

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
25.01.12 № 47
Регистрационное свидетельство
№ UA/11974/01/01
№ UA/11974/01/02
№ UA/11974/01/03

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

ГЛИМАКС[®]
(GLIMAX[®])

Состав:

действующее вещество: glimepiride;

1 таблетка содержит глимепирида 2 мг, 3 мг или 4 мг;

вспомогательные вещества (таблетки по 2 мг): лактозы моногидрат, натрия крохмалгликолят (тип А), повидон К-30, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, железа оксид желтый (Е 172), железа оксид красный (Е 172);

вспомогательные вещества (таблетки по 3 мг): лактозы моногидрат, натрия крохмалгликолят (тип А), повидон К-30, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат;

вспомогательные вещества (таблетки по 4 мг): лактозы моногидрат, натрия крохмалгликолят (тип А), повидон К-30, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат; железа оксид желтый (Е 172), железа оксид красный (Е 172)

Лекарственная форма. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа.

Антидиабетические средства. Пероральные гипогликемизирующие препараты, за исключением инсулинов. Сульфонамиды, производные мочевины. Код АТС А10В В12.

Клинические характеристики.

Показания.

Инсулинозависимый сахарный диабет II типа, если уровень сахара в крови нельзя адекватно поддерживать исключительно диетой, физическими упражнениями и снижением массы тела.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к глимепириду или какому-либо компоненту препарата, к производным сульфонилмочевины или к другим сульфонамидам. Инсулинозависимый сахарный диабет I типа, диабетический кетоацидоз, диабетическая кома, тяжелые нарушения функции почек и печени.

В случае тяжелого нарушения функции почек или печени следует перевести пациента на терапию инсулином.

Способ применения и дозы.

Успешное лечение сахарного диабета зависит от соблюдения пациентом соответствующего рациона питания, регулярной физической активности, а также постоянного контроля уровня глюкозы в крови и моче. Несоблюдение больным диеты не компенсируется приемом таблеток или инсулина. Препарат применяют взрослые. Таблетку следует глотать, не разжёвывая, запивая

жидкостью.

Дозировка зависит от содержания глюкозы в сыворотке крови и мочи. Обычно Глимакс® применяют один раз в сутки. Препарат рекомендуется применять незадолго до или во время сытного завтрака или, если завтрака нет, то незадолго до или во время первого основного приёма пищи. Если был пропущен очередной приём препарата, не стоит увеличивать дозу при следующем приёме.

Монотерапия.

Начальная доза составляет 1 мг глимепирида в сутки. Если такая доза дает возможность адекватно контролировать уровень сахара, её применяют, как поддерживающую.

Если гликемический контроль не является оптимальным, дозировку следует постепенно увеличивать (с интервалом в 1-2 недели) до 2, 3 или 4 мг глимепирида в сутки. Если у больного наблюдается гипогликемическая реакция на приём 1 мг Глимакса в сутки, это означает, что болезнь можно контролировать только при помощи соблюдения диеты. Доза, больше 4 мг в сутки, даёт лучшие результаты только в отдельных случаях. Максимальная рекомендованная доза – 6 мг Глимакса в сутки.

Комбинация с метформином.

Если максимальная суточная доза метформина не обеспечивает достаточного гликемического контроля, можно начать сопутствующую терапию глимепиридом. Придерживаясь предыдущей дозировки метформина, приём Глимакса следует начинать с низкой дозы (1 мг), которую потом можно постепенно повышать до максимальной суточной дозы, ориентируясь на желаемый уровень метаболического контроля. Комбинированную терапию следует проводить под пристальным наблюдением врача.

Комбинация с инсулином.

Если максимальная суточная доза Глимакса не обеспечивает надлежащего гликемического контроля, в случае необходимости можно начать сопутствующую терапию инсулином. Придерживаясь предыдущей дозировки глимепирида, лечение инсулином следует начинать с самой низкой рекомендуемой дозы, которую можно постепенно повышать, ориентируясь на желаемый уровень метаболического контроля. Комбинированную терапию следует проводить под пристальным наблюдением врача.

Улучшение контролируемости диабета сопровождается повышением чувствительности к инсулину, поэтому, во время терапии потребность в глимепириде может снижаться. Чтобы избежать гипогликемии следует постепенно уменьшать дозу или вообще прерывать терапию. Необходимость в пересмотре дозировки также может возникнуть, если у пациента изменилась масса тела или образ жизни, или же действуют другие факторы, которые повышают риск гипо- или гипергликемии.

Переход от пероральных гипогликемических средств на Глимакс®.

На терапию Глимаксом обычно можно перейти с других пероральных гипогликемических агентов. Во время такого перехода следует учитывать силу действия и период полувыведения предыдущего средства. В некоторых случаях, особенно если антидиабетический препарат имеет долгий период полувыведения (например, хлорпропамид), перед началом приёма Глимакса рекомендуется подождать несколько дней. Это даст возможность снизить риск гипогликемических реакций вследствие аддитивного действия двух агентов. Рекомендуемая начальная доза – 1 мг глимепирида в сутки. Доза может быть поэтапно увеличена с учётом реакции на препарат.

Переход с инсулина на Глимакс®.

В исключительных случаях больным сахарным диабетом II типа, которые принимают инсулин, может быть показана замена его на Глимакс®. Такой переход следует проводить только при условии пристального медицинского контроля.

Побочные реакции.

Со стороны системы крови: редко – тромбоцитопения от средней до тяжелой степени, лейкопения, гранулоцитопения, агранулоцитоз, эритроцитопения, гемолитическая анемия и панцитопения, которые обычно исчезают после прекращения лечения.

Со стороны иммунной системы: очень редко – аллергический васкулит, реакции повышенной чувствительности от незначительных до серьёзных с развитием диспноэ, снижением

артериального давления, иногда – шок. Возможна перекрестная аллергия с сульфонилмочевиной, сульфонамидами или родственными соединениями.

Метаболические нарушения: редко – гипогликемические реакции, которые возникают в основном в начале лечения, могут приобретать тяжелые формы и не всегда легко поддаются коррекции (симптомы гипогликемии приведены в разделе «*Передозировка*»). Возникновение этих реакций зависит от субъективных факторов, таких как особенности питания и дозировка.

Со стороны органов зрения: из-за изменения уровня глюкозы в крови могут возникать временные нарушения зрения, особенно вначале лечения.

Со стороны пищеварительного тракта: очень редко – тошнота, рвота, диарея, ощущение давления или переполненности желудка, боль в животе, которые иногда могут привести к прекращению терапии.

Со стороны гепатобилиарной системы: может наблюдаться повышение уровня ферментов печени; очень редко – нарушение функции печени (например, холестаза и желтуха), гепатит, который может прогрессировать до печеночной недостаточности.

Со стороны кожи и подкожной ткани: реакции повышенной чувствительности – зуд, высыпания и крапивница; очень редко – повышенная чувствительность кожи к свету.

Лабораторные показатели: очень редко – снижение уровня натрия в сыворотке крови.

Передозировка.

Передозировка может приводить к гипогликемии, которая длится от 12 до 72 часов и после первого облегчения может появиться повторно. Симптомы могут проявляться через 24 часа после всасывания препарата. Как правило, такие пациенты должны находиться в стационаре.

Симптомы гипогликемии: тошнота, рвота и боль в области желудка, головная боль, тремор, нарушение зрения, нарушение координации, сонливость, расстройства сна, беспокойство, агрессивность, нарушения концентрации внимания и времени реакции, депрессия, дезориентация, расстройства речи, афазия, парез, нарушения чувствительности, головокружение, беспомощность, потеря самоконтроля, делирий, церебральные судороги, потеря сознания вплоть до развития комы, поверхностное дыхание и брадикардия. Кроме того, могут наблюдаться такие признаки обратной адренергической реакции, как чрезмерная потливость, тревожность, тахикардия, артериальная гипертензия, ощущение сердцебиения, стенокардия и сердечная аритмия. Клиническая картина тяжелого гипогликемического приступа может напоминать инсульт.

Лечение. Лечение заключается, в первую очередь, в препятствии абсорбции препарата. Для этого следует вызвать рвоту, а потом выпить воды или лимонада с активированным углем (адсорбент), показано применение слабительного средства. В случае тяжелой передозировки необходима госпитализация в отделение реанимации. Как можно скорее следует начать введение глюкозы: в случае необходимости – сначала одноразовая внутривенная инъекция 50 мл 50% раствора, а потом – внутривенно капельно 10% раствор, постоянно контролируя уровень глюкозы в крови. Дальнейшее лечение симптоматическое.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Препарат не применяют в период беременности. Если пациентка, которая принимает глимепирид, планирует беременность или забеременела, её как можно скорее следует перевести на терапию инсулином.

Поскольку другие производные сульфонилмочевины проявляются в грудном молоке, рекомендуется прекратить лечение глимепиридом из-за риска возникновения гипогликемии у новорожденного.

Дети.

Препарат не применяют.

Особенности применения.

Правильная диета, регулярные физические упражнения и, в случае необходимости, уменьшение массы тела столь же значимы для достижения оптимального контроля уровня сахара в крови, как и регулярный приём глимепирида. Клиническими симптомами недостаточного понижения уровня

сахара в крови (гипергликемия) являются увеличение частоты мочеиспускания, сильная жажда, сухость во рту и сухая кожа.

Глимакс® следует принимать незадолго до или во время еды. Если прием пищи происходит каждый раз в разное время или вообще пропускается, приём препарата может вызвать гипогликемию.

Симптомы практически всегда можно быстро смягчить, если срочно принять углеводы (сахар). Искусственные подсластители не дадут никакого эффекта.

Исходя из опыта применения других производных сульфонилмочевины известно, что контрмеры сначала могут быть успешными, но, не смотря на это, симптомы гипогликемии могут появиться снова.

Тяжелая и длительная гипогликемия, которая только временно может быть ослаблена применением обычного количества сахара, требует немедленного медикаментозного лечения, а иногда – госпитализации.

Факторами, которые способствуют возникновению гипогликемии, являются: нежелание или (чаще у пациентов в возрасте) отсутствие возможности сотрудничать с врачом; недоедание, нерегулярное питание или пропущенный приём пищи, периоды голодания; изменение режима питания; дисбаланс между физическим нагрузками и приёмом углеводов; употребление алкоголя, особенно совместно с пропущенным приёмом пищи; умеренные нарушения функции почек и печени; передозировка Глимакса; определенные некомпенсированные расстройства эндокринной системы, которые влияют на метаболизм углеводов, или обратная регуляция гипогликемии (например, нарушения функции щитовидной железы, недостаточность функции передней доли гипофиза или коры надпочечных желез), одновременный приём некоторых лекарственных средств.

В ходе лечения Глимаксом следует постоянно контролировать уровень глюкозы в крови и моче. Кроме того, рекомендуется контролировать количество гликозилированного гемоглобина.

Во время применения препарата необходим регулярный контроль функции печени и формулы крови (особенно количества лейкоцитов и тромбоцитов).

В стрессовых ситуациях (например, при несчастных случаях, urgentных операциях, инфекциях, которые сопровождаются лихорадкой) может быть показано временное переводение больного на инсулин.

Нет данных касательно применения Глимакса пациентам с тяжелым нарушением функции печени или тем, кому показан диализ. Больных с серьезной почечной или печеночной недостаточностью следует перевести на приём инсулина.

Следует учитывать, что симптомы гипогликемии могут быть скрытыми или отсутствовать у пациентов пожилого возраста с вегетативной нейропатией или у тех, кто одновременно получает лечение блокаторами β -адренорецепторов, резерпином, клонидином, гуанетидином или другими симпатолитиками. Если эффект недостаточен или снижено действие, рекомендуется комбинация с метформином или с инсулином в случае длительной терапии.

В случае компенсации сахарного диабета повышается чувствительность к инсулину, в связи с чем в процессе лечения может снизиться потребность в препарате. Коррекцию дозы следует проводить также при изменении массы тела пациента или его образа жизни, или в случае появления других факторов, которые способствуют гипо- или гипергликемии.

Препарат не следует назначать пациентам, которые имеют редкую наследственную непереносимость галактозы, лактазную недостаточность или нарушения всасывания глюкозы-галактозы.

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

Под воздействием препарата у пациентов могут ухудшиться такие функции, как концентрация внимания, скорость реакции, что является результатом гипо- или гипергликемии, а также следствием нарушения функции зрения. Это следует учитывать пациентам, занимающимся потенциально опасными видами деятельности, которые требуют повышенного внимания и скорости психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействий.

Одновременный приём Глимакса с определёнными лекарственными средствами может вызвать как ослабление, так и усиление гипогликемического действия глимепирида. Поэтому другие препараты следует принимать только при согласии (или по назначению) врача. Глимепирид метаболизируется при помощи цитохрома P450 (CYP2C9). Известно, что вследствие одновременного приёма индукторов (например, рифампицина) или ингибиторов (например, флуконазола) CYP2C9 этот метаболизм может изменяться. Флуконазол, один из самых сильных ингибиторов CYP2C9, увеличивает AUC глимепирида приблизительно вдвое.

Усиливают действие глимепирида при одновременном употреблении: фенилбутазон, азапропазон, оксифенбутазон, сульфипиразон, инсулин и пероральные антидиабетические препараты, некоторые сульфонамиды длительного действия, метформин, тетрациклины, салицилаты и р-аминосалициловая кислота, ингибиторы MAO, анаболические стероиды и мужские половые гормоны, хинолоновые антибиотики, хлорамфеникол, пробенецид, кумариновые антикоагулянты, миконазол, фенфлурамин, пентоксифиллин (при парентеральном введении высоких доз), фибраты, тритоквалин, ингибиторы АПФ, флуконазол, флуоксетин, аллопуринол, симпатолитики, циклофосфамид, ифосфамид, трофосфамид, дизопирамид, фенираמידол, гуанетидин.

Снижают гипогликемический эффект глимепирида при одновременном применении: эстрогены и прогестагены, салуретики, тиазидные диуретики, гормоны щитовидной железы и препараты, которые стимулируют функцию щитовидной железы, кортикостероиды и глюкокортикоиды, производные фенотиазина, хлорпромазин, эпинефрин и другие симпатомиметики, никотиновая кислота (высокие дозы) и её производные, глюкагон, слабительные средства (длительное применение), фенитоин, диазоксид, барбитураты, рифампицин, ацетазоламид.

Антагонисты H₂-рецепторов, β-блокаторы, клонидин и резерпин могут как потенцировать, так и ослаблять гипогликемический эффект. Под влиянием симпатолитиков, таких как β-блокаторы, клонидин, гуанетидин и резерпин, проявления адренергической обратной регуляции гипогликемии могут уменьшаться или исчезать. Употребление алкоголя может усиливать или ослаблять гипогликемическое действие глимепирида непредвиденным образом.

Глимепирид способен как увеличивать, так и уменьшать влияние производных кумарина.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Глимепирид – пероральное гипогликемизирующее средство, производное сульфонилмочевины. Стимулирует секрецию инсулина β-клетками поджелудочной железы, усиливает высвобождение инсулина, повышает чувствительность периферических тканей к инсулину. Максимальный эффект достигается через 2 – 3 часа и длится более 24 часов.

Фармакокинетика. При приёме внутрь глимепирид полностью всасывается независимо от приёма пищи. Максимальная концентрация в сыворотке крови достигается через 2,5 часа после приёма. Объём распределения низкий (приблизительно 8,8 л), клиренс – приблизительно 48 мл/мин, связывание с белками плазмы – около 99 %. Период полувыведения – приблизительно 5-8 часов. После приёма препарата в высоких дозах период полувыведения увеличивается.

Глимепирид метаболизируется в печени до гидроксильных производных, которые проявляются как в моче (приблизительно 58 % от разовой дозы препарата), так и в испражнениях (35 – 40 %). При одноразовом приёме препарата и при использовании в течение нескольких дней 1 раз в сутки значительной разницы в фармакокинетике не обнаружено. Препарат не накапливается. Фармакокинетические параметры у пациентов разного возраста и пола похожи.

Наблюдается тенденция к увеличению клиренса глимепирида и снижению его средней концентрации в сыворотке крови у пациентов с нарушениями функций почек.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства:

таблетки по 2 мг: светло-жёлтые, круглые, плоские таблетки, с линией разлома с одной стороны и гладкие с другой;

таблетки по 3 мг: белые, круглые, плоские таблетки, с линией разлома с одной стороны и гладкие с другой;

таблетки по 4 мг: бледно-розовые, круглые, плоские таблетки, с линией разлома с одной стороны и гладкие с другой.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С в сухом, защищенном от света месте.
Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

ООО «Кусум Фарм».

Местонахождение.

Украина, 40030, г. Сумы, ул. Скрябина, 54.

Дата последнего пересмотра.