

1. VAISTINIO PREPARATO PAVADINIMAS

DIAPREL MR 60 mg modifikuoto atpalaidavimo tabletės

2. KOKYBINĖ IR KIEKYBINĖ SUDĖTIS

Vienoje modifikuoto atpalaidavimo tabletėje yra 60 mg gliklazido.
Pagalbinė medžiaga, kurios poveikis žinomas: laktozė monohidratas.

Visos pagalbinės medžiagos išvardytos 6.1 skyriuje.

3. FARMACINĖ FORMA

Modifikuoto atpalaidavimo tabletė.

Baltos, pailgos, 15 mm ilgio ir 7 mm pločio tabletės su vagele. Abiejose pusėse įspausta „DIA 60“.
Tabletę galima padalyti į lygias dozes.

4. KLINIKINĖ INFORMACIJA

4.1 Terapinės indikacijos

Suaugusių žmonių nuo insulino nepriklausomo (2 tipo) cukrinio diabeto gydymas, kai dietos, fizinių pratimų ar vien tik kūno svorio mažinimo nepakanka, kad būtų galima kontroliuoti gliukozės koncentraciją kraujyje.

4.2 Dozavimas ir vartojimo metodas

Dozavimas

DIAPREL MR paros dozė gali svyruoti nuo pusės tabletės iki 2 tablečių per parą, t. y. gerti nuo 30 iki 120 mg vienkartinę dozę per pusryčius.

Tabletę rekomenduojama praryti neskaldytą ir nesukramtytą.

Jei dozė buvo praleista, kitą dieną dozės didinti nereikia.

Kaip ir vartojant bet kokius kitus hipoglikemizuojančius preparatus, dozė turi būti pritaikyta, atsižvelgiant į individualų paciento metabolinį atsaką (gliukozės koncentracijos kraujyje, gliukuoto hemoglobino (HbA_{1c})).

Pradinė dozė

Rekomenduojama pradinė dozė yra 30 mg per parą (pusė tabletės DIAPREL MR 60 mg). Jei gliukozės koncentracija kraujyje veiksmingai kontroliuojama, tokią dozę galima vartoti taikant palaikomąjį gydymą. Jei gliukozės koncentracija kraujyje tinkamai nekontroliuojama, dozę galima palaipsniui padidinti iki 60 mg, 90 mg arba 120 mg per parą. Tarp dozės didinimų turi būti mažiausiai 1 mėnesio pertrauka, išskyrus pacientus, kurių kraujo gliukozės koncentracija nesumažėjo po dviejų gydymo savaičių. Tokiais atvejais dozę galima didinti antros gydymo savaitės pabaigoje.

Didžiausia rekomenduojama paros dozė yra 120 mg.

Viena DIAPREL MR 60 mg modifikuoto atpalaidavimo tabletė yra kaip dvi DIAPREL MR 30 mg modifikuoto atpalaidavimo tabletės. Kadangi DIAPREL MR 60 mg modifikuoto atpalaidavimo tabletės galima perlausti, vaistas dozuojamas lanksčiau.

DIAPREL 80 mg tabletės keičiant DIAPREL MR 60 mg modifikuoto atpalaidavimo tabletėmis

Viena DIAPREL 80 mg tabletė lygintina su 30 mg modifikuoto atpalaidavimo vaisto forma (t. y., puse DIAPREL MR 60 mg tabletės). Taigi, juos galima keisti vienus kitais, atidžiai sekant kraujo tyrimus.

Kitą geriamąjį vaistinį preparatą nuo diabeto keičiant DIAPREL MR 60 mg:

Preparatas DIAPREL MR 60 mg gali būti vartojamas kaip kitų geriamųjų vaistinių preparatų nuo diabeto pakaitalas.

Kitą geriamąjį vaistinį preparatą nuo diabeto pakeičiant DIAPREL MR 60 mg reikia atsižvelgti į vartoto vaistinio preparato dozavimą ir pusinės eliminacijos laiką.

Pereinamojo laikotarpio dažniausiai nereikia. Reikia skirti vartoti pradinę 30 mg dozę, ir, jeigu būtina, ją galima palaipsniui didinti, atsižvelgiant į paciento kraujo gliukozės koncentracijos rodiklius kaip nurodyta aukščiau.

Keičiant hipoglikemizuojančius sulfonilkarbamido preparatus, kurių pusinės eliminacijos laikas yra ilgas, gali prireikti kelioms dienoms nutraukti gydymą, norint išvengti dviejų preparatų suminio poveikio, galinčio sukelti hipoglikemiją. Tokiu atveju, keičiant gydymą preparatu DIAPREL MR 60 mg, reikia taikyti pradinio gydymo dozavimo schemą, t. y. pradinę 30 mg per parą dozę, kuri palaipsniui didinama priklausomai nuo metabolinio atsako.

Kombinuotas gydymas vartojant kitus vaistinius preparatus nuo diabeto

DIAPREL MR 60 mg galima vartoti kartu su biguanidais, alfa gliukozidazės inhibitoriais ar insulinu.

Pacientus, kurių liga DIAPREL MR 60 mg tinkamai nekontroliuojama, atidžiai prižiūrint medikui galima kartu pradėti gydyti insulinu.

Specialioji populiacija

Senyviems pacientams

Tokiems pacientams DIAPREL MR 60 mg reikia dozuoti taip pat, kaip rekomenduojama jaunesniems kaip 65 metų ligoniams.

Pacientams, kurių inkstų funkcija sutrikusi

Pacientams, kuriems yra lengvas ar vidutinio sunkumo inkstų funkcijos sutrikimas galima dozuoti taip pat kaip ir tiems, kurių inkstų funkcija normali, tačiau reikalinga atidi paciento priežiūra. Tokie duomenys patvirtinti klinikiniais tyrimais.

Pacientams, kuriems yra hipoglikemijos rizika:

- nepakankamai ar prastai besimaitinantiems;
- kuriems yra sunkus arba blogai kompensuotas endokrininės sistemos sutrikimas (hipopituitarizmas, hipotirozė, antinksčių žievės nepakankamumas);
- nutraukusiems ilgalaikį ir (arba) didelių kortikosteroidų dozių vartojimą;
- sergantiems sunkia kraujagyslių liga (sunkia išemine širdies liga, sunkiu miego arterijos kraujotakos nepakankamumu, difuzine kraujagyslių liga).

Minėtais atvejais rekomenduojama vartoti mažiausią pradinę paros dozę, t. y. 30 mg.

Vaikų populiacija

DIAPREL MR saugumas ir veiksmingumas vaikams ir paaugliams neištirtas.

Duomenų apie poveikį vaikams nėra.

4.3 Kontraindikacijos

Šį vaistinį preparatą draudžiama vartoti šiais atvejais:

- Padidėjęs jautrumas gliklazidui, kitokiems sulfonilkarbamidų dariniams, sulfonamidams arba bet kuriai 6.1 skyriuje nurodytai pagalbinei medžiagai.
- I tipo cukrinis diabetas.
- Diabetinė ketoacidozė.
- Būklė prieš diabetinę komą, diabetinė koma, diabetinė ketoacidozė.
- Sunkus inkstų arba kepenų nepakankamumas: šiuo atveju rekomenduojama vartoti insuliną.
- Mikonazolo vartojimas (žr. 4.5 skyrių).
- Žindymo laikotarpis (žr. 4.6 skyrių).

4.4 Specialūs įspėjimai ir atsargumo priemonės

Hipoglikemija

DIAPREL MR galima skirti tik tiems žmonėms, kurie valgo reguliariai, įskaitant pusryčius. Svarbu su maistu reguliariai gauti angliavandenių, kadangi valgant vėlai, mažai arba maistą, kuriame angliavandenių yra nedaug, padidėja hipoglikemijos rizika. Laikantis mažai kaloringos dietos, po ilgalaikių arba sunkių pratimų, išgėrus alkoholio arba vartojant kartu kelis hipoglikeminį poveikį sukeliančius preparatus, hipoglikemija pasireiškia greičiau.

Hipoglikemija gali pasireikšti vartojant sulfonilkarbamido darinių, (žr. 4.8 skyrių). Kai kada ji gali būti sunki ir ilgalaikė. Tokiu atveju ligonį gali prireikti stacionarizuoti ir kelias dienas gydyti gliukoze.

Kad hipoglikemijos pasireiškimo rizika sumažėtų, reikia atidžiai ištirti, ar DIAPREL MR gydyti galima, tiksliai nustatyti jo dozę ir gerai pacientui paaiškinti, kaip šio preparato vartoti.

Hipoglikemijos pasireiškimo rizika didėja, jeigu:

- pacientas nevykdo arba neįstengia vykdyti (ypač senyvi žmonės) vartojimo nurodymų;
- pacientas maitinasi prastai, nereguliariai, praleidžia valgymą, badauja ar pakeičia dietą;
- nėra pusiausvyros tarp fizinio krūvio ir angliavandenių vartojimo;
- yra inkstų nepakankamumas;
- yra sunkus kepenų nepakankamumas;
- perdozuojama DIAPREL MR;
- yra kai kurių endokrininės sistemos sutrikimų: skydliaukės funkcijos sutrikimas, hipofizės ar antinksčių nepakankamumas;
- kartu vartojama kitokių preparatų (žr. 4.5 skyrių).

Pacientų, sergančių kepenų nepakankamumu arba sunkiu inkstų nepakankamumu, organizme gliklazido farmakokinetika ir (arba) farmakodinamika gali kisti. Tokiems ligoniams pasireiškusi hipoglikemija gali išsilaikyti ilgiau, todėl būtinas tinkamas gydymas.

Informacija pacientams

Pacientus ir jų šeimos narius reikia informuoti apie hipoglikemijos galimybę, simptomus (žr. 4.8 skyrių), gydymą bei veiksnius, skatinančius jos pasireišimą. Pacientui reikia paaiškinti, kad labai svarbu laikytis nurodytos dietos, reguliariai atlikinėti fizinius pratimus ir reguliariai matuoti gliukozės kiekį kraujyje.

Silpnas gliukozės kiekio kraujyje mažėjimas

Gliukozės kiekį kraujyje reguliuojantis vaistinių preparatų nuo diabeto poveikis gali kisti dėl karščiavimo, traumos, infekcijos ar operacijos. Tokiu atveju kai kuriems ligoniams gali prireikti vartoti insuliną.

Bet kokio geriamojo vaisto nuo cukrinio diabeto hipoglikeminį poveikį daugelis pacientų pajunta per tam tikrą laiką; tai gali priklausyti nuo diabeto sunkumo progresavimo arba dėl sumažėjusios reakcijos į gydymą. Šis reiškinys žinomas kaip antrinis neveiksmingumas, kuris skiriasi nuo pirminio, kada veiklioji medžiaga yra neveiksminga pirmosios terapijos metu. Prieš darant išvadą, kad pasireiškė antrinis neveiksmingumas, būtina apsvarstyti, ar tinkamai parinkta dozė ir ar pacientas laikosi nurodytos dietos.

Glikemijos sutrikimas

Buvo pranešta apie gliukozės koncentracijų sutrikimus, įskaitant hipoglikemiją ir hiperglikemiją, cukriniu diabetu sergančių pacientų, kartu su gliklazidu gydomų fluorochinolonais, kraujyje, ypač gydant senyvus pacientus. Todėl rekomenduojama atidžiai matuoti gliukozės koncentracijas visų pacientų, kurie DIAPREL MR 60 mg vartoja kartu su fluorochinolonu, kraujyje.

Laboratoriniai tyrimai

Siekiant įvertinti gliukozės kiekio kraujyje kontrolę, rekomenduojama matuoti glikozilinto hemoglobino koncentraciją arba gliukozės koncentraciją veniniame kraujyje nevalgius. Gali būti naudingi ir paties paciento atliekami gliukozės koncentracijos kraujyje matavimai.

Gydymas sulfonilkarbamido preparatais pacientams, kuriems yra gliukozės-6-fosfatdehidrogenazės (G6PD) nepakankamumas, gali sukelti hemolizinę anemiją. Kadangi gliklazidas priklauso cheminei sulfonilkarbamido preparatų grupei, jį reikia atsargiai skirti pacientams, kuriems yra G6PD nepakankamumas, o taip pat reikia apsvarstyti kitų preparatų, nepriklausančių sulfonilkarbamido preparatų grupei, vartojimą.

Pagalbinės medžiagos

DIAPREL MR negalima vartoti pacientams, kuriems nustatytas retas paveldimas sutrikimas – galaktozės netoleravimas, *Lapp* laktazės stygius arba gliukozės ir galaktozės malabsorbcija.

4.5 Sąveika su kitais vaistiniais preparatais ir kitokia sąveika

Preparatai, galintys didinti hipoglikemijos pasireiškimo galimybę

Vaistiniai preparatai, kurių kartu su gliklazidu vartoti draudžiama

▪ **Mikonazolas** (sisteminio poveikio preparatai, burnos gleivinės gelis). Stiprėja gliukozės kiekio kraujyje mažėjimas, todėl gali atsirasti hipoglikemijos simptomų, pasireikšti net koma.

Vaistiniai preparatai, kurių kartu su gliklazidu vartoti nerekomenduojama

▪ **Fenilbutazonas** (sisteminio poveikio preparatai). Stiprina gliukozės kiekį kraujyje mažinantį sulfonilkarbamido darinių poveikį, atpalaiduodami juos iš junginių su kraujo plazmos baltymais ir (arba) mažindami jų eliminaciją.

Vadinasi, kartu su gliklazidu reikėtų vartoti kitokių preparatų nuo uždegimo, priešingu atveju pacientą reikia apie tai informuoti ir įspėti, kad tokiu atveju labai svarbu sekti preparato poveikį. Gydymo vaistiniais preparatais nuo uždegimo metu ir po jo galima, jei reikia, mažinti gliklazido dozę.

▪ **Alkoholis**. Alkoholis stiprina gliukozės kiekio mažėjimą kraujyje (slopina kompensacijos reakcijas), todėl gali prasidėti hipoglikeminė koma. Gliklazido vartojant, alkoholio ar medikamentų, kuriuose jo yra, vartoti negalima.

Vaistiniai preparatai, kuriuos kartu su gliklazidu reikia vartoti atsargiai

Gliukozės koncentracijos kraujyje mažėjimo poveikis gali sustiprėti, todėl kai kuriais atvejais, vartojant vieną iš toliau išvardytų vaistų, gali pasireikšti hipoglikemija: kiti vaistai nuo cukrinio diabeto (insulinas, akarbozė, metforminas, tiazolidinedionai, dipeptidil-peptidazės-4 inhibitoriai, į gliukagoną panašaus peptido-1 (GLP-1) receptorių agonistai), beta-blokatoriai, flukonazolas, angiotenziną konvertuojančių fermentų inhibitoriai (kaptoprilis, enalaprilis), H₂-receptorių antagonistai, MAO inhibitoriai, sulfonamidai, klaritromicinas, nesteroidiniai vaistai nuo uždegimo.

Vaistiniai preparatai, galintys didinti gliukozės kiekį kraujyje

Preparatai, kurių kartu su gliklazidu vartoti nerekomenduojama

- **Danazolas.** Jis skatina cukrinio diabeto pasireiškimą. Jeigu jo vartoti būtina, pacientui būtina apie tai paaiškinti ir jį įspėti, kad labai svarbu matuoti gliukozės kiekį kraujyje ir šlapime. Gydomo danazolu metu ir po jo gali prireikti keisti vaistų nuo diabeto dozę.

Vaistiniai preparatai, kurių kartu su gliklazidu reikia vartoti atsargiai

- **Chlorpromazinas** (neuroleptikas). Didelė (> 100 mg) chlorpromazino paros dozė didina gliukozės kiekį kraujyje (mažina insulino išsiskyrimą). Pacientą reikia įspėti ir pabrėžti gliukozės kiekio kraujyje matavimo svarbą. Gydomo neuroleptiku metu ir po jo gali prireikti keisti preparatų nuo diabeto dozę.
- **Gliukokortikoidai** (sisteminio bei lokalaus poveikio, pvz., injekuojamų į sąnarius, tepamų ant odos bei vartojamų į tiesiąją žarną preparatų) **ir tetrakozaktrinas.** Šie medikamentai didina gliukozės kiekį kraujyje, gali sukelti ketozę (gliukokortikoidai mažina angliavandenių toleravimą). Pacientą reikia apie tai informuoti ir jį įspėti, kad labai svarbu matuoti gliukozės kiekį kraujyje, ypač gydymo pradžioje. Gydomo gliukokortikoidais metu ir po jo gali prireikti mažinti preparatų nuo diabeto dozę.
- **Į veną vartojami ritodrinai, salbutamolius, terbutalinas.** Šie preparatai didina gliukozės kiekį kraujyje dėl beta-2 agonistų poveikio. Pacientą reikia įspėti, kad labai svarbu matuoti gliukozės kiekį kraujyje. Prireikus gliklazidą galima keisti insulinu.
- **Jonažolės (*Hypericum perforatum*) preparatai.** Jonažolės (*Hypericum perforatum*) preparatai mažina gliukozės koncentracijas kraujyje. Reikia pabrėžti gliukozės koncentracijų kraujyje matavimo svarbą.

Išvardyti vaistiniai preparatai gali sutrikdyti gliukozės koncentracijas kraujyje.

Vaistiniai preparatai, kuriuos vartoti kartu reikia atsargiai.

Fluorochinolonai. DIAPREL MR vartojant kartu su fluorochinolonu, pacientą reikia perspėti apie gliukozės koncentracijų kraujyje sutrikimo riziką ir pabrėžti gliukozės koncentracijų kraujyje matavimo svarbą.

Preparatai, į kurių vartojimą reikia atkreipti dėmesį

- **Gydymas antikoaguliantais** (pvz., varfarinu): gydant kartu vartojami sulfonilkarbamido dariniai gali stiprinti kartu vartojamų antikoaguliantų poveikį. Gali reikėti koreguoti antikoagulianto dozę.

4.6 Vaisingumas, nėštumo ir žindymo laikotarpis

Nėštumas

Duomenų apie gliklazido vartojimą nėštumo metu nėra arba jų nepakanka (duomenų yra mažiau kaip 300 nėštumų baigtys). Duomenų apie gydymą kitais sulfonilkarbamido dariniais yra nedaug. Tyrimų su gyvūnais metu teratogeninis poveikis nepasireiškė (žr. 5.3 skyrių.).

Nėštumo metu gliklazido rekomenduojama nevartoti.

Siekiant sumažinti su nekontroliuojamu diabetu susijusių apsigimimų riziką, diabeto kontrolę būtina pasiekti prieš pastojimą.

Nėščioms moterims geriamieji gliukozės koncentraciją kraujyje mažinantys preparatai netinka, pirmiausia pasirinktinai preparatas yra insulinas. Insuliną pradėti vartoti vietoj geriamųjų gliukozės koncentraciją kraujyje mažinančių vaistų rekomenduojama prieš pastojimą arba tuoj pat po nėštumo nustatymo.

Žindymas

Ar gliklazido ir jo metabolitų patenka į moters pieną, nežinoma. Dėl hipoglikemijos pavojus naujagimiui žindančioms moterims šį vaistinį preparatą vartoti draudžiama. Pavojus žindomiems naujagimiams ar kūdikiams negalima atmesti.

Vaisingumas

Jokio poveikio vaisingumui ar su reprodukcija susijusiam elgesiui žiurkių patinams ir patelėms pastebėta nebuvo (žr. 5.3 skyrių).

4.7 Poveikis gebėjimui vairuoti ir valdyti mechanizmus

DIAPREL MR gebėjimo vairuoti ir valdyti mechanizmus neveikia, tačiau pacientą būtina perspėti apie hipoglikemijos simptomus. Vairuoti ir valdyti mechanizmus būtina atsargiai, ypač gydymo pradžioje.

4.8 Nepageidaujamas poveikis

Remiantis gliklazido vartojimo patirtimi, buvo pranešta apie toliau aprašomus nepageidaujamus reiškinius.

Dažniausia nepageidaujama reakcija, vartojant gliklazidą, yra hipoglikemija.

Jeigu valgoma nereguliariai, ypač jeigu koki kartą visai nevalgoma, DIAPREL MR gali sukelti hipoglikemiją. Galimi jos simptomai yra galvos skausmas, stiprus alkis, pykinimas, vėmimas, apatija, miego sutrikimas, ažitacija, agresija, gebėjimo sukaupti dėmesį sumažėjimas, sumažėjęs dėmesingumas ir reakcijos sulėtėjimas, depresija, sumišimas, regos ir kalbos sutrikimas, afazija, tremoras, parezė, jutimų sutrikimas, galvos svaigimas, bejėgiškumo pojūtis, savikontrolės stoka, delyras, konvulsijos, paviršinis kvėpavimas ir bradikardija, mieguistumas, sąmonės praradimas galimai sukeliantis komą ir mirtį.

Be to, gali atsirasti adrenerginės sistemos suaktyvėjimo simptomų: prakaitavimas, oda gali tapti šalta ir drėgna, nerimas, tachikardija, hipertenzija, palpitacija, krūtinės angina, aritmija.

Paprastai minėti simptomai išnyksta išgėrus angliavandenių (cukraus). Dirbtiniai saldikliai tokiu atveju nepadedą. Gydymo kitais sulfonilkarbamido dariniais patirtis rodo, kad hipoglikemija gali atsinaujinti net tuo atveju, jei pradinis jos gydymas buvo veiksmingas.

Jeigu hipoglikemijos priepuolis sunkus ar ilgalaikis, reikia skubaus gydymo arba net guldyti į ligoninę, net tuo atveju, jeigu pavartojus cukraus, hipoglikemija laikinai išnyksta.

Kitas nepageidaujamas poveikis

Buvo gauta pranešimų apie virškinimo trakto veiklos sutrikimus įskaitant pilvo skausmą, pykinimą, vėmimą, dispepsiją, viduriavimą ir vidurių užkietėjimą. Šie simptomai susilpnėja arba visai nepasireiškia, jeigu gliklazido geriama pusryčių metu.

Toliau pateikiamas rečiau pasireiškiantis poveikis

- Odos ir poodinio audinio sutrikimai: išbėrimas, niežulys, dilgėlinė, angioedema, eritema, makulopapulinis išbėrimas, pūslinės reakcijos (tokios kaip Stivenso-Džonsono (*Stevens-Johnson*) sindromas ir toksinė epidermio nekrolizė), ir išimtiniais atvejais, išbėrimas dėl vaistinio preparato poveikio su eozinofilija ir sisteminiais simptomais (*DRESS*).

- Kraujo ir limfinės sistemos sutrikimai: kraujo pokyčių atsiranda retai. Gali pasireikšti anemija, leukopenija, trombocitopenija, granulocitopenija. Vaisto vartojimą nutraukus, minėti pokyčiai paprastai išnyksta.
- Kepenų, tulžies pūslės ir latakų sutrikimai: kepenų fermentų (aspartataminotransferazės, alaninaminotransferazės, šarminės fosfatazės) padaugėjimas, hepatitas (pavieniais atvejais). Jeigu atsiranda cholestazinė gelta, gliklazido vartojimą būtina nutraukti.

Minėti simptomai paprastai išnyksta preparato vartojimą nutraukus.

Akių sutrikimai: pakitus gliukozės koncentracijai kraujyje (ypač gydymo pradžioje), laikinai gali sutrikti rega.

Sulfonilkarbamidų klasei būdingas poveikis

Kaip ir gydant kitokiais sulfonilkarbamido dariniais buvo stebimi šie nepageidaujami poveikiai: eritrocitopenija, agranulocitozė, hemolizinės anemija, pancytopenija, alerginis vaskulitas, hiponatremija, kepenų fermentų koncentracijos padidėjimas, kepenų funkcijos sutrikimas (pvz., pasireiškiant tulžies stazei ir gelta) ir hepatitas (sulfonilkarbamido vartojimą nutraukus, jis palengvėdavo, tačiau pavieniais atvejais sukeldavo gyvybei pavojingą kepenų nepakankamumą).

Pranešimas apie įtariamas nepageidaujamas reakcijas

Svarbu pranešti apie įtariamas nepageidaujamas reakcijas, pastebėtas po vaistinio preparato registracijos, nes tai leidžia nuolat stebėti vaistinio preparato naudos ir rizikos santykį. Sveikatos priežiūros specialistai turi pranešti apie bet kokias įtariamas nepageidaujamas reakcijas, užpildę interneto svetainėje <http://www.vvkt.lt/> esančią formą, ir pateikti ją Valstybinei vaistų kontrolės tarnybai prie Lietuvos Respublikos sveikatos apsaugos ministerijos vienu iš šių būdų: raštu (adresu Žirmūnų g. 139A, LT 09120 Vilnius), faksu (nemokamu fakso numeriu (8 800) 20 131), elektroniniu paštu (adresu NepageidaujamaR@vvkt.lt), per interneto svetainę (adresu <http://www.vvkt.lt>).

4.9 Perdozavimas

Sulfonilkarbamido darinių perdozavus, gali pasireikšti hipoglikemija.

Pasireiškus vidutinio sunkumo hipoglikemijai, nesusijusiai su sąmonės sutrikimo ir nervų sistemos funkcijos pažeidimu, reikia vartoti angliavandenių, keisti dozę ir (arba) dietą. Pacientą būtina atidžiai prižiūrėti tol, kol tampa aišku, kad pavojus nebegresia.

Pasireiškus sunkiai hipoglikemijai, susijusiai su koma, traukuliais arba kitokiais nervų sistemos pažeidimo požymiais, pacientą būtina stacionarizuoti ir gydyti skubios pagalbos priemonėmis.

Nustačius hipoglikeminę komą arba įtarus, jog ji galima, pacientui būtina greitai į veną injekuoti 50 ml koncentruoto (20 – 30 %) gliukozės tirpalo. Po to reikia nepertraukiamai į veną infuzuoti mažesnės koncentracijos (10 %) gliukozės tirpalo tokiu greičiu, kad jos koncentracija kraujyje būtų didesnė negu 1 g/l. Infuzijos metu pacientą būtina atidžiai prižiūrėti. Ar ligonį reikia prižiūrėti ir toliau, sprendžia gydytojas, atsižvelgdamas į jo būklę.

Dializė nepadeda, kadangi preparatas stipriai prisijungia prie kraujo plazmos baltymų.

5. FARMAKOLOGINĖS SAVYBĖS

5.1 Farmakodinaminės savybės

Farmakoterapinė grupė: sulfonamidai, karbamido dariniai, ATC kodas – A10BB09

Veikimo mechanizmas

Gliklazidas yra geriamoji antidiabetinė hipoglikemizuojanti sulfonilkarbamido veiklioji medžiaga, kuri nuo kitų panašių junginių skiriasi azotą turinčiu heterocikliniu žiedu su vidinėmis grandimis.

Gliklazidas mažina gliukozės koncentraciją kraujyje, stimuliuodamas insulino išskyrimą iš Langerhanso salelių β -ląstelių. Popietinio insulino ir C-peptido išskyrimo padidėjimas išlieka praėjus dvejiems metams po gydymo.

Be šių metabolinių savybių, gliklazidas turi ir hemovaskulinių savybių.

Farmakodinaminis poveikis

Poveikis insulino išskyrimui

Žmonėms, sergantiems 2 tipo cukriniu diabetu, gliklazidas išlaiko pirmąjį insulino išskyrimo, susijusio su gliukozės vartojimu, piką ir padidina antrąjį insulino išskyrimo fazę. Insulino atsakas gerokai padidėja, stimuliuojant maistu arba gliukoze.

Hemovaskulinės savybės

Gliklazidas mažina mikrotrombozes dviem veikimo būdais, kurie gali būti priskiriami diabeto komplikacijoms:

- Trombocitų agregacijos ir adhezijos dalinis slopinimas su padidėjusiais trombocitų aktyvacijos žymenimis (beta tromboglobulinas, tromboksanas B₂).
- Poveikis kraujagyslių endotelio fibrinoliziniui aktyvumui su padidėjusiu audinių plazminogeno aktyvatoriaus (tPA) aktyvumu.

5.2 Farmakokinetinės savybės

Absorbcija

Pavartojus vaisto, gliklazido koncentracija kraujo plazmoje progresyviai didėja pirmąsias 6 valandas, kol pasiekia stabilizaciją, kuri tęsiasi nuo šešių iki dvylikos valandų.

Atskirų individų organizme skirtumai yra nedideli.

Gliklazidas visiškai absorbuojamas. Valgymas absorbcijos greičio ir kiekio neveikia.

Pasiskirstymas

Susijungimas su plazmos baltymais yra apie 95 %. Pasiskirstymo tūris yra apie 30 litrų. Vienkartinė DIAPREL MR paros dozė palaiko veiksmingą gliklazido koncentraciją kraujo plazmoje daugiau nei 24 valandas.

Biotransformacija

Gliklazidas daugiausia metabolizuojamas kepenyse ir išskiriamas su šlapimu: mažiau nei 1 % nepakitusio gliklazido randama šlapime. Aktyvių metabolitų plazmoje nerasta.

Eliminacija

Gliklazido pusinės eliminacijos laikas yra 12–20 valandų.

Tiesinis / netiesinis pobūdis

Santykio kreivė tarp paskirtosios dozės ribų iki 120 mg ir ploto po koncentracijos laiko kreivė yra linijinė.

Ypatingos populiacijos

Senyviems pacientams

Kliniškai reikšmingų farmakokinetinių rodmenų pokyčių vyresniojo amžiaus pacientų organizme nepastebėta.

5.3 Ikiklinikinių saugumo tyrimų duomenys

Įprastų farmakologinio saugumo, kartotinių dozių toksiškumo, genotoksiškumo ikiklinikinių tyrimų duomenys specifinio pavojaus žmogui nerodo. Ilgalaikiai karcinogeniškumo tyrimai nebuvo atliekami. Tyrimų su gyvūnais metu teratogeninio poveikio nepastebėta, bet gyvūnams duodant 25 kartus didesnes dozes, nei rekomenduojamos žmogui, pastebėtas vaisiaus kūno masės sumažėjimas. Tyrimuose, atliktuose su gyvūnais, kuriems buvo skiriama gliklazido, nebuvo nustatyta poveikio vaisingumui ir su reprodukcija susijusiam elgesiui.

6. FARMACINĖ INFORMACIJA

6.1 Pagalbinių medžiagų sąrašas

Laktozė monohidratas
Maltodekstrinas
Hipromeliozė
Magnio stearatas
Koloidinis bevandenis silicio dioksidas

6.2 Nesuderinamumas

Duomenys nebūtini.

6.3 Tinkamumo laikas

3 metai

6.4 Specialios laikymo sąlygos

Šiam vaistiniam preparatui specialių laikymo sąlygų nereikia.

6.5 Talpyklės pobūdis ir jos turinys

Permatomos PVC/Al lizdinės plokštelės kartono dėžutėje.

Pakuočių dydžiai

7, 10, 14, 15, 20, 28, 30, 56, 60, 84, 90, 100, 112, 120, 180 ir 500 tablečių.
Gali būti tiekiamos ne visų dydžių pakuotės.

6.6 Specialūs reikalavimai atliekoms tvarkyti

Specialių reikalavimų nėra.

Nesuvartotą vaistinį preparatą ar atliekas reikia tvarkyti laikantis vietinių reikalavimų.

7. REGISTRUOTOJAS

Les Laboratoires Servier
50, rue Carnot
92284 Suresnes cedex
Prancūzija

8. REGISTRACIJOS PAŽYMĖJIMO NUMERIS (-IAI)

N7 - LT/1/05/0200/016
N10 - LT/1/05/0200/017
N14 - LT/1/05/0200/018
N15 - LT/1/05/0200/019
N20 - LT/1/05/0200/020
N28 - LT/1/05/0200/021
N30 - LT/1/05/0200/022
N56 - LT/1/05/0200/023
N60 - LT/1/05/0200/024
N84 - LT/1/05/0200/025
N90 - LT/1/05/0200/026
N100 - LT/1/05/0200/027
N112 - LT/1/05/0200/028
N120 - LT/1/05/0200/029
N180 - LT/1/05/0200/030
N500 - LT/1/05/0200/031

9. REGISTRAVIMO / PERREGISTRAVIMO DATA

Registravimo data 2009 m. gruodžio mėn. 23 d.
Paskutinio perregistravimo data 2016 m. rugpjūčio mėn. 8 d.

10. TEKSTO PERŽIŪROS DATA

2016 m. rugpjūčio mėn. 8 d.

Išsami informacija apie šį vaistinį preparatą pateikiama Valstybinės vaistų kontrolės tarnybos prie Lietuvos Respublikos sveikatos apsaugos ministerijos tinklapyje <http://www.vvkt.lt/>