

Состав

действующее вещество: глибенкламид;

1 таблетка содержит глибенкламида 5 мг;

вспомогательные вещества: маннит (Е 421), повидон, кальция стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, натрия лаурилсульфат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета плоскоцилиндрической формы с фаской и риской.

Фармакотерапевтическая группа

Лекарственные средства, применяемые при диабете. Гипогликемические препараты, за исключением инсулинов. Сульфонилмочевина. Глибенкламид. Код АТХ А10В В01.

Фармакодинамика

Глибенкламид оказывает гипогликемическое действие как у больных сахарным диабетом II типа, так и у здоровых людей, так как он повышает секрецию инсулина β -клетками поджелудочной железы за счет их стимуляции. Это действие зависит от концентрации глюкозы в среде, окружающей β -клетки.

Фармакокинетика

После приема внутрь глибенкламид быстро и почти полностью всасывается. Одновременный прием пищи существенно на это не влияет. Связывание глибенкламида с белками плазмы крови составляет более 98%. Смах в сыворотке крови достигается через 2,5 ч и составляет 100 нг/мл. Через 8-10 часов концентрация в сыворотке крови снижается, в зависимости от введенной дозы, на 10-20 нг/мл. $T_{1/2}$ после внутривенного введения составляет около 2 часов, а после приема - 7 часов. Однако некоторые исследования указывают на то, что у больных диабетом это время может удлиняться до 8-10 часов. Глибенкламид полностью метаболизируется в печени до нескольких метаболитов, которые не принимают существенного участия в сахароснижающем эффекте глибенкламида.

Метаболиты выводятся с мочой и желчью примерно в одинаковых количествах, а их полный вывод заканчивается через 45-72 часа. У больных с нарушением функции печени выведение глибенкламида из плазмы замедлено. У больных с почечной недостаточностью, в зависимости от степени нарушения функции почек, компенсаторно увеличивается выведение метаболитов. При умеренной почечной недостаточности (клиренс креатинина ≥ 30 мл/мин) суммарная элиминация остается без изменений, а при тяжелой почечной недостаточности возможна кумуляция.

Показания

Инсулиннезависимый диабет взрослых (сахарный диабет II типа), если иные меры, как, например, строгое соблюдение диеты, снижение лишней массы тела, достаточная физическая активность не привели к удовлетворительной коррекции уровня глюкозы в крови.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам препарата, других препаратов сульфонилмочевины, сульфаниламидам, сульфонамидных диуретиков и пробенецида. Случаи сахарного диабета, когда требуется лечение инсулином: инсулинозависимый сахарный диабет (сахарный диабет I типа), полная вторичная неэффективность терапии глибенкламидом при сахарном диабете II типа, метаболизм с уклоном в сторону ацидоза, кома или диабетическая кома, состояние после резекции поджелудочной железы. Тяжелые нарушения функции печени. Тяжелые нарушения функции почек. Применение вместе с бозентаном.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении лекарственного средства с другими препаратами его действие может усиливаться или ослабляться, поэтому надо проконсультироваться с врачом относительно применения других препаратов. Глибенкламид метаболизируется с помощью CYP 2C9 и в меньшей степени с помощью CYP 3A4. Это следует учитывать при одновременном приеме глибенкламида с индукторами или ингибиторами CYP 2C9.

Гипогликемические реакции как проявление усиления действия лекарственного средства возможны при одновременном применении с: пероральными гипогликемическими препаратами и инсулином, ингибиторами АПФ (АПФ), анаболическими стероидами и мужскими половыми гормонами

средств, антидепрессантов (такими как флуоксетин, ингибиторы MAO), производными хинолона, хлорамфениколом, кларитромицином, клофибратом и его аналогами, производными кумарина, дизопирамидом, фенфлурамином, миконазолом, флуконазолом, парааминосалициловой кислотой, пентоксифилином (при применении парентерально в высокой дозе), пергексилином, производными пиразолона, пробенецидом, салицилатами, сульфинпиразоном, сульфаниламидами, симпатолитиками (такими как блокаторы β адренорецепторов), препаратами тетрациклинового ряда, тритоквалином, цитостатиками типа циклофосамида.

Прием блокаторов β -адренорецепторов, клонидина, гуанетидина и резерпина может снижать восприятие ранних симптомов гипогликемии.

Гипергликемические реакции как проявление ослабления действия лекарственного средства возможны при одновременном применении с: ацетазоламидом, β -адреноблокаторами, барбитуратами, diazoxidом, диуретиками, глюкагоном, изониазидом, ГКС, слабительными средствами (при хроническом злоупотреблении см. Раздел «Особенности применения»), никотинатом, производными фенотиазина, фенитоином, рифампицином, гормонами щитовидной железы, женскими половыми гормонами (прогестерон, эстрогены), симпатомиметиками. Блокаторы H₂-рецепторов, клонидин и резерпин могут как ослаблять, так и усиливать сахароснижающее действие препарата. В отдельных случаях пентамидин может вызвать тяжелую гипогликемию или гипергликемию. Действие производных кумарина может как усиливаться, так и ослабляться.

У пациентов, получавших глибенкламид одновременно с бозентаном, наблюдался рост частоты повышения уровня печеночных ферментов. Как глибенкламид, так и бозентан подавляют белок-переносчик солей желчных кислот, что приводит к внутриклеточному накоплению цитотоксических солей желчных кислот, поэтому такую комбинацию применять не следует (см. Раздел «Противопоказания»).

Глибенкламид может вызывать повышение концентрации циклоспорина в плазме крови и таким образом усиливать его токсичность. Поэтому в случае одновременного применения этих веществ рекомендуется контролировать концентрацию циклоспорина в плазме крови и корректировать дозу.

Колесевелам связывает глибенкламид и таким образом снижает его всасывание из желудочно-кишечного тракта. Глибенкламид следует принимать не менее чем за 4 часа до применения колесевелама - при таких условиях взаимодействие не наблюдалось.

Другие виды взаимодействий. Острое или хроническое употребление алкоголя может непредсказуемым образом усиливать или ослаблять гипогликемическое

действие глибенкламида.

Особенности применения

Больной должен быть проинформирован о том, что при появлении других расстройств во время терапии глибенкламидом необходимо немедленно проконсультироваться с врачом, а при изменении врача - обратить его внимание на имеющийся сахарный диабет (например, при госпитализации, после несчастного случая, в случае заболевания во время отпуска).

Гипогликемия

Следует обратить внимание пациента на риск гипогликемии при терапии лекарственными средствами, снижающими уровень глюкозы в крови.

Значительные интервалы между приемами пищи, недостаточное обеспечение углеводами, непривычная физическая нагрузка, диарея или рвота повышают риск развития гипогликемии (см. Раздел «Побочные реакции»). Больные с выраженными признаками церебрального склероза и пациенты, которые не соблюдают рекомендации врача, более склонны к развитию гипогликемии. Лекарственные средства, действующие на центральную нервную систему, блокаторы β -адренорецепторов, а также автономные нейропатии могут маскировать симптомы-предвестники гипогликемии.

Несмотря на первоначальные успехи лечения гипогликемии, возможен ее рецидив. Поэтому пациентам следует находиться под наблюдением врача. Тяжелая гипогликемия или длительные эпизоды, которые можно только на короткое время контролировать с помощью обычных количеств сахара, требуют немедленного лечения (см. Раздел «Передозировка»).

Гипергликемия

При несоблюдении плана лечения, при недостаточной сахароснижающей действии лекарственного средства или при наличии стрессовых ситуаций уровень сахара в крови может повышаться. Симптомами гипергликемии могут быть ощущение сильной жажды, сухости во рту, частое мочеиспускание, зуд и/или сухость кожи, грибковые или инфекционные заболевания кожи и снижение работоспособности. В чрезвычайных стрессовых ситуациях (травма, операция, инфекционное заболевание, сопровождающееся повышением температуры тела) может ухудшиться обмен веществ, что может привести к гипергликемии, иногда настолько значительной, что может потребовать временного перевода больного на инсулин.

Слабительные средства

Постоянное злоупотребление слабительными средствами может привести к ухудшению состояния обмена веществ.

Алкоголь

Острое или хроническое злоупотребление алкоголем может непредсказуемым образом усилить или ослабить действие препарата.

Нарушение функции печени и почек и эндокринные расстройства

При применении препарата больным с нарушением функции почек или печени или пониженной функцией щитовидной железы, гипофиза или коры надпочечников необходима особая осторожность.

Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (дефицит Г6ФД)

У больных с дефицитом Г6ФД лечение препаратами сульфонилмочевины, в т. ч. глибенкламидом, может привести к гемолитической анемии, поэтому следует применять только с осторожностью и рассмотреть возможность перевода на препараты, альтернативные производным сульфонилмочевины.

Пациенты пожилого возраста

Возраст 65 лет и старше является фактором риска гипогликемии у пациентов, получающих лечение препаратами сульфонилмочевины. У пациентов пожилого возраста может быть сложно распознать гипогликемию. Начальная и поддерживающая дозы глибенкламида должны быть тщательно скорректированы с целью снижения риска гипогликемии (см. Раздел «Способ применения и дозы»). Назначая лечение для пациентов этой возрастной группы, следует отдавать предпочтение препаратам сульфонилмочевины с более коротким временем действия.

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

Гипогликемия может снижать способность к концентрации внимания и реакции больного. Это может представлять риск во время управления автомобилем или другими механизмами. Больным следует принимать меры безопасности для предотвращения гипогликемии во время управления автомобилем и другими механизмами. Это особенно важно для больных, у которых часто бывают случаи гипогликемии или отсутствует восприятие симптомов-предвестников гипогликемии. В таких случаях надо решить вопрос о целесообразности управления автомобилем.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Лекарственный препарат противопоказан в период беременности. Поскольку пероральные противодиабетические препараты не регулируют уровень глюкозы в крови так же надежно, как инсулин, они совсем не подходят для лечения сахарного диабета в период беременности. Контроль диабета инсулином является терапией выбора в период беременности или кормления грудью. Если это возможно, терапию пероральными гипогликемическими средствами следует отменить и заменить инсулином еще до наступления планируемой беременности.

Период кормления грудью

Поскольку неизвестно, проникает лекарственное средство в грудное молоко, он противопоказан в период кормления грудью.

Пациенткам, которые кормят грудью, следует применять инсулин с целью контроля сахарного диабета или им следует прекратить кормить грудью.

Фертильность

Данных о влиянии глибенкламида на фертильность у человека нет.

Способ применения и дозы

Лекарственное средство следует принимать только по назначению врача и обязательно с коррекцией диеты. Дозировка зависит от результатов исследования состояния обмена веществ (уровень сахара в крови и мочи). Контроль уровня сахара в крови и моче необходим при переходе с другой гипогликемического средства.

Первое и последующие назначение. Терапию начинать с как можно меньших доз, прежде всего это касается больных с повышенной склонностью к гипогликемии или массой тела менее 50 кг. Сначала назначать от ½ до 1 таблетки лекарственного средства (что соответствует 2,5-5 мг глибенкламида) в сутки. При недостаточной коррекции метаболического состояния дозу следует постепенно повышать с интервалами от нескольких дней до одной недели до необходимой суточной терапевтической дозы. Максимальная доза составляет 3 таблетки лекарственного средства (что соответствует 15 мг глибенкламида) в сутки.

Перевод больного по применению других противодиабетических препаратов. Врачу следует переводить пациента на этот препарат очень осторожно и начинать с назначения от ½ таблетки (2,5 мг глибенкламида) до 1 таблетки (5 мг глибенкламида) препарата в сутки.

Подбор дозы. Для больных пожилого возраста, ослабленных больных, при недостаточном питании, а также для пациентов с нарушением функции почек или печени начальную и поддерживающую дозу необходимо уменьшить из-за возможности развития гипогликемии. При снижении массы тела больного или изменении образа жизни может потребоваться корректировка дозы.

Комбинация с другими гипогликемическими средствами. Лекарственное средство можно применять отдельно (монотерапия) или в комбинации с метформином. В отдельных случаях больным с непереносимостью метформина может быть показано дополнительное назначение препаратов группы глитазонами (розиглитазон, пиоглитазон). Лекарственное средство также можно комбинировать с пероральными гипогликемическими препаратами, не стимулируют выброс β-клетками эндогенного инсулина (гуармель или акарбоза). При появлении вторичной неэффективности терапии глибенкламидом (снижение выработки инсулина в результате истощения β-клеток) можно попробовать комбинированное лечение с инсулином. Однако при полном прекращении секреции собственного инсулина организмом показана монотерапия инсулином.

Пациенту следует проконсультроваться с врачом, если у него создается впечатление, что эффект лекарственного средства слишком сильный или слишком слабый.

Больные не должны прекращать лечение или менять дозу или диабетическую диету без консультации с врачом. В случае необходимости изменений пациент должен проконсультроваться с врачом заранее.

Режим и продолжительность лечения. Препарат следует принимать перед едой, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости (лучше стаканом воды). Суточную дозу, которая составляет не более 2 таблеток препарата, следует принять перед завтраком. При суточной дозе, составляющей более 2 таблеток препарата, рекомендуется все количество распределять на один утренний и один вечерний приемы в соотношении 2:1. Очень важно применять препарат каждый раз в одно и то же время. Если больной ошибочно пропустил один прием, не следует следующий прием дополнять более высокой дозой.

Продолжительность лечения зависит от течения болезни. Во время лечения необходимо проводить регулярный контроль уровня глюкозы в крови и мочи

кроме того, рекомендуется дополнительно определять такие параметры, как уровень гликозилированного гемоглобина (HbA1c) и/или фруктозамина, а также другие показатели (например, уровень липидов крови).

Пациенты пожилого возраста. Пациенты в возрасте от 65 лет: начальная и поддерживающая дозы глибенкламида должны быть тщательно скорректированы с целью снижения риска развития гипогликемии. Лечение следует начинать с низкой возможной дозы и при необходимости постепенно ее повышать (см. Раздел «Особенности применения»).

Дети

Глибенкламид не применяется в педиатрической практике.

Передозировка

Острое выраженное передозировки глибенкламида, например применение незначительно повышенных доз в течение длительного времени, может привести к тяжелой пролонгированной гипогликемии, представляет угрозу жизни. При передозировке необходимо тщательное наблюдение до тех пор, пока не будет установлено, что пациенту больше не угрожает опасность. Необходимо учесть, что гипогликемия и ее клинические проявления после временного выздоровления пациента могут возникнуть снова. Значительная передозировка и тяжелые реакции, такие как потеря сознания и другие серьезные неврологические нарушения, следует рассматривать как неотложные состояния, требующие немедленного лечения и госпитализации.

Симптомы передозировки

При умышленном передозировке есть опасность затяжной гипогликемии, с возможными рецидивами после нескольких дней успешного лечения. У пациентов с помутнением сознания может быстро развиваться гипогликемическая кома, проявляется потерей сознания, тахикардией, влажной кожей, гипертермией, двигательным возбуждением, гиперрефлексия, парезами с положительным рефлексом Бабинского.

Терапевтические мероприятия при передозировке

См. раздел «Побочные реакции» по легкой гипогликемии.

В более тяжелых случаях интоксикаций при наличии контакта с пациентом, при отсутствии у него склонности к судорогам, дополнительно к введения глюкозы следует сначала вызвать рвоту или провести промывание желудка.

Если пациент в бессознательном состоянии, следует немедленно начать внутривенное введение глюкозы (40-80 мл 40% раствора глюкозы в виде инъекции с последующей инфузией 5-10% раствора глюкозы).

После этого можно дополнительно ввести 1 мг глюкагона внутримышечно или внутривенно. Если после этого больной не приходит в сознание, такое мероприятие можно повторить, а в дальнейшем может потребоваться проведение интенсивной терапии.

Раствор глюкозы необходимо дозировать осторожно во избежание опасной гипергликемии, особенно для детей, которые нечаянно приняли глибенкламид. В дальнейшем необходим тщательный контроль уровня глюкозы в крови.

Пациентам, которые приняли глибенкламид в количествах, представляющих угрозу для жизни, необходимо проведение детоксикации путем промывания желудка и прием активированного угля при условии, что лекарственное средство применялся не так давно.

При затяжной гипогликемии требуется наблюдение за больным в течение нескольких дней с регулярным контролем уровня глюкозы в крови и проведения инфузионной терапии в случае необходимости.

Побочные реакции

Побочные реакции классифицируются по частоте:

- очень часто (≥ 10);
- часто ($\geq 1/100$, $<1/10$);
- нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$);
- редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$);
- очень редко ($<1/10000$);
- частота неизвестна (частоту невозможно оценить на основании доступных данных).

Гипогликемия

Гипогликемия - самая распространенная побочная реакция при терапии глибенкламидом.

Она может принимать затяжной характер на фоне приема глибенкламида и приводить к тяжелой гипогликемии с запятой, угрожающее жизни больного. В случае очень замаскированного течения гипогликемии, при автономной нейропатии или сопутствующей терапии симпатолитическими средствами (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды

взаимодействий»), типичные симптомы-предвестники гипогликемии могут быть ослаблены или отсутствуют. Клиническая картина тяжелого приступа гипогликемии может напоминать инсульт.

Возможные причины гипогликемии описаны в разделе «Особенности применения».

Гипогликемию определяют как падение уровня глюкозы в крови ниже примерно 50 мг/дл. Для пациента или тех, кто находится рядом с ним, сигналом, свидетельствующим о чрезмерном падении уровня глюкозы в крови, могут быть такие симптомы-предвестники: внезапное потоотделение, учащенное сердцебиение, дрожь, чувство голода, беспокойство, ощущение ползания мурашек в полости рта, бледность кожи, головная боль, сонливость, нарушения сна, тревожность, неуверенность движений, обратные неврологические симптомы (например, нарушение речи и зрения, признаки паралича или нарушения чувствительности).

В случае прогрессирования гипогликемии больной может потерять самоконтроль и сознание. У таких пациентов обычно влажная холодная кожа и они склонны к судорогам.

Больной сахарным диабетом может контролировать легкую гипогликемию путем применения сахара или пищи или напитков, содержащих большое количество сахара. Поэтому им всегда следует носить с собой 20 граммов глюкозы.

Если невозможно сразу устранить гипогликемию, необходимо немедленно вызвать врача.

Другие побочные реакции

Со стороны обмена веществ и питания

Часто: увеличение массы тела.

Очень редко: гипонатриемия, протромбина.

Со стороны органов зрения

Очень редко: в связи с изменением концентрации глюкозы в крови возможные преходящие нарушения зрения и аккомодации, особенно в начале лечения.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто: тошнота, ощущение переполнения/вздутие в желудке, рвота, боль в животе, диарея, отрыжка, металлический привкус во рту.

Эти жалобы имеют преходящий характер и в целом не требуют отмены препарата.

Со стороны печени и желчного пузыря

Очень редко: преходящее повышение уровня АсАТ и АлАТ, щелочной фосфатазы, медикаментозный гепатит, внутрипеченочный холестаз, что, возможно, вызванные аллергической реакцией гиперергической типа клеток печени.

Эти нарушения носят обратимый характер после отмены препарата, но могут привести к печеночной недостаточности, угрожающей жизни.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

Нечасто: зуд, крапивница, узловатая эритема (erythema nodosum), кореподобная или макулопапулезная сыпь, пурпура, повышенная светочувствительность.

Эти реакции повышенной чувствительности носят обратимый характер, но очень редко могут перейти в угрожающие жизни состояния, сопровождающиеся одышкой и снижением артериального давления вплоть до развития шока.

Очень редко: аллергический васкулит, представляет угрозу для жизни; генерализованные реакции повышенной чувствительности, сопровождающиеся кожным высыпанием, артралгией, лихорадкой, протеинурией и желтухой.

При появлении кожных реакций надо сразу обратиться к врачу.

Со стороны системы крови и лимфатической системы

Редко: тромбоцитопения.

Очень редко: лейкопения, эритроцитопения, гранулоцитопения, вплоть до развития агранулоцитоза; панцитопения, гемолитическая анемия. Указанные изменения картины крови имеют обратимый характер после отмены препарата, но очень редко могут представлять угрозу для жизни.

Со стороны иммунной системы

Очень редко: возможна перекрестная аллергия с сульфаниламидами, производными сульфонамидов и пробенецидом.

Со стороны почек и мочевыделительной системы

Очень редко: умеренная диуретическое действие, обратная протеинурия.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после регистрации лекарственного средства играют важную роль. Это позволяет наблюдение за соотношением пользы и риска применения лекарственного средства. Работники здравоохранения должны сообщать о любых подозреваемые побочные реакции через национальную систему фармаконадзора.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 50 штук в контейнере.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Общество с ограниченной ответственностью «Фармацевтическая компания «Здоровье».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 61013, Харьковская обл., город Харьков, улица Шевченко, дом 22.

Источник инструкции

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