

## **КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

### **1. Име на лекарственото средство**

**ANTIDIAB**

### **2. Количествен и качествен състав**

1 таблетка съдържа 5 mg glipizide

### **3. Лекарствена форма**

Таблетки от 5 mg

### **4. Клинични данни**

#### **4.1. Показания**

Glipizide е показан като допълнение към диетата за намаляване на кръвната захар при пациенти с неинсулин зависим диабет (тип II, NIDDM), при които хипергликемията не може да бъде контролирана само с диета.

#### **4.2. Дозировка и начин на приложение**

Дозирането трябва да бъде индивидуално пригледено съобразно със стойностите, получени при периодичното проследяване на кръвната захар или гликозурията. При повечето пациенти нормални стойности на кръвната захар се постигат с 2.5 до 20 mg Antidiab (1/2 до 4 таблетки) дневно.

За пациенти, за които Antidiab е начало в антидиабетната терапия, началната доза е 1/2 до 1 таблетка дневно, като тя постепенно се увеличава до постигане на адекватни стойности на кръвната захар.

Режимът на дозиране при пациенти, които преди това са били лекувани с други орални хипогликемици, зависи от тяхното клинично състояние и стойностите на лабораторните показатели и от вида на предишната терапия. Лечението започва с по-ниски дози Antidiab като те се повишават до постигане на желан ефект. За пациенти получаващи инсулин е възможна комбинирана терапия с инсулин и глипизид. В тези случаи нуждите от инсулин са обикновено намалени. Дозите на инсулин и глипизид се определят от диabetолог и са стого индивидуални.

#### **4.3. Противопоказания**

Както другите сулфанилурейни деривати, глипизид не се използва за лечение на инсулинозависим диабет, кетоацидоза, състояния предхождащи диабетна кома, диабетна кома, диабет при бременност, при пациенти с остра бъбречна

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВНООПАЗВАНЕТО	
ПРЕДПИСАНИЕ ЗА ЛЕЧЕНИЕ	
Пациент: <i>Иван Иванов</i>	
Пациент номер: <i>11-7933/05.08.07</i>	
Дата: <i>04.02/15.07.03</i>	Лекар: <i>Марица</i>



чернодробна или надбъбречна недостатъчност или свръхчувствителност към някои от съставките на продукта, сулфонамиди, тиазиди и сулфанилуреинни деривати.

#### **4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба**

Трябва да се подчертае, че както другите сулфанилуреинни деривати Antidiab може да бъде използван само за лечение на захарен диабет у възрастни, който не може да бъде контролиран само чрез диета. При започване на лечението на неинсулин-зависим диабет трябва да бъде отбелязано, че диетата е първоначалната форма на лечение. Намаляването на калоричността на храната и намаляване на телесното тегло е от първостепенно значение при пациенти с наднормено тегло. Внимателно балансирана диета може да бъде достатъчна за контролиране на кръвната захар и свързаните с нея хипергликемични симптоми.

Използването на Antidiab трябва да бъде разглеждано от лекаря и пациента като лечение в допълнение към диетата, а не като заместващо диетата или като подходящ механизъм за предотвратяване на ограничения в храненето.

Пациенти, които са преминали хирургични интервенции, били са изложени на инфекции или са фебрилни, трябва периодично да получават инсулин, за да се поддържа задоволителен метаболитен баланс. По изключение, след приемане на алкохол може да се наблюдава дисулфирам подобна реакция.

Необходимо е редовно хранене на пациентите за евентуално избягване на хипогликемия.

#### **4.5. Лекарствени и други взаимодействия**

Възможни са взаимодействия с други лекарства. Потенциране на активността може да бъде предизвикана от нестероидни противовъзпалителни средства и други лекарства, свързващи се силно с плазмените протеини, сулфонамиди, хлорамфеникол, циклофосфамид, пробеницид, кумарини, MAO инхибитори, бета-блокери, диазоксид, алкохол, миконазол и флуконазол. Едновременното прилагане с диуретици, кортикостероиди, фенотиазини, тироидни препарати,



естрогени, орални контрацептиви, фенитоин, изониазид или калциеви антагонисти може да предизвика недостатъчна активност на глипизид. Едновременното използване на два антидиабетни препарата може да доведе до допълнителен хипогликемичен ефект. Пациентите трябва да бъдат предупреждавани за тази възможност.

Едновременното използване на глипизид и магнезий съдържащи антиациди предизвиква увеличаване на площта под кривата (AUC) за всяко от лекарствата. Ако използването на такива лекарства е належащо, в този случай е необходимо проследяване на кръвната захар и подбор на подходяща дозировка. Бета блокерите могат да маскират признаците на хипогликемия.

#### **4.6. Бременност и кърмене**

Поради недостатъчно опит бременността и кърменето са относителни противопоказания (те са класифицирани от Администрацията по Храни и Лекарства в категория С на бременността).

#### **4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Възможността да се развие хипогликемия може да предизвика намаление в способността за концентрация на пациента и следователно може да предизвика несигурни реакции при шофиране или при работа с машини.

#### **4.8. Нежелани лекарствени реакции**

Хипогликемичните реакции са редки, по-често се наблюдават при възрастни, когато са изложени на тежки физически натоварвания, при пациенти, които не се хранят редовно, при тези, които приемат алкохол, или при тези, които са с бъбречна или чернодробна недостатъчност

Гадене, чувство на епигастрална пълнота и главоболие се появяват рядко.

Възможни са преходни алергични кожни реакции. Рядко се появяват промени в хематопоетичната система. Наблюдавани са нежелани лекарствени реакции от страна на черния дроб (холестатичен иктер, хепатит, порфирия)



#### **4.9. Предозиране**

Няма специфичен антидот. Умерената хипогликемия трябва да бъде третирана с приемане на глюкоза през устата или с регулиране на дозата и диетата. Тежка хипогликемия със спазми, други неврологични симптоми и кома изисква интравенозно прилагане на глюкоза или глюкагон и евентуално хоспитализация.

#### **5. Фармакологични данни**

##### **5.1. Фармакодинамични свойства**

Фармакотерапевтична група (АТС) - орален противодиабетен препарат. Glipizide е орален хипогликемик, второ поколение сулфонилуреен дериват с относително висока ефективност. Както останалите лекарства от тази група, той действа на неинсулино-зависимия диабет. Неговата активност е потвърдена чрез опити върху животни, на здрави доброволци и при диабетно болни пациенти.

Механизмът на действие на glipizide е подобен на другите сулфанилуреини деривати. Той намалява кръвната захар нива предимно чрез стимулиране секрецията на ендогенен инсулин от бета-клетките на панкреаса.

##### **5.2. Фармакокинетични свойства**

**Абсорбция:** Glipizide бързо и почти напълно се абсорбира от гастроинтестиналния тракт. При плъхове glipizide се абсорбира изключително през червата, но не и през стомаха. Най-високи серумни нива у здрави доброволци след орално приемане на  $C^{14}$  glipizide варират от 400 до 600 ng/ml и се постигат за 1 до 3 часа след приемане. Едновременното прилагане с натриев бикарбонат значително ускорява и улеснява абсорбцията на glipizide и така потенцира неговия ефект върху плазмената глюкоза, същото не се отнася за алуминиевия хидроокис, който не влиза в взаимодействие с glipizide. Абсорбцията на glipizide също така значително се улеснява от едновременното приемане с магнезиев хидроокис. Храната значително забавя абсорбцията на



glipizide, следователно по-добър контрол на кръвната захар се постига с приемане на лекарството половин час преди хранене.

**Разпределение:** Glipizide силно се свързва с плазмените протеини, главно с албумините; при плъхове и мишки свързването е между 89% и 99%, а при хора даже 99%. Glipizide добре се разпределя в органите с добра кръвна циркулация. Glipizide напълно се абсорбира след орално приемане като неговата бионаличност е пълна, тъй като няма пресистемна метаболитна загуба. Пикови плазмени нива обикновено се постигат за 1.2 до 3.5 часа след приемане на лекарството, ако това е станало на гладно. При определени пациенти абсорбцията може да бъде по-бавна. Степента на абсорбция е важен показател за клиничната ефективност на glipizide. Когато лекарството се приема 1/2 час преди хранене степента на абсорбция е най-висока. Ефектът не зависи от кръвната захарна нива на гладно (стойности между 6-15 mmol/l). Времето на полуелиминиране след единична орална доза е 2.4 часа (1.1 до 3.4 часа).

Glipizide изглежда не преминава кръвно-мозъчната бариера. Степента на излъчване в човешкото мляко досега не е проучена, както и степента на преминаване през плацентата.

Орална абсорбция	100%
Пресистемен метаболизъм	0%
Плазмен полуживот	2-4 часа
Средна стойност	2.4 часа
Обем на разпределение	0.14 lkg <sup>-1</sup>
Свързване с плазмените протеини	>98%

### 5.3. Предклинични данни за безопасност

LD<sub>50</sub> за определени животински видове са показани в следната таблица (токсичност след единична доза):

Начин на прилагане	Пол	Мишки	Плъхове
--------------------	-----	-------	---------



i. p.	мъжки	>3 g/kg	>1.6 g/kg	2.4 g/kg
	женски	>3 g/kg	> 1.265 g/kg	-
Per os	мъжки	> 5 g/kg	> 5 g/kg	-
	женски	> 5 g/kg	> 1.6 g/kg	-

#### Токсичност след многократно прилагане

Хроничната токсичност на glipizide е изследвана на плъхове и кучета в проучване продължило 6 месеца. Не са установени промени в хематологичните и клинично-биохимичните показатели даже след най-високи дози (8 mg/kg/ден), както и теглото на органите и хистологичните находки не се различават от контролната група.

#### Ефекти върху размножаването

Проучвания върху лабораторни животни не са показали данни за токсичност на glipizide, свързана с размножаването.

Въпреки това се препоръчва да бъде избягвана употребата му през бременността.

#### Мутагенни ефекти

Мутагенното действие (хромозомно аберационен тест) на glipizide е проучено in vivo на хамстери и мишки. Не е наблюдаван никакъв мутагенен ефект, даже след дози превишаващи 100 пъти терепевтичните.

Две линии Salmonella typhimurium са използвани като опитни микроорганизми. Не е установено никакво мутагенно действие на glipizide върху тях.

#### Канцерогенни ефекти

Двадесет месечно проучване върху плъхове и осемнадесет месечно такова върху мишки, с дози 75 пъти надвишаващи максималните използвани при хора, не са показали канцерогенни ефекти на glipizide.

### 6. Фармацевтични данни

#### 6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Maltodextrin	0.0090 g
Maize Starch	0.0284 g



Microcrystalline Cellulose	0.0100 g
Lactose	0.1247 g
Sodium Lauryl Sulphate	0.0009 g
Stearic Acid	0.0020 g

**6.2. Физикохимични несъвместимости**

Няма

**6.3. Срок на годност**

5 години

**6.4. Специални условия на съхранение**

Добре затворени, защитени от светлина и влага, при температура под 30<sup>0</sup>С.

**6.5. Данни за опаковката**

30 таблетки в блистери от алуминиево и PVC фолио.

**7. Име и адрес на производителя и притежателя на разрешението за употреба**

KRKA, p.o., Novo Mesto, Slovenia  
68000 Novo Mesto  
Smarjeska cesta 6

