

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЮГЛИН

Регистрационный номер: ЛП-004519

Торговое наименование препарата: Юглин

Международное непатентованное наименование: гликвидон

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

Действующее вещество: гликвидон – 30 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 134,0 мг, крахмал картофельный – 70,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 5,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,6 мг, магния стеарат – 0,4 мг.

Описание: круглые двояковыпуклые таблетки белого или почти белого цвета с риской.

Фармакотерапевтическая группа

Гипогликемическое средство для перорального применения группы сульфонилмочевины II поколения.

Код АТХ: A10BB08

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Гликвидон – гипогликемическое средство для перорального применения относится к производным сульфонилмочевины II поколения, обладает панкреатическим и внепанкреатическим действием: стимулирует секрецию инсулина, потенцируя глюкозо-опосредованный путь образования инсулина. В опытах на животных было показано, что гликвидон уменьшает резистентность к инсулину в печени и жировой ткани посредством увеличения рецепторов к инсулину, а также стимуляции пострецепторного механизма, опосредованного инсулином.

Гипогликемический эффект развивается через 60–90 минут после приема внутрь, максимум действия наступает через 2–3 ч и длится около 8–10 ч.

Так как гликвидон является производным сульфонилмочевины короткого действия, то его применение показано у пациентов с повышенным риском гипогликемии, то есть у пожилых пациентов и пациентов с печеночной недостаточностью (за исключением пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени). Поскольку выведение гликвидона почками незначительно, гликвидон можно применять у пациентов с почечной недостаточностью или диабетической нефропатией. В клинических исследованиях

МИНЗДРАВ РОССИИ

061022

СОГЛАСОВАНО

эффективности и безопасности 18- и 30- месячной терапии гликвидоном не было выявлено среднего увеличения массы тела пациентов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь однократной дозы гликвидона (15 или 30 мг) препарат быстро и практически полностью (80-95 %) всасывается из желудочно-кишечного тракта, достигая концентрации в плазме 0,65 мкг/мл (диапазон 0,12-2,14 мкг/мл). Среднее время достижения максимальной концентрации (C_{max}) препарата в плазме составляет 2 часа 15 минут (диапазон: 1,25-4,75 ч). Значение площади под кривой «концентрация-время» ($AUC_{0-\infty}$) составляет 5,1 мкг×ч/мл (диапазон: 1,5-10,1 мкг×ч/мл).

Не имеется различий в фармакокинетических показателях у пациентов с сахарным диабетом и у здоровых лиц.

Распределение

Гликвидон имеет высокое сродство к белкам плазмы (> 99 %). Нет данных о возможном прохождении гликвидона или его метаболитов через гематоэнцефалический барьер или плаценту. Нет данных о возможности проникновения гликвидона в грудное молоко.

Метаболизм

Гликвидон полностью метаболизируется печенью, главным образом гидроксилированием и деметилированием. Метаболиты гликвидона не имеют или имеют слабо выраженную фармакологическую активность по сравнению с исходным веществом.

Выведение

Основная часть метаболитов выводится через кишечник. Почками выводится лишь небольшая часть метаболитов. В исследованиях показано, что после приема внутрь около 86 % меченого изотопом препарата (^{14}C) выводится через кишечник. Независимо от дозы и способа введения, почками выводится около 5 % (в виде метаболитов) от введенного количества препарата. Уровень выведения гликвидона почками остается минимальным даже при регулярном назначении.

Период полувыведения составляет 1,2 часа (в диапазоне – 0,4-3,0 ч), конечный период полувыведения составляет, приблизительно, 8 часов (в диапазоне – 5,7-9,4 ч).

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов и пациентов среднего возраста фармакокинетические показатели аналогичны.

У пациентов с почечной недостаточностью

На основании фармакокинетических данных основная часть действующего вещества препарата выводится с желчью, только приблизительно 5% метаболитов гликвидона выводится почками. Следовательно, нет опасности кумуляции гликвидона у пациентов с почечной недостаточностью.

У пациентов с печеночной недостаточностью

Есть данные об отсутствии влияния печеночной недостаточности на метаболизм гликвидона.

Показания к применению

Сахарный диабет 2 типа у пациентов среднего и пожилого возраста (при неэффективности диетотерапии).

Противопоказания

- гиперчувствительность к гликвидону, другим производным сульфонилмочевины, сульфониламидам и/или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата;
- сахарный диабет 1 типа;
- диабетическая прекома, диабетическая кома;
- диабетический ацидоз и кетоацидоз;
- состояние после резекции поджелудочной железы;
- острая интермиттирующая (печеночная) порфирия;
- печеночная недостаточность тяжелой степени;
- тяжелые инфекционные заболевания;
- состояния перед хирургическими операциями;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной недостаточности;
- беременность и период грудного вскармливания;
- возраст до 18 лет (в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности гликвидона в данной возрастной группе).

С осторожностью

Лихорадочный синдром, заболевания щитовидной железы (с нарушением функции), дефицит глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы, алкоголизм.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Нет данных по применению гликвидона у женщин в период беременности и грудного вскармливания.

Беременность

При беременности с сопутствующим сахарным диабетом необходим тщательный мониторинг концентрации глюкозы в плазме. Прием пероральных гипогликемических

средств у женщин в период беременности не обеспечивает должного гликемического контроля. Поэтому применение препарата Юглин в период беременности противопоказано. В случае возникновения беременности или при планировании беременности в период применения препарата Юглин, терапию гликвидоном следует прекратить и перевести пациентку на инсулинотерапию.

Период грудного вскармливания

Нет данных о проникновении гликвидона или его метаболитов в грудное молоко. Применение препарата Юглин в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Режим дозирования

Необходимо соблюдать рекомендации врача относительно дозы препарата и соблюдения диеты. Не следует прекращать прием препарата без консультации с врачом.

Начальная доза гликвидона обычно составляет $\frac{1}{2}$ таблетки (15 мг) во время завтрака.

Если прием $\frac{1}{2}$ таблетки (15 мг) не приводит к адекватному гликемическому контролю, после консультации с врачом, дозу гликвидона следует постепенно увеличить. Если суточная доза препарата не превышает 2 таблетки (60 мг), она может быть назначена в 1 прием, во время завтрака.

При назначении более высокой дозы, лучший эффект может быть достигнут при приеме суточной дозы, разделенной на 2-3 приема. В этом случае самая высокая доза должна быть принята за завтраком. Увеличение дозы более 4 таблеток (120 мг)/сутки обычно не приводит к дальнейшему увеличению эффективности.

Максимальная суточная доза препарата – 4 таблетки (120 мг).

Продолжительность терапии

Препарат Юглин показан для длительного применения с целью контроля гликемии у пациентов с сахарным диабетом 2 типа. Коррекция дозы гликвидона, прекращение или перенос терапии должны проводиться только врачом на основании показателей обмена веществ.

Комбинированная терапия

При недостаточном клиническом эффекте монотерапии препаратом Юглин в качестве дополнения возможно применение только препарата метформина.

Применение препарата в особых клинических группах пациентов

У детей и подростков до 18 лет

Применение препарата Юглин у детей и подростков в возрасте до 18 лет противопоказано в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности гликвидона в данной возрастной популяции.

У пожилых пациентов

Фармакокинетические параметры гликвидона у пациентов среднего и пожилого возраста практически одинаковы.

У пациентов с нарушением функции почек

Около 5 % метаболитов гликвидона выводится почками. У пациентов с нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется.

У пациентов с нарушением функции печени

Прием дозы, превышающей 75 мг, у пациентов с нарушением функции печени требует тщательного контроля состояния пациента. Препарат не следует назначать пациентам с печеночной недостаточностью тяжелой степени, так как 95 % дозы метаболизируется в печени и выводится через кишечник.

Способ применения

Для приема внутрь. Таблетки следует принимать непосредственно перед началом приема пищи, запивая небольшим количеством воды. После приема препарата нельзя пропускать прием пищи.

Побочное действие

Резюме нежелательных реакций

Наиболее частой нежелательной реакцией при применении гликвидона является гипогликемия.

Нежелательные реакции, возможные на фоне терапии гликвидоном, распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям ВОЗ:

Очень часто: $\geq 1/10$

Часто: $\geq 1/100$ до $< 1/10$

Нечасто: $\geq 1/1000$ до $< 1/100$

Редко: $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$

Очень редко: $< 1/10000$

Частота неизвестна: Частота не может быть оценена по доступным данным

Табличное резюме нежелательных реакций

Системно-органный класс	Частота	Нежелательная реакция
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы	редко	тромбоцитопения лейкопения агранулоцитоз*
	часто	гипогликемия

Нарушения со стороны обмена веществ и питания	редко	снижение аппетита
	частота	увеличение массы тела
	неизвестна	
Нарушения со стороны нервной системы	нечасто	головная боль головокружение сонливость
	редко	парестезии
Нарушения со стороны органа зрения	нечасто	нарушения аккомодации
Нарушения со стороны сердца	редко	стенокардия экстрасистолия
Нарушения со стороны сосудов	редко	сердечно-сосудистая недостаточность артериальная гипотензия
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	нечасто	тошнота рвота запор диарея чувство дискомфорта в животе сухость в полости рта
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей	редко	холестаз*
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	нечасто	сыпь зуд
	редко	крапивница синдром Стивенса-Джонсона* реакция светочувствительности*
Общие нарушения и реакции в месте введения	редко	боль в грудной клетке чувство усталости

* Эти нежелательные реакции были зарегистрированы на основании спонтанных событий в рамках всемирного пострегистрационного наблюдения.

Передозировка

Передозировка производными сульфонилмочевины может привести к гипогликемии.

Симптомы: тахикардия, повышенное потоотделение, чувство голода, сердцебиение, тремор, головная боль, бессонница, раздражительность, нарушение речи и зрения, двигательное беспокойство и потеря сознания.

Лечение: в случае появления симптомов гипогликемии следует принять внутрь глюкозу (декстрозу) или продукты, богатые углеводами. При тяжелой гипогликемии (потеря сознания, кома) внутривенно вводят декстрозу. После восстановления сознания - прием легкоусвояемых углеводов (во избежание повторного развития гипогликемии).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Известно, что ряд препаратов может оказывать влияние на метаболизм глюкозы, поэтому лечащему врачу следует учитывать возможные взаимодействия.

Фармакокинетические и фармакодинамические лекарственные взаимодействия с гликвидоном могут изменять проявляемый гипогликемический эффект. Гликвидон имеет высокую степень связывания с белками плазмы и, как следствие, может замещаться сопутствующими лекарственными средствами, также демонстрирующими высокую степень связывания с белками.

Одновременное применение следующих лекарственных средств может усиливать гипогликемический эффект гликвидона:

Ингибиторы ангиотензин-превращающего фермента, аллопуринол, анальгетики и нестероидные противовоспалительные средства (например, салицилаты, фенилбутазон), противогрибковые препараты, хлорамфеникол, кларитромицин, клофибрат, производные кумарина, фторхинолоны, гепарин, ингибиторы моноаминоксидазы, сульфинпиразон, сульфаниламиды, тетрациклины, трициклические антидепрессанты, циклофосфамид и производные, инсулин и другие пероральные гипогликемические средства с и без внутреннего риска развития гипогликемии.

Бета-адреноблокаторы и другие симпатолитики (включая клонидин), резерпин и гуанетидин – эти средства могут усиливать гипогликемический эффект и одновременно маскировать симптомы гипогликемии.

Одновременное применение следующих лекарственных средств может снижать гипогликемический эффект гликвидона: аминоглутетимид, кортикостероиды, диазоксид, пероральные контрацептивы, симпатомиметики, рифамицин, тиазидные и «петлевые» диуретики, тиреоидные гормоны, глюкагон, фенотиазин и препараты, содержащие никотиновую кислоту.

Барбитураты, рифампицин и фенитонн могут уменьшать гипогликемический эффект посредством индуцирования ферментов печени.

Усиление или ослабление гипогликемического эффекта гликвидона было описано при приеме блокаторов H₂-гистаминовых рецепторов (циметидин, ранитидин) и алкоголя. При одновременном применении с алкоголем снижается толерантность к алкоголю и ухудшается обмен веществ. Также неправильное применение слабительных препаратов вызывает усугубление нарушений обмена веществ.

Особые указания

Терапия сахарного диабета требует регулярного медицинского наблюдения. Следует соблюдать осторожность, особенно во время подбора дозы или при переходе с другого гипогликемического препарата.

Несмотря на то, что только 5% гликвидона выводится почками, при наличии тяжелых заболеваний почек необходим особенно тщательный медицинский контроль. Пациенты должны быть проинформированы о необходимости незамедлительного обращения к врачу в случае развития признаков гипогликемии – таких как, например, тахикардия, шок, влажные кожные покровы, повышение температуры тела, психомоторное возбуждение и гиперрефлексия – возникающих во время терапии препаратом, так как она может привести к развитию таких жизнеугрожающих состояний, как кома (см. раздел «Передозировка»). В клинических исследованиях гликвидона в рамках гипогликемии также наблюдалось развитие лихорадки, тошноты и сыпи. Ввиду потенциально пролонгированной гипогликемии за временным улучшением гипогликемического состояния может наступить другой гипогликемический эпизод во время следующего применения препарата.

Лечение пациентов с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы препаратами, содержащими сульфонилмочевину, может приводить к развитию гемолитической анемии. Гликвидон относится к группе препаратов сульфонилмочевины; как следствие, он должен применяться с осторожностью у пациентов с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, и в качестве терапии у таких пациентов должна быть рассмотрена соответствующая альтернативная терапия, не содержащая сульфонилмочевину.

Пероральные гипогликемические препараты не должны заменять диетотерапию, так как при сахарном диабете диета предназначена в первую очередь для контроля массы тела пациента и не зависит от медикаментозной терапии, которую может назначить лечащий врач.

Пропуск приема пищи или несоблюдение рекомендаций врача может значительно снизить концентрацию глюкозы в крови и привести к потере сознания. При приеме препарата до приема пищи, а не как рекомендовано, в начале приема пищи, влияние препарата на концентрацию глюкозы в крови более выражено, что повышает риск развития гипогликемии.

При появлении симптомов гипогликемии необходимо незамедлительно принять пищу, содержащую сахар. В случае сохраняющегося гипогликемического состояния следует немедленно обратиться к врачу.

Физическая нагрузка может усилить гипогликемическое действие.

Алкоголь или стресс могут усиливать или уменьшать гипогликемическое действие производных сульфонилмочевины.

Особую осторожность следует соблюдать при одновременном применении гликвидона со многими другими лекарственными препаратами, особенно с теми, которые усиливают снижение глюкозы в крови, вызываемое применением гликвидона (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Нет данных о влиянии препарата на способность к управлению транспортными средствами, механизмами. Однако, пациенты должны быть предупреждены о таких проявлениях гипогликемии как сонливость, головокружение, нарушение аккомодации, которые могут возникнуть на фоне приема препарата. Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами, механизмами. При гипогликемических состояниях следует избегать управления транспортными средствами, механизмами.

Форма выпуска

Таблетки, 30 мг.

Первичная упаковка

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 30, 60 и 120 таблеток в банку из полиэтилена низкого давления с крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия. Свободное пространство заполняют ватой медицинской. На банки наклеивают этикетки из бумаги этикеточной или из полимерных материалов, самоклеящиеся.

Вторичная упаковка

По 3 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 1 банке вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

Условия хранения

В оригинальной упаковке производителя при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/ Организация, принимающая претензии потребителей:

ООО «Фармасинтез-Тюмень», Россия, 625059, г. Тюмень, 7-ой км Велижанского тракта, д. 2

Тел.: 8-800-100-1550,

www.pharmasyntez.com

Производитель

ООО «Фармасинтез-Тюмень», Россия

625059, г. Тюмень, 7-ой км Велижанского тракта, д. 2

или

АО «Фармасинтез», Россия

Юридический адрес: 664007, г. Иркутск, ул. Красногвардейская, д. 23, оф. 3

Адрес производственной площадки: г. Иркутск, ул. Р. Люксембург, д. 184

Представитель

ООО «Фармасинтез-Тюмень»



Малых Н.Ю.