Инструкция по применению
Амарил Таблетки 1 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Италия
Производитель: Санофи
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Глимепирид
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 1 мг



Действующее вещество

Глимепирид

Состав

В 1 таблетке содержится: Глимепирид 1 мг Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 68.975 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 4 мг, повидон 25 000 - 0.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг, магния стеарат - 0.5 мг, краситель железа оксид красный (Е 172) - 0.025 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

При сравнении данных, полученных при однократном и многократном (1 раз/сут) приеме глимепирида, не выявлено достоверных различий фармакокинетических параметров, а их вариабельность между разными пациентами была очень низкой. Значимое накопление препарата отсутствует. Всасывание При многократном приеме препарата внутрь в суточной дозе 4 мг Cmax в сыворотке крови достигается примерно через 2.5 ч и составляет 309 нг/мл. Существует линейное соотношение между дозой и Cmax глимепирида в плазме крови, а также между дозой и AUC. При приеме внутрь биодоступность глимепирида составляет 100%. Прием пищи не оказывает существенного влияния на абсорбцию, за исключением незначительного замедления ее скорости. Распределение Для глимепирида характерны очень низкий Vd (около 8.8 л), приблизительно равный Vd альбумина, высокая степень связывания с белками плазмы (более 99%) и низкий клиренс (около 48 мл/мин). Глимепирид выделяется с грудным молоком и проникает через плацентарный барьер. Метаболизм Глимепирид метаболизируется в печени (главным образом при участии изофермента CYP 2 C 9) с образованием 2 метаболитов - гидроксилированного и карбоксилированного производных, которые обнаруживаются в моче и в кале. Выведение T 1/2 при плазменных концентрациях препарата в сыворотке, соответствующих многократному режиму дозирования, составляет приблизительно 5-8 ч. После приема глимепирида в высоких дозах T 1/2 несколько увеличивается. После однократного приема внутрь 58% глимепирида выводится почками и 35% - через кишечник. Неизмененное активное вещество в моче не обнаруживается. T 1/2 гидроксилированного и карбоксилированного метаболитов глимепирида составляли соответственно около 3-5 ч и 5-6 ч. Фармакокинетика в особых клинических случаях Фармакокинетические параметры сходны у пациентов разного пола и различных возрастных групп. У пациентов с нарушениями функции почек (с низким КК) наблюдается тенденция к увеличению клиренса глимепирида и к снижению его средних концентраций в сыворотке крови, что, по всей вероятности, обусловлено более быстрым выведением препарата вследствие более низкого связывания его с белками. Таким образом, у данной категории пациентов не имеется дополнительного риска кумуляции глимепирида.

Показания

Сахарный диабет 2 типа (в качестве монотерапии или в составе комбинированной терапии с метформином или инсулином).

Способ применения и дозы

Как правило, доза препарата Амарил® определяется целевой концентрацией

глюкозы в крови. Должна применяться наименьшая доза, достаточная для достижения необходимого метаболического контроля. Во время лечения препаратом Амарил® необходимо регулярно определять концентрацию глюкозы в крови. Кроме этого рекомендуется регулярный контроль за уровнем гликозилированного гемоглобина. Неправильный прием препарата, например, пропуск приема очередной дозы, никогда не должен восполняться путем последующего приема более высокой дозы. Действия пациента при ошибках при приеме препарата Амарил® (в частности, при пропуске приема очередной дозы или при пропуске приема пищи) или в ситуациях, когда нет возможности принять препарат, должны обговариваться пациентом и врачом заблаговременно. Прием препарата Амарил® Таблетки препарата Амарил® принимают, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости (около 0,5 стакана). При необходимости таблетки препарата Амарил® могут быть разделены вдоль риски на две равные части. Начальная доза и подбор дозы Начальная доза составляет 1 мг глимепирида 1 раз в день. При необходимости суточная доза может быть постепенно (с интервалами в 1-2 недели) увеличена. Рекомендуется увеличение дозы проводить под регулярным контролем концентрации глюкозы в крови и в соответствии со следующим шагом повышения дозы: 1 мг - 2 мг - 3 мг - 4 мг - 6 мг (- 8 мг). Диапазон доз у пациентов с хорошо контролируемым сахарным диабетом Обычно ежедневная доза у пациентов с хорошо контролируемым сахарным диабетом составляет 1-4 мг глимепирида. Ежедневная доза более 6 мг является более эффективной только у небольшого количества пациентов. Режим дозирования Время приема препарата Амарил® и распределение доз в течение дня устанавливается врачом, в зависимости от образа жизни пациента в данное время (время приема пищи, количество физических нагрузок). Обычно, достаточно однократного приема препарата Амарил® в течение суток. Рекомендуется, чтобы в этом случае вся доза препарата Амарил® принималась непосредственно перед полноценным завтраком или в случае, если она не была принята в это время, - непосредственно перед первым основным приемом пищи. Очень важно после приема таблеток препарата Амарил® не пропускать прием пищи. Так как улучшение метаболического контроля ассоциируется с повышением чувствительности к инсулину, в ходе лечения может снижаться потребность в глимепириде. Для того чтобы избежать развития гипогликемии необходимо своевременно снижать дозы или прекращать прием препарата Амарил®. Состояния, при которых также может потребоваться коррекция дозы глимепирида: снижение массы тела у пациента; изменения образа жизни пациента (изменение диеты, времени приема пищи, количества физических нагрузок); возникновение других факторов, которые приводят предрасположенности к развитию гипогликемии или гипергликемии (см. раздел «Особые указания»). Продолжительность лечения Лечение глимепиридом обычно проводится длительно. Перевод пациента с приема другого

гипогликемического средства для приема внутрь на прием препарата Амарил® Не существует точного соотношения между дозами препарата Амарил® и других гипогликемических средств для приема внутрь. Когда другое гипогликемическое средство для приема внутрь заменяется на препарат Амарил® рекомендуется, чтобы процедура его назначения была такой же, как при первоначальном назначении препарата Амарил®, то есть лечение должно начинаться с начальной дозы 1 мг (даже в том случае, если пациента переводят на препарат Амарил® с максимальной дозы другого гипогликемического препарата для приема внутрь). Любое повышение дозы следует проводить поэтапно, с учетом реакции на глимепирид, в соответствии с приведенными выше рекомендациями. Необходимо учитывать силу и продолжительность эффекта предшествующего гипогликемического средства для приема внутрь. Может потребоваться прерывание лечения для того, чтобы избежать какой-либо суммации эффектов, которая может увеличить риск развития гипогликемии. Применение в комбинации с метформином У пациентов с недостаточно контролируемым сахарным диабетом при приеме максимальных суточных доз или глимепирида или метформина может быть начато лечение комбинацией этих двух препаратов. При этом проводившееся ранее лечение или глимепиридом, или метформином продолжается на том же самом уровне доз, а дополнительный прием метформина или глимепирида начинают с низкой дозы, которая затем титруется в зависимости от целевого уровня метаболического контроля вплоть до максимальной суточной дозы. Комбинированная терапия должна начинаться под строгим медицинским наблюдением. Применение в комбинации с инсулином Пациентам с недостаточно контролируемым сахарным диабетом при приеме максимальных суточных доз глимепирида может быть одновременно назначено введение инсулина. В этом случае последняя назначенная пациенту доза глимепирида остается неизменной. При этом лечение инсулином начинается с низких доз, которые постепенно повышаются под контролем концентрации глюкозы в крови. Комбинированное лечение требует тщательного медицинского наблюдения. Применение у пациентов с почечной недостаточностью Имеется ограниченное количество информации по использованию препарата Амарил® у пациентов с почечной недостаточностью. Пациенты с нарушенной функцией почек могут быть более чувствительны к гипогликемическому эффекту глимепирида (см. разделы «Фармакокинетика», «Противопоказания»). Применение у пациентов с печеночной недостаточностью Имеется ограниченное количество информации по использованию препарата Амарил® при печеночной недостаточности (см. раздел «Противопоказания»).

Противопоказания

сахарный диабет 1 типа; диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома и кома; тяжелые нарушения функции печени (отсутствие клинического опыта применения); тяжелые нарушения функции почек, в т.ч. пациенты, находящиеся на гемодиализе (отсутствие клинического опыта применения); беременность; лактация (грудное вскармливание); детский возраст (отсутствие клинического опыта применения); редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция; повышенная чувствительность к компонентам препарата; повышенная чувствительность к другим производным сульфонилмочевины и сульфаниламидным препаратам (риск развития реакций гиперчувствительности).

Применение при беременности и кормлении грудью

Амарил противопоказан к применению при беременности. В случае планируемой беременности или при наступлении беременности женщину следует перевести на инсулинотерапию. Установлено, что глимепирид выделяется с грудным молоком. В период лактации следует перевести женщину на инсулин или прекратить грудное вскармливание.

Побочные действия

Со стороны обмена веществ: Возможна гипогликемия, которая, как и при применении других производных сульфонилмочевины, может быть продолжительной. Симптомы гипогликемии - головная боль, чувство голода, тошнота, рвота, чувство усталости, сонливость, нарушения сна, беспокойство, агрессивность, нарушение концентрации внимания, бдительности и скорости реакций, депрессия, спутанность сознания, речевые расстройства, афазия, зрительные расстройства, тремор, парез, сенсорные нарушения, головокружение, потеря самоконтроля, делирий, церебральные судороги, сонливость или потеря сознания вплоть до комы, поверхностное дыхание, брадикардия. Кроме этого могут возникать проявления адренергической контррегуляции в ответ на гипогликемию, такие как появление холодного липкого пота, беспокойство, тахикардия, артериальная гипертензия, стенокардия, сердцебиение и нарушения сердечного ритма. Клиническая картина тяжелой гипогликемии может напоминать инсульт. Симптомы гипогликемии почти всегда исчезают после ее устранения. Со стороны органа зрения: Возможны (особенно в начале лечения) транзиторные нарушения зрения, обусловленные изменением концентрации глюкозы в крови. Их причиной является временное изменение набухания хрусталиков, зависящее от концентрации глюкозы в крови, и за счет этого изменение показателя преломления хрусталиков. Со стороны пищеварительной системы: Редко - тошнота, рвота, ощущение тяжести или переполнения в эпигастрии, боли в животе, диарея; В отдельных случаях - гепатит, повышение активности печеночных ферментов и/или холестаз и желтуха, которые могут прогрессировать до угрожающей жизни печеночной недостаточности, но могут подвергнуться обратному развитию при отмене препарата. Со стороны системы кроветворения: Редко - тромбоцитопения; В отдельных случаях - лейкопения, гемолитическая анемия, эритроцитопения, гранулоцитопения, агранулоцитоз и панцитопения. При постмаркетинговом применении препарата сообщалось о случаях тяжелой тромбоцитопении с количеством тромбоцитов <10 000/мкл и тромбоцитопенической пурпуре (частота неизвестна). Аллергические реакции: Редко - аллергические и псевдоаллергические реакции, такие как зуд, крапивница, кожная сыпь. Такие реакции почти всегда носят легкую форму, однако могут перейти в тяжелые реакции с одышкой, резким снижением АД, которые иногда прогрессируют вплоть до анафилактического шока; В отдельных случаях - аллергический васкулит. Прочие: В отдельных случаях - гипонатриемия, фотосенсибилизация. При появлении симптомов крапивницы следует немедленно обратиться к врачу.

Передозировка

В особых клинических стрессовых состояниях, таких как травма, хирургические

вмешательства, инфекции, протекающие с фебрильной температурой, возможно ухудшение метаболического контроля у пациентов с сахарным диабетом, и им может потребоваться временный перевод на инсулинотерапию для поддержания адекватного метаболического контроля. В первые недели лечения может возрастать риск развития гипогликемии и поэтому в это время требуется особенно тщательный контроль концентрации глюкозы в крови. К факторам, способствующим риску развития гипогликемии относятся: нежелание или неспособность пациента (более часто наблюдающаяся у пациентов пожилого возраста) к сотрудничеству с врачом; недоедание, нерегулярный прием пищи или пропуски приема пищи; дисбаланс между физическими нагрузками и потреблением углеводов; изменение диеты; употребление алкоголя, особенно в сочетании с пропусками приема пищи; тяжелые нарушения функции почек; тяжелые нарущения функции печени (у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени показан перевод на инсулинотерапию, по крайней мере, до достижения метаболического контроля). передозировка глимепирида; некоторые декомпенсированные эндокринные расстройства, нарушающие углеводный обмен или адренергическую контррегуляцию в ответ на гипогликемию (например некоторые нарушения функции щитовидной железы и переднего отдела гипофиза, недостаточность коры надпочечников); одновременный прием некоторых лекарственных средств (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами); прием глимепирида при отсутствии показаний к его приему. Лечение производными сульфонилмочевины, к которым относится и глимепирид, может привести к развитию гемолитической анемии, поэтому у пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы следует соблюдать особую осторожность при назначении глимипирида и лучше применять гипогликемические средства, не являющиеся производными сульфонилмочевины. В случае наличия вышеперечисленных факторов риска для развития гипогликемии может потребоваться коррекция дозы глимепирида или всей терапии. Это также относится к возникновению интеркуррентных заболеваний во время лечения или изменению образа жизни пациентов. Те симптомы гипогликемии, которые отражают адренергическую контррегуляцию организма в ответ на гипогликемию (см. раздел "Побочное действие"), могут быть слабо выраженными или отсутствовать при постепенном развитии гипогликемии, у пациентов пожилого возраста, у пациентов с нейропатией вегетативной нервной системы или у пациентов, получающих бета-адреноблокаторы, клонидин, резерпин, гуанетидин и другие симпатолитические средства. Гипогликемия может быть быстро устранена при немедленном приеме быстро усваивающихся углеводов (глюкозы или сахарозы). Как и при приеме других производных сульфонилмочевины, несмотря на первоначальное успешное купирование гипогликемии, гипогликемия может возобновиться. Поэтому пациенты должны оставаться под постоянным наблюдением. При тяжелой

гипогликемии дополнительно требуется немедленное лечение и наблюдение врача, а в некоторых случаях - госпитализация пациента. Во время лечения глимепиридом требуется проведение регулярного контроля функции печени и картины периферической крови (особенно количества лейкоцитов и тромбоцитов). Поскольку отдельные побочные действия, такие как: тяжелая гипогликемия, серьезные изменения картины крови, тяжелые аллергические реакции, печеночная недостаточность, могут при определенных обстоятельствах представлять собой угрозу для жизни, в случае развития нежелательных или тяжелых реакций больному необходимо сразу же информировать о них лечащего врача и ни в коем случае не продолжать прием препарата без его рекомендации. Использование в педиатрии Данные по долгосрочной эффективности и безопасности применения препарата у детей отсутствуют. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами В начале лечения, после изменения лечения или при нерегулярном приеме глимепирида может отмечаться обусловленное гипо- или гипергликемией снижение концентрации внимания и скорости психомоторных реакций. Это может отрицательно сказаться на способности к вождению автотранспорта или к управлению различными машинами и механизмами.

Взаимодействие с другими препаратами

Глимепирид метаболизируется при участии изофермента CYP 2 C 9, что следует учитывать при одновременном применении препарата с индукторами (например, рифампицин) или ингибиторами (например, флуконазол) CYP 2 C 9. Потенцирование гипогликемического действия и в некоторых случаях связанное с этим возможное развитие гипогликемии может наблюдаться при сочетании препарата Амарил с одним из следующих препаратов: инсулин, другие гипогликемические средства для приема внутрь, ингибиторы АПФ, анаболические стероиды и мужские половые гормоны, хлорамфеникол, производные кумарина, циклофосфамид, дизопирамид, фенфлурамин, фенирамидол, фибраты, флуоксетин, гуанетидин, ифосфамид, ингибиторы МАО, флуконазол, ПАСК, пентоксифиллин (высокие парентеральные дозы), фенилбутазон, азапропазон, оксифенбутазон, пробенецид, хинолоны, салицилаты, сульфинпиразон, кларитромицин, сульфаниламиды, тетрациклины, тритоквалин, трофосфамид. Уменьшение гипогликемического действия и связанное с этим повышение концентрации глюкозы в крови возможно при сочетании с одним из следующих препаратов: ацетазоламид, барбитураты, ГКС, диазоксид, диуретики, симпатомиметические средства (в т.ч. эпинефрин), глюкагон, слабительные средства (при длительном применении), никотиновая кислота (в высоких дозах), эстрогены и прогестагены, фенотиазины, фенитоин, рифампицин, йодсодержащие гормоны щитовидной железы. Блокаторы гистаминовых Н 2-рецепторов, бета-адреноблокаторы, клонидин и резерпин способны как усиливать, так и уменьшать гипогликемическое действие глимепирида. Под влиянием симпатолитических средств, таких как бета-адреноблокаторы, клонидин, гуанетидин и резерпин, признаки адренергической контррегуляции в ответ на гипогликемию могут уменьшаться или отсутствовать. На фоне приема глимепирида возможно усиление или ослабление действия производных кумарина. Однократное или хроническое употребление алкоголя может как усиливать, так и ослаблять гипогликемическое действие глимепирида. Секвестранты желчных кислот: колесевелам связывается с глимепиридом и уменьшает всасывание глимепирида из ЖКТ. В случае применения глимепирида, по крайней мере, за 4 ч до приема внутрь колесевелама какого-либо взаимодействия не наблюдается. Поэтому глимепирид необходимо принимать, по крайней мере, за 4 ч до приема колесевелама.

Особые указания

В особых клинических стрессовых состояниях, таких как травма, хирургические вмешательства, инфекции, протекающие с фебрильной температурой, возможно ухудшение метаболического контроля у пациентов с сахарным диабетом, и им может потребоваться временный перевод на инсулинотерапию для поддержания

адекватного метаболического контроля. В первые недели лечения может возрастать риск развития гипогликемии и поэтому в это время требуется особенно тщательный контроль концентрации глюкозы в крови. К факторам, способствующим риску развития гипогликемии относятся: нежелание или неспособность пациента (более часто наблюдающаяся у пациентов пожилого возраста) к сотрудничеству с врачом; недоедание, нерегулярный прием пищи или пропуски приема пищи; дисбаланс между физическими нагрузками и потреблением углеводов; изменение диеты; употребление алкоголя, особенно в сочетании с пропусками приема пищи; тяжелые нарушения функции почек; тяжелые нарущения функции печени (у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени показан перевод на инсулинотерапию, по крайней мере, до достижения метаболического контроля). передозировка глимепирида; некоторые декомпенсированные эндокринные расстройства, нарушающие углеводный обмен или адренергическую контррегуляцию в ответ на гипогликемию (например некоторые нарушения функции щитовидной железы и переднего отдела гипофиза, недостаточность коры надпочечников); одновременный прием некоторых лекарственных средств (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами); прием глимепирида при отсутствии показаний к его приему. Лечение производными сульфонилмочевины, к которым относится и глимепирид, может привести к развитию гемолитической анемии, поэтому у пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы следует соблюдать особую осторожность при назначении глимипирида и лучше применять гипогликемические средства, не являющиеся производными сульфонилмочевины. В случае наличия вышеперечисленных факторов риска для развития гипогликемии может потребоваться коррекция дозы глимепирида или всей терапии. Это также относится к возникновению интеркуррентных заболеваний во время лечения или изменению образа жизни пациентов. Те симптомы гипогликемии, которые отражают адренергическую контррегуляцию организма в ответ на гипогликемию (см. раздел "Побочное действие"), могут быть слабо выраженными или отсутствовать при постепенном развитии гипогликемии, у пациентов пожилого возраста, у пациентов с нейропатией вегетативной нервной системы или у пациентов, получающих бета-адреноблокаторы, клонидин, резерпин, гуанетидин и другие симпатолитические средства. Гипогликемия может быть быстро устранена при немедленном приеме быстро усваивающихся углеводов (глюкозы или сахарозы). Как и при приеме других производных сульфонилмочевины, несмотря на первоначальное успешное купирование гипогликемии, гипогликемия может возобновиться. Поэтому пациенты должны оставаться под постоянным наблюдением. При тяжелой гипогликемии дополнительно требуется немедленное лечение и наблюдение врача, а в некоторых случаях - госпитализация пациента. Во время лечения глимепиридом требуется проведение регулярного контроля функции печени и картины

периферической крови (особенно количества лейкоцитов и тромбоцитов). Поскольку отдельные побочные действия, такие как: тяжелая гипогликемия, серьезные изменения картины крови, тяжелые аллергические реакции, печеночная недостаточность, могут при определенных обстоятельствах представлять собой угрозу для жизни, в случае развития нежелательных или тяжелых реакций больному необходимо сразу же информировать о них лечащего врача и ни в коем случае не продолжать прием препарата без его рекомендации. Использование в педиатрии Данные по долгосрочной эффективности и безопасности применения препарата у детей отсутствуют. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами В начале лечения, после изменения лечения или при нерегулярном приеме глимепирида может отмечаться обусловленное гипо- или гипергликемией снижение концентрации внимания и скорости психомоторных реакций. Это может отрицательно сказаться на способности к вождению автотранспорта или к управлению различными машинами и механизмами.