

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. **Наименование на лекарствения продукт**

Glibenclamid

2. **Качествен и количествен състав на активното вещество**

Съдържание на една таблетка:

Glibenclamide 5 mg

3. **Лекарствена форма**

Таблетки


4. **Клинични данни**

4.1. **Показания**

Неинсулинозависим тип диабет, който не може да се контролира само с диета, особено при диабет, вторично резистентен спрямо продукти от същата група.

4.2. **Начин на приложение и дозировка**

Лечението се започва с ниски дози - половин таблетка (2,5 mg) сутрин след 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 след закуска. Максималната денонощна доза не трябва да надвишава 3 таблетки (15 mg). По правило 2 таблетки се приемат сутрин след закуска, останалото количество - след вечеря.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-4437/28.11.02	
614/06.11.01	



Продуктът може да се прилага непосредствено след друго предшестващо антидиабетично лечение.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта или други сулфанилурейни продукти, захарен диабет - ювенилен тип; съдово-дегенеративни усложнения на диабета (коронарна макроангиопатия и инфаркт на миокарда, диабетна нефропатия); тежка метаболитна ацидоза, особено прекома или кома; тежки нарушения в бъбречната и чернодробната функция.

4.4. Специални указания и предупреждения

При лечение с Глибенкламид е необходимо да се избягва консумацията на алкохол, поради опасност от проява на непоносимост.

Недохранени, изтощени хора в лошо здравословно състояние, болни с надбъбречна недостатъчност и хипопитуитаризъм са особено чувствителни към хипогликемичното действие на пероралните антидиабетни продукти, включително и Глибенкламид. Може да се появи хипогликемия и по време на хипокалорична диета и при значително физическо усилие.

При прилагането на продукта съществува възможност от развитие на толерантност.

Продуктът съдържа като помощно вещество пшенично нишесте, което може да представлява опасност за хора с глутенова ентеропатия.

Carmoisine (E 122), който се съдържа като помощно вещество в продукта може да причини алергичен тип реакции, включително астма. Рискът от алергии е по-голям при алергични към аспирин пациенти.

4.5. Лекарствени взаимодействия

Засилване на хипогликемичния ефект на Глибенкламид се предизвиква при едновременна употреба с флуорохинолони, фибрати, АСЕ-инхибитори, перорални кумаринови антикоагуланти, фенилбутазон, сулфонамиди, салицилати, хлорамфеникол, тетрациклини, алопуринол, циметидин и други H_2 -блокери, алфа-метилдопа, етанол и инхибитори на MAO.

Отслабване ефекта на Глибенкламид предизвикват хлорпромазин, салбутамол, тербуталин, фенитоин, кортикостероиди, орални контрацептивни средства, фенотиазинови и лаксативни средства.

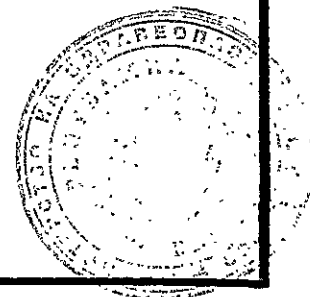
Глибенкламид не трябва да се прилага едновременно с миконазол или кетоконазол, поради възможността от настъпване на тежка хипогликемия, стигаща до кома.

Бета-блокери може да маскират симптомите на хипогликемия и съществува възможност неселективните бета-блокери да увеличат честотата и тежестта на хипогликемията при едновременно приложение с Глибенкламид.

4.6. Бременност и кърмене

Не се препоръчва употребата на продукта по време на бременност, тъй като има данни за тератогенен ефект на сулфанилурейните продукти.

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



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

4.7. Влияние върху активното внимание, способността за шофиране и работа с машини

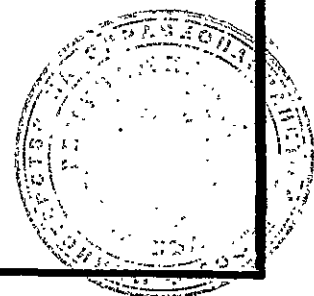
Няма данни за неблагоприятен ефект върху способността за шофиране и работа с машини, ако общото състояние на болния от диабет разрешава изпълнението на такъв вид дейност.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Може да се наблюдава хипогликемия при пациенти, непривикнали към продукти от тази група, при предозиране, при взаимодействие с други лекарства и при грешки в диетата. По-рядко се наблюдават алергични реакции, стомашно-чревни разстройства (гадене, повръщане), холестатична жълтеница, протеинурия, кардиоциркулаторни смущения, промени в кръвната картина (еритроцитопения, тромбоцитопения, гранулоцитопения и хемолитична анемия), нарушения в акомодацията, болки в ставите и втрисане.

4.9. Предозиране

При предозиране с Глибенкламид се наблюдава развитие на хипогликемии, особено при пациенти в напреднала възраст. Хипогликемичните състояния започват постепенно, без развитие на изразена вегетативна симптоматика. Протичат с изразена очедвигателна неврологична симптоматика, имитираща остро нарушение на мозъчното кръвообръщение. В зависимост от тежестта на хипогликемията лечението се провежда с перорално приемане на



плодови сокове или подсладени течности, с венозно инжектиране на глюкоза или глюкагон.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамика

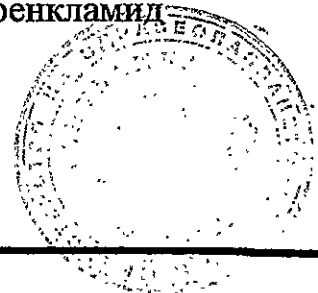
Глибенкламид е продукт от втора генерация на сулфанилурейните антидиабетични средства. Притежава мощен и продължителен антихипергликемичен ефект.

Глибенкламид стимулира инсулиновото отделяне не само *in vivo*, но и *in vitro*, 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. Фармакокинетика

Глибенкламид се отличава с бърза и добра резорбция в стомашно-чревния тракт. След перорално приложение глибенкламид



показва бионаличност над 90 % и време на полуелиминиране 10-16 часа. Максимални плазмени концентрации се установяват между 2 и 4 час. С плазмените протеини се свързва над 90 %. Метаболизира се в черния дроб до неактивни метаболити. Продължителност на ефекта - 24 часа. Приблизително 50 % от дозата се екскретира с урината, а останалите чрез жлъчката и фекалиите.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Острата токсичност на глибенкламид при пероралното му приложение на мишки и плъхове е извънредно ниска. При зайци в дози 20000 mg/kg всички животни са останали живи без токсични симптоми. Известно е, че зайците са по-чувствителни към хипогликемичният ефект на глибенкламид в сравнение с плъховете. При хронично приложение в срок от 6 месеца на продукта при плъхове в дози 10000 пъти по-високи от терапевтичните, всички животни са показали нормален растеж и развитие без разлика от контролите. При хистологичен и макроскопски оглед на черния дроб и другите паренхимни органи на експериментални животни, няма данни за увреждания, освен леко повишаване на активността на СГОТ, СГПТ и алкална фосфатаза. Установено е и леко повишаване на калиевото ниво в плазмата, което е дозозависимо и не е релевантно.

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

Недобре контролираните глюкозни нива в кръвта се свързват с повишени инциденти на конгенитални малформации по време на ранна бременност и с повишаване на перинаталната заболяемост и



смъртност при късна бременност. Счита се, че е възможно сулфанилурейните продукти да причинят конгенитални малформации, но не е сигурно дали това се дължи на недобре контролираните глюкозни нива в кръвта или на сулфанилурейните продукти.

От тези резултати може да се направи извод, че глибенкламид се отнася към продуктите с много ниска токсичност, голяма терапевтична ширина и е практически безопасен при продължителна употреба.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Съдържание на една таблетка в mg:

Lactose monohydrate	85,00
Wheat starch	51,50
Magnesium stearate	1,50
Talc	4,50
Gellatin	0,0025
Carmoisine 311804P25	0,003

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

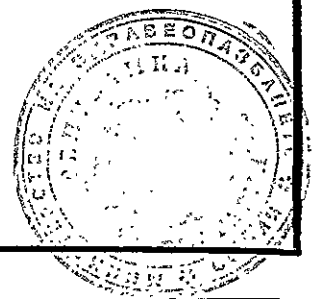
Три години от датата на производство.

6.4. Условия на съхранение

На защитено от светлина място, при температура под 25⁰ С.

6.5. Данни за опаковката

Продуктът се опакова по 30 / тридесет / таблетки в блистер от прозрачно и алуминиево ПВХ фолио. Два блистера се поставят в картонена кутия заедно с листовка за пациента.



6.6. Начин на отпускане

По лекарско предписание.

7. Производител

“Софарма” АД, България

София, ул. “Илиенско шосе” N 16

