарата этой категории пациентов.

Передозировка

Передозировка препаратов сульфонилмочевины может вызвать гипогликемию.

Симптомы умеренной гипогликемии (без потери сознания и без неврологических симптомов) необходимо корректировать приемом углеводов (сахара), коррекцией дозы сахароснижающего препарата и / или диеты. Тщательное наблюдение за пациентом следует продолжать, пока врач не будет уверен, что пациент в безопасности.

Тяжелая гипогликемия с развитием комы, судорог или других неврологических расстройств требует неотложной медицинской помощи с немедленной госпитализацией.

При установлении диагноза гипогликемической комы или при подозрении на развитие комы пациенту необходимо быстро внутривенно ввести 50 мл концентрированного раствора глюкозы (от 20% до 30%) с последующим

постоянным введением менее концентрированного раствора глюкозы (10%) с частотой, которая будет поддерживать уровень глюкозы в крови более 1 г / л. Необходимо обеспечить постоянное наблюдение за пациентом. В зависимости от состояния пациента врач принимает решение о дальнейшем мониторинга.

Гликлазид имеет высокий уровень связывания с белками плазмы, поэтому применение диализа неэффективно.

Побочные реакции

При применении гликлазида и других производных сульфонилмочевины могут наблюдаться нижеприведенные побочные эффекты.

Гипогликемия

Наиболее частой побочной реакцией при применении гликлазида является гипогликемия. Как и при применении других препаратов сульфонилмочевины, прием гликлазида может вызвать гипогликемию при нерегулярном питании и особенно в случае пропуска приема пищи. Гипогликемии может сопровождаться характерными симптомами, такими как: головная боль, сильное чувство голода, тошнота, рвота, утомляемость, нарушение сна, возбуждение, агрессивность, снижение концентрации и внимания, замедление реакций, депрессия, спутанность сознания, нарушение зрения и речи, афазия, тремор, парезы, нарушение чувствительности, головокружение, ощущение бессилия, потеря самоконтроля, бред, судороги, поверхностное дыхание, брадикардия, сонливость и потеря сознания, что может привести к коме и летальному исходу.

Кроме того, возможны нарушения со стороны адренергической системы: потливость, липкая кожа, тревога, тахикардия, артериальная гипертензия, palpitation, боль за грудиной, аритмия.

Обычно симптомы гипогликемии исчезают после приема углеводов (сахара). Однако прием сахарозаменителей в этом случае не будет эффективным. Опыт применения других препаратов сульфонилмочевины свидетельствует о том, что даже в случае эффективности принятых мер гипогликемия может возникнуть снова.

Если эпизод гипогликемии тяжелым или длительным и состояние пациента временно под контролем благодаря приему сахара, необходима неотложная медицинская помощь или даже госпитализация.

Другие побочные реакции

Со стороны желудочно-кишечного тракта: боль в абдоминальной области, тошнота, рвота, диспепсия, диарея и запор. Соблюдение рекомендаций по приему препарата во время завтрака поможет избежать или минимизировать возникновение этих проявлений.

Реже наблюдаются нижеприведенные побочные эффекты.

Со стороны кожи и подкожной ткани: сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек, эритема, макулопапулезная сыпь, буллезные реакции (синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз) и очень редко- медикаментозные высыпания с эозинофилией и системными симптомами (DRESS).

Со стороны системы крови и лимфатической системы: гематологические расстройства возникают редко и могут включать анемию, тромбоцитопения, лейкопения, гранулоцитопению. Обычно эти явления исчезают после отмены лечения.

Со стороны пищеварительной системы: повышение уровня печеночных ферментов (АЛТ, АСТ, щелочной фосфатазы), гепатит (единичные случаи). В случае возникновения холестатической желтухи лечение следует прекратить. Указанные побочные эффекты обычно исчезают после отмены препарата.

Со стороны органа зрения: через изменения уровня глюкозы в крови могут возникнуть временные нарушения зрения, особенно в начале лечения.

Реакции, характерные для класса препаратов сульфонилмочевины: случаи эритроцитопения, агранулоцитоза, гемолитической анемии, панцитопении, аллергического васкулита, гипонатриемии, повышение уровня печеночных ферментов и даже нарушение функции печени (например с холестазом и желтухой), гепатита с регрессией после отмены препаратов сульфонилмочевины или редко случаях с последующей печеночной недостаточностью, угрожавшей жизни.

Сообщение о подозреваемых побочные реакции. Сообщение о подозреваемых побочные реакции после регистрации лекарственного средства очень важны. Это позволяет осуществлять постоянный мониторинг соотношения польза / риск при применении этого лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о подозреваемых побочные реакции через национальную систему сообщений.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Препарат не требует специальных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

Таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг: по 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Балканфарма - Дупница АО.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Ул. Самоковське шосе 3, Дупница, 2600, Болгария.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).