



ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ 11-0907 / 19.10.07
Одобрено: 4/7.08.07

GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg таблетки

ГЛИБЕНКЛАМИД СОФАРМА 5 mg таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа лекарствено вещество *glibenclamide* 5 mg.

За помощни вещества: виж т. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Неинсулинозависим тип диабет (тип 2, диабет при възрастни), който не може да бъде контролиран само с диета, физическа активност и намаляване на телесното тегло.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Терапията с глибенкламид се провежда при стриктно прецизиране на дозировката в съответствие с нивата на глюкозата в кръвта и урината.

Лечението се започва с ниски дози - половин таблетка (2,5 mg) сутрин преди закуска, като постепенно се увеличава през седмица в зависимост от стойностите на глюкозата в серума и урината. Ако се получи задоволителна компенсация, тази доза може да се прилага като поддържаща терапия. При недостатъчен ефект дозата се повишава на 1 или 1,5 до 2 таблетки дневно, приети сутрин преди закуска. Максималната денонощна доза не трябва да надвишава 3 таблетки - 15 mg (в редки случаи до 20 mg). Дози над 10 mg дневно може да бъдат разделени на 2 приема - 2 таблетки се приемат сутрин преди закуска, останалото количество - преди вечеря.

Продуктът може да се прилага непосредствено след друго предшестващо антидиабетно лечение. Може да се комбинира с инсулин, метформин, акарбоза.

Деца

Липсват достатъчно данни за дозировката и ефикасността на продукта, тъй като диабет тип-2 е изключително рядък при деца.



Възрастни (над 65 г.)

Възрастните пациенти са по-податливи на развитие на хипогликемия. Препоръчва се започване на терапията с доза от 2,5 mg и редовно мониториране на глюкозата в кръвта и урината. При необходимост, дозата се увеличава през седмица с 2,5 mg.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество, други сулфанилурейни продукти или към някое от помощните вещества;
- Инсулин-зависим захарен диабет (тип 1, ювенилен тип);
- Абсолютна вторична резистентност към глибенкламид при диабет тип 2;
- Съдово-дегенеративни усложнения на диабета (коронарна микроангиопатия и инфаркт на миокарда);
- Диабетна нефропатия;
- Тежка метаболитна ацидоза, особено с прекома или кома;
- Бъбречна недостатъчност (креатининов клирънс < 30 мл/мин);
- Тежки нарушения в чернодробната функция;
- Бременност и лактация;
- Резекция на панкреаса.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Лечението с глибенкламид трябва да се осъществява при редовно проследяване на нивата на глюкоза в кръвта и урината.

- Глибенкламид има дълъг плазмен полуживот, поради което употребата му е свързана с повишен риск от развитие на хипогликемия при пациенти с бъбречни и чернодробни увреждания.

- Гладуващи, изтощени хора в увредено общо състояние, болни с надбъбречна недостатъчност и хипопитуитаризъм са особено чувствителни към хипогликемичното действие на пероралните антидиабетни продукти, включително и глибенкламид.



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

- Препоръчва се повишено внимание при употреба от възрастни пациенти, при които съществува вероятност от развитие на потенциално тежки и продължителни хипогликемии.
- Нискокалорична, бедна на въглехидрати диета, както и значителни физически натоварвания може да провокират хипогликемия по време на лечение с глибенкламид.
- При прилагането на продукта съществува възможност от развитие на вторична резистентност, при която кръвната захар не се понижава дори при максимално дозиране. В голяма част от случаите се касае за лъжлива резистентност. Тя се дължи на неспазване на диетата, значително наддаване на тегло и натрупване на мастна тъкан, което предизвиква периферна инсулинова резистентност. При отстраняване на тези неблагоприятни фактори, най-често чувствителността към действието на продукта се възстановява.
- При лечение с глибенкламид е необходимо да се избягва консумацията на алкохол, поради опасност от проява на непоносимост.
- Продуктът съдържа като помощно вещество пшенично нишесте, което може да представлява опасност за хора с глутенова ентеропатия.
- В продукта се съдържа лактоза като помощно вещество. Не е подходящ за лица с лактазна недостатъчност, галактоземия или глюкозо-лактозен малабсорбционен синдром.
- Кармоизин (E 122), който се съдържа като помощно вещество в продукта, може да причини алергичен тип реакции, включително астма. Рискът от прояви на свръхчувствителност е по-голям при пациенти, свръхчувствителни към аспирин.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Лекарствени взаимодействия, в резултат на които се потенцира действието на глибенкламид:

- Следните лекарствени продукти изместват глибенкламид от свързането му с плазмените протеини, в резултат на което се повишава плазмената му концентрация: салицилати, фенилбутазон, сулфонамиди,



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

перорални кумаринови антикоагуланти, хепарин, трициклични антидепресанти.

- Лекарствени продукти, които инхибират лекарство-метаболизиращите ензимни системи в черния дроб, забавят метаболизирането на глибенкламид и едновременното им приложение може да доведе до развитие на хипогликемия: хлорамфеникол, кумаринови антикоагуланти, циметидин и други H₂-блокери, алфа-метилдопа.

- Засилен хипогликемичен ефект може да се наблюдава при едновременно приложение на глибенкламид с алопуринол, фибрати, пробенецид в резултат на конкурентното им взаимодействие на ниво бъбречна тубулна екскреция.

- Продукти, които намаляват нуждите от инсулин, стимулират инсулиновата секреция или понижават кръвната захар, могат да усилят хипогликемичното действие на глибенкламид – инсулин и други перорални антидиабетни продукти (метформин и акарбоза), АСЕ-инхибитори, MAO-инхибитори, тетрациклини.

- Глибенкламид не трябва да се прилага едновременно с миконазол или кетоконазол, поради възможността от настъпване на тежка хипогликемия, стигаща до кома.

- Бета-блокери може да маскират продромалните симптоми на хипогликемия; съществува възможност неселективните бета-блокери да увеличат честотата и тежестта на хипогликемията при едновременно приложение с глибенкламид.

- Лекарствени взаимодействия, в резултат на които се отслабва действието на глибенкламид:

- Едновременното приложение на глибенкламид с фенитоин, рифампицин, барбитурати намалява терапевтичния му ефект в резултат на засиленото му елиминиране.

- Едновременното приложение с глюкагон, диазоксид, гиазидни диуретици, кортикостероиди, перорални контрацептиви, хлорпромазин,



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

адреналин, салбутамол, тербуталин, които притежават собствено диабетогенно действие и/или антагонизират хипогликемичния ефект на глибенкламид: отслабва терапевтичния му ефект.

- Алкохол – при приемане на малко количество алкохол на гладно при едновременна употреба на глибенкламид се наблюдава понижаване на кръвната захар повече от очакваното. Малки количества алкохол по време на хранене обикновено не водят до хипогликемични реакции, но могат да причинят зачервяване (флашинг) на лицето, ръцете и врата. Не се препоръчва употребата на алкохол или медикаменти, съдържащи алкохол по време на лечение с глибенкламид поради риск от хипогликемия.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност:

Глибенкламид преминава плацентарната бариера. Употребата на продукта по време на бременност е противопоказана.

При планиране на бременност, както и по време на бременност, с цел да се осигури пълна компенсация на съществуващия диабет, лечението се провежда с инсулин, дори и при бременни с малки отклонения в глюкозния толеранс.

Лактация:

Тъй като глибенкламид се екскретира с майчиното мляко е необходимо кърменето да се преустанови.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни за неблагоприятен ефект на глибенкламид върху способността за шофиране и работа с машини. Но тези дейности могат да бъдат нарушени като последица от хипогликемия, настъпила в резултат на неадекватен гликемичен контрол в началото на лечението, при промяна в лечението или диетичния режим.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-честата нежелана реакция при приложение на глибенкламид е развитие на хипогликемия. Основни причини за това са предозиране, взаимодействие с други лекарствени продукти, пропуснато хранене, грешка в диетата, употреба на



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

алкохол, при възрастни пациенти, остри инфекции, стрес, травма. В отделни случаи може да бъде тежка, продължителна, с потенциално фатален изход.

Нарушения на кръвоносната и лимфната система: левкопения, тромбоцитопения, апластична анемия, агранулоцитоза, хемолитична анемия, обратими при прекратяване на лечението.

Нарушения на имунната система: реакциите на свръхчувствителност са редки – кожни обриви, сърбеж, фоточувствителност, зачервяване на лицето, болки в ставите, втрисане. Възможни са, макар и рядко, генерализирани реакции на свръхчувствителност - erythema multiforme, синдром на Stevens-Johnson, ексфолиативен дерматит, еритема нодозум.

Нарушения на окото: влошено зрение, нарушение на акомодацията. Тези симптоми са преходни, изчезват след спиране на лечението.

Стомашно-чревни нарушения: рядко се наблюдава гадене, повръщане, диария, безапетитие, метален вкус в устата. Обикновено тези прояви са слабо изразени и дозо-зависими. В отделни случаи е възможно да има увеличен апетит и наддаване на теглото.

Хепато-билиарни нарушения: рядко - преходно повишаване на трансаминазите, холестатична жълтеница.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища: описани са отделни случаи на протеинурия и леко засилено диуретично действие.

4.9 Предозиране

Симптоми

Основен симптом при предозиране е развитието на хипогликемия. Нейни характерни прояви са силен, неудържим глад, изпотяване, тахикардия, тремор, безпокойство, нарушение на съня, депресия, раздразнителност, неуверена походка, нарушения на говора и зрението, промени в съзнанието, понякога до кома. Нелекуваната хипогликемия може да доведе до трайни неврологични нарушения и да бъде опасна за живота на пациента.

Терапия



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

Лекостепенна хипогликемия се коригира с перорално приемане на захар, плодови сокове или подсладени течности. При тежка хипогликемия се преминава към венозни вливания на глюкозо-съдържащи разтвори.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

Фармакотерапевтична група: перорални средства, понижаващи кръвната глюкоза, сулфонамиди, урейни производни, АТС код А10ВВ01.

5.1 Фармакодинамични свойства

Глибенкламид е продукт от втора генерация на сулфонилурейните антидиабетни лекарства. Притежава мощен и продължителен антихипергликемичен ефект.

Глибенкламид стимулира инсулиновото отделяне не само ин виво, но и ин витро, без да има директен ефект върху инсулиновия синтез. Той удължава втората фаза на инсулиновата секреция и в по-малка степен първата фаза. Увеличава освобождаването на инсулин от бета клетките на панкреаса, като инхибира АТР-калиевите канали върху мембраната на бета клетките на панкреаса, а също така и калиевия рефлукс, което води до деполяризация, калциев инфлукс и активиране на калциево-калмодулин свързващата киназа. Редуцира чернодробната продукция на глюкоза, като увеличава фруктозо-2-6-дифосфатазата (ключов ензим, засилващ гликолизата и намаляващ гликонеогенезата), като същевременно инхибира липолизата и увеличава чувствителността на бета клетката към глюкозата.

Глибенкламид увеличава броя, по-рядко афинитета, на инсулиновите рецептори на ниво таргетни органи. При по-продължително лечение с глибенкламид се наблюдава усилено натрупване на гранули в бета клетките и увеличаване на цитоплазмените протеини в тях.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция: Глибенкламид се резорбира бързо и пълно в стомашно-чревния тракт.

Разпределение: След перорално приложение, глибенкламид показва бионаличност над 90 %. Максимални плазмени концентрации се установяват между 2 и 4 час. С плазмените протеини се свързва над 95 %.

Метаболизъм: Метаболизира се в черния дроб до неактивни метаболити.

Продължителността на ефекта е 24 часа.



GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

Екскреция: Времето на полуживот е 10-16 часа Приблизително 50 % от дозата се екскретира с урината, а останалите чрез жлъчката и фекалиите.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Глибенкламид е слабо токсичен при перорално приложение на мишки и плъхове. При хронично приложение в продължение на 6 месеца на продукта при плъхове в дози 10000 пъти по-високи от терапевтичните, всички животни са показали нормален растеж и развитие. Хистологичният и макроскопски оглед на черния дроб и другите паренхимни органи на експериментални животни не показват данни за увреждания, освен леко повишаване на активността на СГОТ, СГПТ и алкална фосфатаза.

Изследвания върху плъхове и зайци с глибенкламид в дози 500 пъти по-високи от терапевтичните не са показали данни за нарушен фертилитет.

Липсват данни за мутагенен и канцерогенен потенциал на глибенкламид.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат, пшенично нишесте, магнезиев стеарат, талк, желатин, оцветител Кармоизин (Азорубин) /Е 122/.

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 (три) години

6.4 Специални условия на съхранение

В оригиналната опаковка, на сухо и защитено от светлина място, при температура под 25°C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5 Данни за опаковката

30 /тридесет/ таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио; по 2 блистера в картонена кутия заедно с листовка.

GLIBENCLAMIDE SOPHARMA 5 mg tabl.

6.6 Специфични предпазни мерки при изхвърляне на използван лекарствен продукт или отпадъчни материали от него

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Софарма АД, България

1220 София, ул. Илиенско шосе 16

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР 20011166

9. ДАТА НА ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА:

28.11.2001 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА август 2007

