Инструкция по применению
Галвус Таблетки 50 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Россия
Производитель: Новартис Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Вилдаглиптин
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 50 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Вилдаглиптин

Состав

В 1 таблетке содержится: Вилдаглиптин 50 мгВспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 95.68 мг, лактоза безводная - 47.82 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 4 мг, магния стеарат - 2.5 мг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

ВсасываниеПри приеме внутрь натощак вилдаглиптин быстро всасывается, а его максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) достигается через 1.75 часа после приема. При одновременном приеме с пищей скорость абсорбции вилдаглиптина снижается незначительно: отмечается уменьшение Cmax на 19% и увеличение времени ее достижения до 2,5 часов. Однако прием пищи не оказывает влияния на степень абсорбции и площадь под кривой концентрация-время (AUC).Вилдаглиптин быстро всасывается, а его абсолютная биодоступность после приема внутрь составляет 85%. Cmax и AUC в терапевтическом диапазоне доз увеличиваются примерно пропорционально дозе.РаспределениеСтепень связывания вилдаглиптина с белками плазмы крови низкая (9.3%). Вилдаглиптин распределяется равномерно

между плазмой крови и эритроцитами. Распределение вилдаглиптина происходит, предположительно, экстраваскулярно, объем распределения в равновесном состоянии после в/в введения (Vss) составляет 71 л.МетаболизмОсновным путем выведения вилдаглиптина является биотрансформация. В организме человека 69% дозы препарата подвергается биотрансформации. Основной метаболит - LAY151 (57% дозы) фармакологически неактивен и является продуктом гидролиза циано-компонента. Около 4% дозы препарата подвергаются амидному гидролизу.В доклинических исследованиях отмечается положительное влияние ДПП-4 на гидролиз вилдаглиптина. Вилдаглиптин метаболизируется без участия изоферментов цитохрома Р450. Вилдаглиптин не является субстратом изоферментов Р450 (CYP), не ингибирует и не индуцирует изоферменты цитохрома Р450.ВыведениеПосле приема препарата внутрь около 85% дозы выводится почками и 15% - через кишечник. Почечная экскреция неизмененного вилдаглиптина составляет 23%. При в/в введении средний период полувыведения (T1/2) достигает 2 ч, общий плазменный клиренс и почечный клиренс вилдаглиптина составляют 41 л/ч и 13 л/ч соответственно. T1/2 после приема внутрь составляет около 3 ч, независимо от дозы.Фармакокинетика в особых случаяхПол, индекс массы тела и этническая принадлежность не оказывают влияния на фармакокинетику вилдаглиптина.Пациенты с нарушением функции печениУ пациентов с нарушением функции печени легкой и средней степеней тяжести (6-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) после однократного применения препарата отмечается снижение биодоступности вилдаглиптина на 20% и 8% соответственно. У пациентов с нарушением функции печени тяжелой степени (10-12 баллов по шкале Чайлд-Пью) биодоступность вилдаглиптина повышается на 22%. Увеличение или уменьшение максимальной биодоступности вилдаглиптина, не превышающее 30%, не является клинически значимым. Корреляции между степенью тяжести нарушений функции печени и биодоступностью препарата не выявлено.Пациенты с нарушением функции почекУ пациентов с нарушением функции почек легкой, средней или тяжелой степени AUC вилдаглиптина увеличивалась по сравнению со здоровыми добровольцами в 1,4, 1,7 и 2 раза соответственно. AUC метаболита LAY151 увеличивалась в 1.6, 3.2, и 7.3 раза, а метаболита BQS867 - в 1.4, 2.7, и 7.3 раза у пациентов с нарушением функции почек легкой, средней и тяжелой степеней соответственно. Ограниченные данные у пациентов с терминальной стадией хронической болезни почек (ХБП) указывают на то, что показатели данной группы схожи с таковыми у пациентов с нарушением функции почек тяжелой степени. Концентрация метаболита LAY151 у пациентов с терминальной стадией ХБП увеличивалась в 2-3 раза по сравнению с концентрацией у пациентов с нарушением функции почек тяжелой степени.При применении препарата у пациентов с нарушением функции почек может потребоваться коррекция дозы.Выведение вилдаглиптина при гемодиализе ограничено (через 4 ч после однократного приема

составляет 3% при длительности процедуры более 3-4 ч).Применение у пациентов в возрасте ≥65 летМаксимальное увеличение биодоступности препарата на 32% (увеличение Cmax на 18%) у пациентов старше 70 лет не является клинически значимым и не влияет на ингибирование ДПП-4.Применение у пациентов в возрасте ≤18 летФармакокинетические особенности вилдаглиптина у детей и подростков младше 18 лет не установлены.

Показания

Сахарный диабет 2 типа (в сочетании с диетотерапией и физическими упражнениями): - в качестве монотерапии в случае неэффективности диетотерапии и физических упражнений у пациентов с противопоказанием к применению метформина или в случае неэффективности метформина;- в комбинации с метформином в качестве начальной медикаментозной терапии при недостаточной эффективности диетотерапии и физических упражнений;- в составе двухкомпонентной комбинированной терапии с метформином, производным сульфонилмочевины, тиазолидиндионом или с инсулином в случае неэффективности диетотерапии, физических упражнений и монотерапии этими препаратами;- в составе тройной комбинированной терапии: в комбинации с производными сульфонилмочевины и метформином, у пациентов, ранее получавших терапию производными сульфонилмочевины и метформином на фоне диетотерапии и физических упражнений и не достигших адекватного контроля гликемии;- в составе тройной комбинированной терапии: в комбинации с инсулином и метформином, у пациентов, ранее получавших инсулин и метформин на фоне диетотерапии и физических упражнений и не достигших адекватного контроля гликемии.

Способ применения и дозы

Дозу препарата Галвус следует подбирать индивидуально в зависимости от эффективности и переносимости.Рекомендуемая доза препарата Галвус 50 мг 1 или 2 раза/сут. Максимальная суточная доза препарата составляет 100 мг.Дозу 50 мг/сут следует принимать 1 раз в день утром, дозу 100 мг/сут следует делить на 2 приема - по 50 мг утром и вечером. В случае пропуска приема препарата следует принять пропущенную дозу как можно скорее. При этом следует избегать принятия удвоенной дозы в один день.Препарат Галвус принимают внутрь независимо от приема пищи. Рекомендуемая доза препарата в монотерапии или в составе комбинированной терапии с метформином, тиазолидиндионом или инсулином (в комбинации с метформином или без метформина), составляет 50 мг или 100 мг в сутки. Рекомендуемая доза препарата Галвус в составе двойной комбинированной терапии с препаратами сульфонилмочевины составляет 50 мг 1 раз/сут утром. В этой популяции пациентов эффективность препарата Галвус в дозе 100 мг/сут была сходной с таковой в дозе 50 мг/сут.Рекомендованная доза препарата Галвус в составе тройной комбинированной терапии (вилдаглиптин + производные сульфонилмочевины + метформин) составляет 100 мг/сут.Если цели гликемического контроля не достигнуты на фоне применения максимальной суточной дозы 100 мг, следует рассмотреть возможность добавления к терапии препаратом Галвус других гипогликемических препаратов, таких, как метформин, производные сульфонилмочевины, тиазолидиндион или инсулин.Пациенты с нарушениями функции почекУ пациентов с нарушением функции почек легкой степени (СКФ >60 мл/мин/1.73 м2) и средней степени с СКФ 50-60 мл/мин/1.73 м2 не требуется коррекции режима дозирования препарата. У пациентов с нарушением функции почек средней степени с СКФ 30-50 мл/мин/1,73 м2 и тяжелой степени (СКФ <30 мл/мин/1.73 м2), включая терминальную стадию ХБП у пациентов, находящихся на гемодиализе или проходящих процедуру гемодиализа, препарат следует применять в дозе 50 мг 1 раз /сут.Пациенты в возрасте ⩾ 65 летУ пациентов пожилого возраста не требуется коррекции режима дозирования препарата Галвус.Пациенты в возрасте ⩽ 18 летПоскольку опыта применения препарата Галвус у детей и подростков младше 18 лет нет, не рекомендуется применять препарат у пациентов данной категории.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к вилдаглиптину и любым другим компонентам препарата;- наследственная непереносимость галактозы, недостаточность лактазы, глюкозо- галактозная мальабсорбция;- беременность, грудное вскармливание (в связи с недостатком соответствующих данных);- сахарный диабет 1 типа;- острый или хронический метаболический ацидоз (включая диабетический кетоацидоз в сочетании с комой или без таковой). Диабетический кетоацидоз должен корректироваться инсулинотерапией. Лактоацидоз (в т.ч. и в анамнезе);- нарушения функции печени, включая пациентов с повышенной активностью печеночных ферментов (АЛТ или АСТ в 3 и более раз выше верхней границы нормы 3хВГН);- хроническая сердечная недостаточность (ХСН) IV функционального класса (ФК) по функциональной классификации Нью-Йоркской кардиологической ассоциации (NYHA) (ввиду отсутствия данных клинических исследований о применении вилдаглиптина у этой группы пациентов);- детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения препарата не установлены).С осторожностьюРекомендуется с осторожностью применять препарат Галвус у пациентов с острым панкреатитом в анамнезе.Поскольку опыт применения препарата Галвус у пациентов с терминальной стадией ХБП, находящихся на гемодиализе или проходящих процедуру гемодиализа, ограничен, препарат рекомендуется применять с осторожностью у данной категории пациентов.Поскольку данные о применении вилдаглиптина у пациентов с ХСН III ФК по классификации NYHA ограничены и не позволяют сделать окончательный вывод, рекомендуется с осторожностью применять препарат Галвус у пациентов данной категории.

Применение при беременности и кормлении грудью

Достаточных данных по применению препарата Галвус у беременных нет, в связи с чем препарат противопоказан во время беременности.В доклинических исследованиях была выявлена репродуктивная токсичность при применении в высоких дозах, потенциальный риск для человека неизвестен.Препарат Галвус противопоказан в период грудного вскармливания, поскольку неизвестно, проникает ли вилдаглиптин в грудное молоко у человека.

Побочные действия

При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут частота отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций (0.2% или 0.1% соответственно) была не выше таковой в группе плацебо (0.6%) или препарата сравнения (0.5%).На фоне монотерапии препаратом Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут частота развития гипогликемии без увеличения степени тяжести состояния составляла 0.5% (2 пациента

из 409) и 0.3% (4 из 1082) соответственно, что сопоставимо с препаратом сравнения и плацебо (0.2%).Инфекционные и паразитарные заболевания: очень редко - инфекции верхних дыхательных путей, назофарингит.Нарушения со стороны нервной системы: часто - головокружение; нечасто - головная боль.Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто - запор.Нарушения со стороны сосудов: нечасто - периферические отеки.Долгосрочные клинические исследования продолжительностью до 2 лет не выявили каких-либо дополнительных отклонений профиля безопасности или непредвиденных рисков при применении вилдаглиптина в монотерапии.При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут в комбинации с метформиномПри применении препарата Галвус в дозе 50 мг/сут в комбинации с метформином частота отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций составляла 0.4% (в группах вилдаглиптин (50 мг 2 раза/сут) + метформин и плацебо + метформин случаев отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций не отмечалось).При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут в комбинации с метформином гипогликемия отмечалась в 0.9% и 0.5% случаев соответственно (в группе плацебо + метформин - 0.4%). В группе применения препарата Галвус не наблюдалось развития гипогликемии тяжелой степени.Комбинированная терапия вилдаглиптин + метформин не влияла на массу тела пациентов.Нарушения со стороны нервной системы: часто - тремор, головокружение, головная боль.Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - тошнота.Долгосрочные клинические исследования продолжительностью до 2 лет не выявили каких-либо дополнительных отклонений профиля безопасности или непредвиденных рисков при применении вилдаглиптина в комбинации с метформином.Изучение применения комбинации вилдаглиптина и метформина в качестве стартовой терапии при сахарном диабете 2 типа не выявило отклонений профиля безопасности или непредвиденных рисков.При применении препарата Галвус в дозе 50 мг/сут в комбинации с производными сульфонилмочевиныПри применении препарата Галвус в дозе 50 мг/сут в комбинации с глимепиридом частота отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций составляла 0.6% (по сравнению с 0% в группе глимепирид + плацебо).Частота развития гипогликемии у пациентов, получавших препарат Галвус в дозе 50 мг/сут вместе с глимепиридом, составила 1.2% (по сравнению с 0.6% в группе плацебо + глимепирид). В группе применения препарата Галвус не наблюдалось развития гипогликемии тяжелой степени.При применении препарата Галвус в рекомендованной дозе (50 мг/сут) в комбинации с глимепиридом не отмечалось увеличения массы тела.Инфекционные и паразитарные заболевания: очень редко - назофарингит.Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто - запор.Нарушения со стороны нервной системы: часто - тремор, головокружение, головная боль, астения.При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут в комбинации с производными

тиазолидиндионаПри применении препарата Галвус в дозе 50 мг/сут в комбинации с пиоглитазоном частота отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций составляла 0.7% (в группах вилдаглиптин 100 мг/сут + пиоглитазон и плацебо + пиоглитазон случаев отмены терапии в связи с развитием нежелательных реакций не отмечалось).При применении препарата Галвус в дозе 50 мг/сут в комбинации с пиоглитазоном в дозе 45 мг развития гипогликемии не отмечалось; в группе вилдаглиптин (в дозе 50 мг 2 раза в сутки) + пиоглитазон (в дозе 45 мг) отмечалось развитие гипогликемии в 0.6% случаев, а у пациентов, получавших плацебо + пиоглитазон в дозе 45 мг, - в 1.9% случаев. В группе применения препарата Галвус не наблюдалось развития гипогликемии тяжелой степени. Среднее увеличение массы тела по сравнению с плацебо у пациентов, получавших препарат Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут вместе с пиоглитазоном, составляло +0.1 кг или +1.3 кг соответственно. При добавлении препарата Галвус в дозе 50 мг 1 или 2 раза/сут к пиоглитазону в дозе 45 мг/сут частота развития периферических отеков составляла 8.2% и 7% соответственно (по сравнению с 2.5% на фоне монотерапии пиоглитазоном). Однако при начальной комбинированной терапии вилдаглиптином в дозе 50 мг 1 или 2 раза /сут вместе с пиоглитазоном в дозе 45 мг/сут развитие периферических отеков наблюдалось у 3.5 % или 6.1% пациентов соответственно (по сравнению с 9.3% на фоне монотерапии пиоглитазоном в дозе 30 мг/сут).Нарушения со стороны сосудов: часто - периферические отеки.Нарушения со стороны обмена веществ и питания: часто - увеличение массы тела.При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 2 раза /сут в комбинации с инсулином (с метформином или без него)При применении препарата в комбинации с инсулином (в комбинации с метформином или без метформина) частота отмены терапии вследствие развития побочных эффектов была равна 0.3%, в группе терапии вилдаглиптином, в группе плацебо случаев отмены терапии не было.При применении препарата в комбинации с инсулином (в комбинации с метформином или без метформина) не отмечалось увеличения риска развития гипогликемии по сравнению с комбинацией плацебо + инсулин (14% в группе вилдаглиптина и 16.4% в группе плацебо).У 2 пациентов в группе вилдаглиптина и у 6 пациентов в группе плацебо развилась гипогликемия тяжелой степени.На момент завершения исследования препарат не оказывал влияния на среднюю массу тела (масса тела увеличена на +0.6 кг по сравнению с исходной в группе вилдаглиптина, а в группе плацебо осталась неизменной).Нарушения со стороны нервной системы: часто - головная боль, неизвестно - астения.Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - тошнота, гастроэзофагеальный рефлюкс; нечасто - диарея, метеоризм.Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто - озноб.Нарушения со стороны обмена веществ и питания: часто - гипогликемия.При применении препарата Галвус в дозе 50 мг 2 раза/сут в комбинации с препаратами сульфонилмочевины и метформиномСлучаев отмены

препарата, связанных с НЯ в группе комбинированной терапии вилдаглиптином, метформином и глимепиридом, отмечено не было. В группе комбинированной терапии плацебо, метформином и глимепиридом частота НЯ составила 0.6%. Гипогликемия отмечалась часто в обеих группах (5.1% в группе комбинированной терапии вилдаглиптином, метформином и глимепиридом и 1.9% в группе комбинированной терапии плацебо, метформином и глимепиридом). В группе вилдаглиптина отмечен один эпизод гипогликемии тяжелой степени.На момент завершения исследования значимого влияния на массу тела выявлено не было (+0.6 кг в группе вилдаглиптина и -0.1 кг в группе плацебо).Нарушения со стороны нервной системы: часто - головокружение, тремор, астения.Нарушения со стороны обмена веществ и питания: часто - гипогликемия.Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: часто - гипергидроз.Пострегистрационные исследованияВо время проведения пострегистрационных исследований были выявлены следующие побочные реакции (поскольку сообщения получены в добровольном порядке от популяции неопределенного размера, достоверно определить частоту развития данных НЯ не представляется возможным, в связи с чем они классифицированы как частота неизвестна): гепатит (обратим при прекращении терапии), крапивница, панкреатит, буллезное и эксфолиативное поражение кожи, артралгия, в редких случаях выраженная, миалгия, повышение активности печеночных ферментов.Пациента необходимо предупредить, что, если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или если замечены любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, следует сообщить об этом врачу.

Передозировка

Вилдаглиптин хорошо переносится при применении в дозе до 200 мг/сут.При применении препарата в дозе 400 мг/сут может наблюдаться боль в мышцах, редко - легкие и транзиторные парестезии, лихорадка, отеки и транзиторное повышение активности липазы (выше ВГН в 2 раза). При увеличении дозы вилдаглиптина до 600 мг/сут возможно развитие отеков конечностей, сопровождающихся парестезиями и повышением активности КФК, С-реактивного белка и миоглобина, активности АСТ. Все симптомы передозировки и изменения лабораторных показателей обратимы после прекращения применения препарата.Выведение препарата из организма с помощью диализа маловероятно. Однако основной гидролизный метаболит вилдаглиптина (LAY151) может быть удален из организма путем гемодиализа.

Взаимодействие с другими препаратами

Вилдаглиптин обладает низким потенциалом лекарственного взаимодействия. Поскольку вилдаглиптин не является субстратом ферментов цитохрома P450 (CYP), а также не ингибирует и не индуцирует эти ферменты, взаимодействие вилдаглиптина с лекарственными препаратами, которые являются субстратами, ингибиторами или индукторами P450 (CYP), маловероятно. При одновременном применении вилдаглиптин также не влияет на скорость метаболизма препаратов, являющихся субстратами ферментов: CYP1A2, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6, CYP2E1 и CYP3A4 /5. Клинически значимого взаимодействия вилдаглиптина с препаратами, наиболее часто используемыми при лечении СД 2 типа (глибенкламидом, пиоглитазоном, метформином) или обладающими узким терапевтическим диапазоном (амлодипином, дигоксином, рамиприлом, симвастатином, валсартаном, варфарином) не установлено. Тиазиды, ГКС, препараты гормонов щитовидной железы, симпатомиметики могут снижать гипогликемическое действие вилдаглиптина, как и других пероральных противодиабетических препаратов.Частота развития ангионевротического отека была выше при одновременном применении вилдаглиптина с ингибиторами АПФ, при этом была сходной с таковой в контрольной группе. В большинстве случаев ангионевротический отек был средней степени тяжести и разрешался самостоятельно в ходе продолжения терапии вилдаглиптином.

Особые указания

В доклинических исследованиях при применении в дозах, в 200 раз превышающих рекомендуемые для человека, препарат не вызывал нарушений фертильности.При необходимости инсулинотерапии препарат Галвус применяют только в комбинации с инсулином. Препарат противопоказан у пациентов с сахарным диабетом 1 типа или для лечения диабетического кетоацидоза.Сердечная недостаточностьПоскольку данные о применении вилдаглиптина у пациентов с ХСН III ФК по классификации NYHA (см. Таблицу 1, приведенную ниже) ограничены и не позволяют сделать окончательный вывод, рекомендуется с осторожностью применять препарат Галвус у пациентов данной категории.Не рекомендуется применение вилдаглиптина у пациентов с ХСН IV ФК по классификации NYHA, ввиду отсутствия данных клинических исследований о применении вилдаглиптина у пациентов этой группы.

Условия хранения

Беречь от детей