

## ГЛИМЕПИРИД

1. Глимепирид.
2. Амарил.
3. Гормоны и средства, влияющие на эндокринную систему. (Инсулин и средства для лечения сахарного диабета).
4. Гипогликемическое средство.
5. Уровень убедительности доказательств А.
6. Цена за 1 таблетку (1 мг) - 4,44 руб.[2]; 5,93 руб.[3].
7. Производное сульфонилмочевины III поколения. Стимулирует  $\beta$ -клетки поджелудочной железы, способствуя мобилизации и усилению выброса эндогенного инсулина, увеличивает количество инсулинчувствительных рецепторов в клетках - мишенях, угнетает глюконеогенез. Улучшает постпрандиальный инсулин/С-пептидный ответ, снижает гипергликемию без увеличения уровня инсулин/С-пептида натощак. Экстрапанкреатические эффекты заключаются в увеличении чувствительности периферических тканей к инсулину. Уменьшает риск развития ретино-, нейро- и нефропатии. При сочетанном назначении позволяет снизить дозу инсулина у тучных пациентов на 38%. Максимальный эффект достигается спустя 2-3 ч, гипогликемический эффект продолжается более 24 ч. Абсорбция высокая. При приеме внутрь в суточной дозе 4 мг  $TC_{max}$  – 2,5 ч и составляет 309 нг/мл. Объем распределения – 8,8 л (113 мл/кг). Биодоступность - около 100%. Связи с белками - 99%, клиренс – 48 мл/мин. Метаболизируется в печени,  $T_{1/2}$  - 5-8 ч. Выведение преимущественно в виде метаболитов - почками (58% введенной дозы) и кишечником (35%). Не кумулирует.
8. Сахарный диабет 2 типа.
9. Гиперчувствительность, сахарный диабет 1 типа, диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома и кома, гипертоническая кома. Печеночная и почечная недостаточность, обширные ожоги, травма, большие хирургические вмешательства, кишечная непроходимость, парез желудка, состояния, сопровождающиеся нарушением всасывания пищи, развитием гипогликемии (инфекционные заболевания), лейкопения, беременность, период лактации.
10. Поддержание стабильного уровня глюкозы в плазме крови (менее 5,5-6,0 ммоль/л), гликированного гемоглобина.
11. Внутрь, не разжевывая, с достаточным количеством жидкости, перед обильным завтраком, в начальной дозе 1 мг один раз в день. При необходимости суточная доза может быть увеличена постепенно (на 1 мг каждую 1-2 недели) до 6-8 мг. Лечение - длительное, под контролем содержания глюкозы в крови и моче.
12. Симптомы: гипогликемия (чувство голода, тошнота, рвота, апатия, сонливость, депрессия, нарушения сна, резкая слабость, тревожность, нарушение концентрации внимания, нарушение речи (афазия) и зрения, тремор, парезы, нарушение чувствительности, головокружение, судороги, поверхностное дыхание, брадикардия, возможно появление признаков адренергической контррегуляции - повышение АД, тахикардия, нарушение сознания, гипогликемическая кома). Лечение: если пациент в сознании - прием углеводов, при невозможности приема внутрь - инъекции декстрозы (в/в болюсно - 40% раствор декстрозы, затем инфузия 10% раствора), 1-2 мг глюкагона. Необходим постоянный мониторинг и поддержание жизненно важных функций, концентрации глюкозы в крови (на уровне 5,5 ммоль/л) в течение как минимум 24-48 ч (возможны повторные эпизоды гипогликемии). После восстановления сознания необходимо дать больному пищу, богатую легко усваиваемыми углеводами (во избежание повторного развития гипогликемии). При отеке мозга - маннит и дексаметазон.
13. В случае хирургических вмешательств или при декомпенсации диабета возможно применение препаратов инсулина.
14. С осторожностью - лихорадочный синдром, алкоголизм, надпочечниковая недостаточность, заболевания щитовидной железы (гипо- или гипертиреоз). Противопоказаны при беременности и лактации. Если беременность наступила, необходимо, как можно раньше перевести пациентку на лечение инсулином.
15. Гипогликемия, снижение зрения (обусловленное гипогликемией), головокружение, головные боли, астения, тошнота, рвота, ощущение переполнения в эпигастрии, абдоминальные боли, диарея, повышение активности "печеночных" трансаминаз, внутрипеченочный холестаз, желтуха, гипонатриемия, тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз, гемолитическая и апластическая анемии, панцитопения, аллергические реакции (васкулит, реже - гепатит). Редко - одышка, снижение АД, фотосенсибилизация, поздняя кожная порфирия.
16. Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (каптоприл, эналаприл), блокаторы  $H_2$ -гистаминовых рецепторов (циметидин), противогрибковые препараты (миконазол, флуконазол), нестероидные противовоспалительные препараты (фенилбутазон, азапропазон, оксифенбутазон, фибраты (клофибрат, безафибрат), противотуберкулезные (этионамид), салицилаты (парацетамол), антикоагулянты кумаринового ряда, анаболические стероиды,  $\beta$ -адреноблокаторы, ингибиторы MAO, пролонгированные сульфаниламиды, циклофосфамид, бигуаниды, хлорамфеникол, фенфлурамин, акарбоза, флуоксетин, гуанетидин, пентоксифиллин, тетрациклин, теofilлин, блокаторы канальцевой секреции, резерпин, бромокриптин, дизопирамид, пиридоксин, инсулин и аллопуринол усиливают эффект. Ослабляют эффект барбитураты, глюкокортикостероиды, симпатомиметики (эпинефрин, клонидин), противосудорожные средства (производные гидантоина, фенитоин), антагонисты кальция, ингибиторы карбоангидразы (ацетазоламид), тиазидные диуретики, хлорталидон, фуросемид, триамтерен, аспарагиназа, баклофен, даназол, diaзоксид, изониазид, морфин, ритодрин, сальбутамол, тербуталин, глюкагон, рифампицин, гормоны щитовидной железы, соли  $Li^+$ , в высоких дозах - никотиновая кислота, хлорпромазин, пероральные контрацептивы и эстрогены. Снижает (незначительно) гипокоагуляцию, вызываемую варфарином. Алкоголь может как усиливать, так и ослаблять гипогликемическую активность. Рекомбинантные  $\alpha$ -интерфероны увеличивают риск развития нарушений функции щитовидной железы.
17. Не применяется.
18. Пациент информируется о необходимости соблюдения режима приема препарата, предупреждается о возможности возникновения побочных эффектов. Пациент предупреждается о регулярном контроле содержания глюкозы в крови и моче. Во время лечения не рекомендуется заниматься деятельностью, требующей концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Следует предупредить пациента о повышенном риске возникновения гипогликемии в случаях приема этанола (в т.ч. возможно развитие дисульфирамоноподобного синдрома: абдоминальные боли, тошнота, рвота, головная боль), нестероидных противовоспалительных препаратов, при голодании. Необходима коррекция дозы при физическом и эмоциональном перенапряжении, изменении режима питания. При недостаточном эффекте или снижении действия при длительной монотерапии (вторичная резистентность) рекомендуется комбинация с инсулином. Клинические проявления гипогликемии могут маскироваться при приеме  $\beta$ -адреноблокаторов, клонидина, резерпина, гуанетидина.
19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.
20. Таблетки по 1, 2, 3, 4, 6 мг.

**Фирмы:** Hoechst AG, Германия.

21. При температуре не выше 25 С.