

Состав

действующее вещество: гликлазид;

1 таблетка с модифицированным высвобождением содержит гликлазида 30 или 60 мг;

другие составляющие: лактозы моногидрат, гипромелоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки с модифицированным высвобождением.

Основные физико-химические свойства:

таблетки с модифицированным высвобождением по 30 мг: белые овальные двояковыпуклые таблетки со штампом «G» с одной стороны;

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

Фармакотерапевтическая группа

Средства, влияющие на пищеварительную систему и метаболизм.

Противодиабетические средства. Сахаропонижающие средства, за исключением инсулинов. Сульфонамиды, производные мочевины. Гликлазид. Код АТХ А10В В09.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Гликлазид – это пероральное сахароснижающее средство, производное сульфонилмочевины. От других препаратов отличается наличием гетероциклического кольца, содержащего азот и 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-х лет применения препарата. Кроме указанных метаболических свойств, гликлазид обладает также гемоваскулярными свойствами.

Воздействие на инсулиносекрецию

У пациентов с 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 пищей или нагрузкой глюкозой.

Гемоваскулярные 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 -тромбоглобулин, тромбоксан B2);
влияет на фибринолитическую активность эндотелия сосудов (повышает активность tPA).

Фармакокинетика.

Абсорбция

Концентрация гликлазида в плазме крови прогрессивно возрастает в течение первых 6 часов после приема, после чего достигает постоянного уровня (плато), удерживаемого с 6 до 12 часов 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 протеинами плазмы крови составляет примерно 95%. Объем распределения составляет примерно 30 л. Однократный прием суточной дозы Гликлазид-Тева MR обеспечивает эффективную концентрацию гликлазида в плазме крови в течение 24 часов.

Биотрансформация

Гликлазид метаболизируется преимущественно 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 гликлазида составляет около 12–20 часов.

Линейность/нелинейность

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

Особые группы пациентов

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

Показания

Сахарный диабет II типа у взрослых:

снижение и контроль глюкозы в крови при невозможности нормализовать уровень глюкозы только диетой, физическими упражнениями и уменьшением массы тела.

Противопоказания

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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.

Не рекомендуется одновременное применение

Фенилбутазон (для системного применения) усиливает гипогликемический эффект препаратов сульфонилмочевины (замещает их связь с протеинами плазмы крови и/или уменьшает их выведение). Желательно применить другое противовоспалительное средство и обратить внимание пациента на необходимость и важность самоконтроля. При необходимости дозировку препарата регулируют во время и после терапии противовоспалительным средством.

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

Комбинации, требующие осторожности

При одновременном применении с одним из нижеперечисленных препаратов в некоторых случаях может возникнуть гипогликемия вследствие усиления гипогликемического эффекта: другие сахароснижающие препараты (инсулины, акарбоза, бигуаниды (например метформин), тиазолидиндионы, ингибиторы дипептидилпептидазы-1, агонисты β -рецепторов, флуконазол, ингибиторы АПФ (каптоприл, эналаприл), антагонисты H_2 -рецепторов, ингибиторы МАО, сульфонамиды, 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 этого активного вещества, пациенту следует предупредить о необходимости и важности самостоятельного контроля уровня глюкозы в моче и в крови. Может потребоваться корректировка дозы антидиабетического средства во время и после лечения даназолом.

Комбинации, требующие осторожности

Хлорпромазин (нейролептик) при применении в высоких дозах (> 100 мг/сут) повышает уровень глюкозы в крови (в результате уменьшения высвобождения инсулина). Пациента следует предупредить о необходимости и важности контроля уровня глюкозы в крови. Может потребоваться корректировка дозы антидиабетического активного вещества во время и после лечения нейролептиком.

Глюкокортикоиды (для системного и местного применения: внутрисуставные, кожные и ректальные препараты) и тетракозактрин повышают уровень глюкозы в крови с возможным развитием кетоацидоза (снижают толерантность к углеводам). Пациента следует предупредить о необходимости и важности контроля уровня глюкозы в крови, особенно в начале лечения. Может потребоваться корректировка дозы антидиабетического средства во время и после лечения глюкокортикоидами.

Ритодрин, сальбутамол, тербуталин (внутривенно) повышают уровень глюкозы крови из-за β_2 -агонистического эффекта. Следует предупредить о необходимости контроля уровня глюкозы в крови. При необходимости пациента следует перевести на инсулин.

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

Лекарственные средства, которые могут вызвать дисгликемию

Комбинации, требующие осторожности

Фторхинолоны. При одновременном применении гликлазида и лекарственного средства из группы фторхинолонов следует предупредить пациента о риске развития дисгликемии и подчеркнуть важность контроля уровня глюкозы в крови.

Комбинации, которые следует принимать во внимание

Антикоагулянты (например, варфарин и т.п.). При одновременном применении с антикоагулянтами препараты сульфонилмочевины могут потенцировать антикоагулянтное действие последних. При необходимости дозу антикоагулянтов можно откорректировать.

Особенности по применению

Гипогликемия

Это лекарственное средство следует назначать только пациентам, которые имеют возможность регулярно питаться (включая завтрак). Важно регулярно принимать углеводы, поскольку повышение риска гипогликемии возникает в случаях, когда пища употребляется поздно, в неадекватном количестве или если эта пища с низким содержанием углеводов. Возникновение гипогликемии более вероятно при низкокалорийном питании, длительной или сильной физической нагрузке, употреблении алкоголя или при применении комбинации гипогликемических 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 учитывать 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 смены 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 адrenaловая недостаточность;

одновременное употребление алкоголя или применение определенных лекарственных средств (см. Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий).

Почечная и печеночная недостаточность

Фармакокинетика и/или фармакодинамика гликлазида может изменяться 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 следует проинформировать о факторах риска и условиях, которые могут способствовать возникновению гипогликемии, о симптомах гипогликемии (см. раздел «Побочные реакции») и способах их устранения.

Пациент должен быть проинформирован о важности соблюдения рекомендаций врача относительно диеты, 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*), инфекцией, лихорадкой, травмой или хирургическим вмешательством. В некоторых случаях может потребоваться назначение инсулина.

Гипогликемическая эффективность любого перорального сахароснижающего средства, в том числе гликлазида, может со временем изменяться. Это может быть следствием прогрессирования тяжести заболевания или снижением ответа на лечение. Этот феномен известен как вторичная недостаточность, отличающаяся от первичной недостаточности, когда препараты неэффективны с самого начала лечения. Прежде чем делать вывод о развитии вторичной недостаточности у пациента, необходимо проверить корректность назначенной дозы и соблюдение пациентом диеты.

Дисгликемия

Отклонения в уровне глюкозы крови, включая гипогликемию и гипергликемию, наблюдались у пациентов с диабетом, получавших одновременное лечение фторхинолонами, особенно у пациентов пожилого возраста. Поэтому рекомендуется тщательный мониторинг уровня глюкозы крови у всех пациентов, получающих гликлазид одновременно с фторхинолонами.

Лабораторные показатели

Для оценки контроля уровня глюкозы в крови рекомендуется определять уровень гликозилированного гемоглобина (или уровень глюкозы в венозной плазме крови натощак). Может также быть полезен самостоятельный контроль пациентов уровня сахара в крови.

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

Пациенты с порфирией

Случаи возникновения острой порфирии описаны при применении других препаратов сульфонилмочевины у пациентов с порфирией.

Вспомогательные вещества

Это лекарственное средство содержит моногидрат лактозы. Таблетка с модифицированным высвобождением Гликлазид-Тева MR 30 мг содержит 54 мг лактозы (в виде моногидрата), а Гликлазид-Тева MR 60 мг – 108 мг лактозы (в виде моногидрата). Пациентам с редкими наследственными нарушениями переносимости галактозы, синдромом мальабсорбции глюкозы и галактозы, недостаточностью лактазы Лаппа не рекомендуется назначать этот препарат.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность. Данные по применению гликлазида в период беременности отсутствуют или ограничены (менее 300 случаев применения беременными), также ограничены данные по применению других препаратов сульфонилмочевины.

Исследования на животных показали, что гликлазид не оказывает тератогенного действия.

В качестве меры пресечения желательно избегать приема гликлазида в период беременности.

Контроль уровня глюкозы должен быть достигнут еще до планирования беременности для уменьшения риска возникновения аномалий, связанных с неконтролируемым диабетом.

Для лечения диабета в период беременности препаратом первого выбора является инсулин, а пероральные гипогликемические препараты не приемлемы.

При планировании или сразу после установления беременности необходимо перевести женщину из пероральных сахароснижающих препаратов на инсулин.

Кормление грудью. Нет данных о проникновении гликлазида или его метаболитов в грудное молоко. Гликлазид-Тева MR противопоказан в период кормления грудью из-за риска возникновения неонатальной гипогликемии. Нельзя исключить риск новорожденных и младенцев.

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

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Гликлазид-Тева MR может оказывать 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 соблюдать осторожность при управлении автомобилем или работе с другими механизмами, особенно в начале лечения.

Способ применения и дозы

Для перорального применения.

Назначать только взрослым.

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

Таблетка 60 мг может быть распределена на уровне дозы.

Суточную дозу следует принимать однократно во время завтрака.

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

При пропуске приема таблетки не следует увеличивать дозу на следующий день.

Как и все сахароснижающие средства, Гликлазид-Тева MR нуждается в индивидуальном подборе дозы в зависимости от ответа пациента на лечение (уровень глюкозы в крови, гликозилированный гемоглобин HbA_{1c}).

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

Максимальная рекомендуемая суточная доза – 120 мг.

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

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

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

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

Перевод пациента с других пероральных сахароснижающих препаратов на препарат Гликлазид-Тева MR. При переводе на Гликлазид-Тева MR следует принимать во внимание дозировку и период полувыведения предварительного перорального 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 быть необходим во избежание суммарного эффекта двух препаратов и развития гипогликемии.

Лечение препаратом Гликлазид-Тева MR начинать с дозы 30 мг/сут с последующей коррекцией дозы с соблюдением правил начала лечения и подбора дозы (см. выше).

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

Особые группы пациентов

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

Пациенты с почечной недостаточностью легкой и умеренной тяжести. Режим дозирования препарата Гликлазид-Тева MR такой же, как и у пациентов с нормальной функцией почек, но пациент должен находиться под тщательным наблюдением.

Пациенты группы риска возникновения гипогликемии

Факторы риска возникновения гипогликемии:

недостаточное или плохое питание;
тяжелые или недостаточно компенсированные нарушения со стороны эндокринной системы (гипотиреозидизм, гипопитуитаризм и адренокортикотропная недостаточность);
отмена длительной терапии кортикостероидами и/или терапии высокими дозами кортикостероидов;
тяжелые заболевания сосудов (тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелая патология каротидных сосудов, диффузные заболевания сосудов).

Рекомендуется минимальная начальная доза 30 мг/сут.

Дети.

Безопасность и эффективность препарата для лечения детей и подростков (до 18 лет) не установлены. Не рекомендуется назначать Гликлазид-Тева MR 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 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, конвульсий 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 выше 1 г/л. Необходимо обеспечить постоянное наблюдение за пациентом. В зависимости от состояния пациента врач принимает решение о дальнейшем мониторинге.

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

Побочные эффекты

При применении гликлазида и других производных сульфонилмочевины могут наблюдаться указанные ниже нежелательные 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 при пропуске приема пищи. Возникновение 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, нарушения чувствительности, головокружение, бессилие, 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, тревожность, 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 тяжелый или длительный и состояние пациента временно под контролем благодаря приему сахара, необходима неотложная медицинская помощь или даже госпитализация.

Другие побочные реакции

Со стороны желудочно-кишечного тракта: расстройства со стороны желудочно-кишечного тракта, в том числе боли в абдоминальном участке, тошнота, рвота,

диспепсия, диарея и запор. Следование рекомендациям по приему препарата во время завтрака поможет избежать или минимизировать возникновение этих проявлений.

Реже наблюдаются нижеперечисленные побочные реакции.

Со стороны кожи и подкожной ткани: сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек, эритема, макулопапулезные сыпи, буллезные реакции (такие как синдром Стивенса – Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и аутоиммунные буллезные расстройства) и очень редко системными симптомами (DRESS)

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

Со стороны гепатобилиарной системы: повышение уровня печеночных ферментов (АЛТ, АСТ, щелочной фосфатазы), гепатит (единичные случаи). При возникновении холестатической желтухи лечение препаратом следует прекратить. Указанные побочные реакции обычно исчезают после отмены препарата.

Со стороны органов зрения: из-за изменений уровня глюкозы в крови могут возникнуть временные нарушения зрения, особенно в начале лечения.

Реакции, характерные для класса препаратов сульфонилмочевины: случаи эритроцитопении, агранулоцитоза, гемолитической анемии, панцитопении, аллергического васкулита, гипонатриемии, повышения уровня печеночных ферментов и даже нарушения функции печени или желтухи. одиноких случаях с последующей печеночной недостаточностью, угрожавшей жизни.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях. Обо всех случаях подозреваемых побочных реакций и отсутствии эффективности препарата следует сообщать по ссылке: <https://aisf.dec.gov.ua/>.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

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

Упаковка

Таблетки с модифицированным высвобождением по 30 мг: по 10 таблеток в блистере; по 6 блистеров в коробке.

Таблетки с модифицированным высвобождением по 60 мг: по 10 таблеток в блистере; по 3 или 9 блистеров в коробке.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

Балканфарма-Дупница АО.

Местонахождение производителя и адрес места его деятельности.

Ул. Самоковское шоссе 3, Дупница, 2600, Болгария.