

Препараты сульфонилмочевин ы



Как это неоднократно случалось в истории фармакологии, побочное действие какого-либо вещества часто становилось основным действием нового класса препаратов. Так, в середине 40-х годов при изучении антибактериальных свойств сульфаниламидов M. Janbon случайно обнаружил их побочное действие в виде гипогликемии у лабораторных животных. Это привело к созданию нового класса сахароснижающих препаратов - ПСМ, промышленное производство 1 генерации которых было начато в 1955-56 гг.

ПЕРВАЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1955-1956 гг.

карбутамид, толбутамид, хлорпропамид
(эффективная пероральная терапия для пациентов с сахарным диабетом второго типа).

ВТОРАЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1969 г.

глибенкламид, глипизид, гликвидон, гликлазид
(эффективная пероральная терапия с усилением характеристик безопасности).

ТРЕТЬЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1995 г.

глимепирид: **Амарил®**
(эффективная пероральная терапия с усилением характеристики безопасности и низким риском развития гипогликемии, инсулино-сберегающим эффектом, удобным режимом дозирования).

Производные сульфонилмочевины

- Глибенкламид (глибенкламид, манинил)
- Гликлазид (диабетон МВ, гликлазид)
- Гликвидон (глюренорм)
- Глимепирид (амарил)

Механизм действия

Препараты сульфонилмочевины усиливают секрецию инсулина за счёт стимуляции бета-клеток поджелудочной железы (поэтому действуют до тех пор, пока не истощены резервы инсулин-синтетической функции поджелудочной железы). В результате восстанавливается чувствительность бета-клеток, увеличивается число инсулиновых рецепторов.

- **Механизм действия ПСМ связан:**
- со стимуляцией секреции эндогенного инсулина β -клетками
- с подавлением продукции глюкагона
- с улучшением чувствительности инсулинзависимых тканей

Плюсы

- Выраженный сахароснижающий эффект (практически такой же, как у метформина): препараты сульфонилмочевины позволяют уменьшить содержание HbA_{1c} примерно на 1,5-2%
- Стимуляция раннего пика секреции инсулина (только препараты сульфонилмочевины 3-его поколения).
- Препараты сульфонилмочевины 3-го поколения (Амарил и Диабетон МВ) блокируют селективно только калиевые каналы бета-клеток поджелудочной железы. Поэтому пациентов получающих эти сахароснижающие препараты не обязательно переводить на инсулин на фоне острого коронарного синдрома.

Минусы

- Стимуляция позднего пика секреции инсулина препаратами сульфонилмочевины 2-го поколения (манинил и др.) вызывает чувство голода и ведёт к прибавке массы тела (примерно на 2 кг).
- Препараты сульфонилмочевины 2-го поколения (манинил и др.) влияют на калиевые каналы, находящиеся в кардиомиоцитах и в сосудах. Было замечено, что у пациентов с сахарным диабетом 2 типа, получавших препараты сульфонилмочевины 1-го и 2-го поколения, инфаркт миокарда происходил чаще и протекал тяжелее. Отсюда требование: в момент сердечной катастрофы манинил надо отменить и назначить инсулин.

Показания

Сахарный диабет 2 типа, когда диета и физические нагрузки, назначение акарбозы и метформина оказались неэффективными.

Противопоказания включают:

- Сахарный диабет 1 типа.
- Беременность и кормление грудью.
- Гиперчувствительность (в том числе к сульфаниламидным препаратам, тиазидным диуретикам).
- Тяжёлые формы сахарного диабета (при выраженной недостаточности бета-клеток, когда требуется инсулинотерапия), кетоацидоз, диабетическая прекома и кома.
- Нарушения функции щитовидной железы (некомпенсированный гипо- или гипертиреоз), нарушение функции печени и почек, лейкопения, кахексия.

Побочные эффекты

Среди побочных эффектов встречается гипогликемия (возможна при передозировке препарата, пропуске пищи, злоупотреблении алкоголем). Иногда развиваются диспепсические расстройства (в том числе тошнота, рвота, диарея), холестааз, повышение массы тела, обратимые лейкопения, тромбоцитопения, в отдельных случаях — апластическая и гемолитическая анемия, аллергические реакции (зуд, кожная сыпь, артралгия, повышение температуры тела, протеинурия). В начале лечения возможно преходящее расстройство аккомодации, фоточувствительность.

Диабетон МВ

Диабетон МВ – единственный препарат сульфонилмочевины, для которого была доказана эффективность в профилактике серьезных осложнений у пациентов с сахарным диабетом.

ADVANCE¹



Смерть
от ССЗ
-12%

$P=0.12$

Нефропатия

-21%

$P=0.006$



На фоне приема глибенкламида:

Все диабетические осложнения

-12%

Микрососудистые осложнения

-25%

Инфаркт миокарда

-16%

Ретинопатии

-21%

Альбуминурия

-33%

Меры предосторожности

- Во время лечения препаратами сульфонилмочевины следует учитывать лекарственные взаимодействия. Например, при совместном применении с антибактериальными сульфаниламидами, тетрациклинами, фторхинолонами, непрямыми антикоагулянтами, салицилатами возможно усиление сахароснижающего действия (**риск гипогликемии!**)
- Употребление алкогольных напитков также **усиливает** сахароснижающий эффект. Кроме того, препараты сульфонилмочевины могут вызывать на фоне приёма алкоголя **антабусоподобные реакции** (тахикардия, головная боль, чувство жара).
- Сочетание препаратов сульфонилмочевины с диуретиками тиазидового ряда или антагонистами кальция может вести **к ослаблению** сахароснижающего эффекта: тиазиды (гипотиазид) препятствуют открытию калиевых каналов, антагонисты кальция (нифедипин, дилтиазем, верапамил) нарушают поступление ионов кальция в бета-клетки поджелудочной железы.
- Для профилактики гипогликемических состояний необходимо не пропускать приёмы пищи, не голодать. Допускается отсрочить приём

Одна таблетка содержит:
Глибенкламида — 5 мг.

Применять по назначению врача.
Хранить в недоступном для детей месте.
Хранить в защищенном от света месте
при температуре не выше 25 °С.

50
таблеток

ГЛИБЕНКЛАМИД-БЕЛМЕД
GLIBENCLAMIDE **5 мг**

ГЛИБЕНКЛАМИД-
БЕЛМЕД



РУП "БЕЛМЕДПРЕПАРАТЫ"

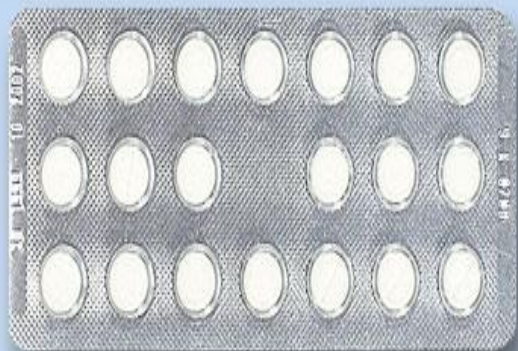


Существует еще простой Диабетон (без МВ). Это тоже оригинальный препарат, хотя применяют его в последние годы все реже и реже. Связано это с тем, что прием Диабетона МВ более рационален и удобен для больных сахарным диабетом. Дело в том, что таблетки Диабетона МВ создаются на основе гидрофильного матрикса. Это означает, что человек может принять всего одну таблетку препарата в сутки, и она будет обеспечивать нормогликемию в его организме в течение 24 часов! Помимо этого, такие таблетки уникальны еще тем, что характеризуются максимальным высвобождением своего активного компонента во время приемов пищи. В остальное время суток Диабетон МВ обеспечивает контроль гликемии благодаря мизерным потокам гликлазида в кровяное русло. Благодаря указанному преимуществу Диабетона МВ этот препарат реже, чем все остальные препараты из группы производных сульфонилмочевины приводит к развитию такого опасного побочного эффекта, как гипогликемия. Поэтому перед эндокринологами открывается прекрасная возможность без опаски повышать дозу лекарственного средства по мере необходимости для того, чтобы полностью взять под контроль течение болезни, и максимально скомпенсировать ее у своих пациентов.

60 таблеток по 80мг

ДИАБЕТОН®
Гликлазид

Хранить при температуре ниже 30 °С,
в недоступных для детей местах



Хранить в недоступных для детей местах
Специальных условий хранения не требуется

ДИАБЕТОН® МВ 60мг

Гликлазид
Таблетки с модифицированным высвобождением

30 таблеток



Одна таблетка с модифицированным высвобождением препарата Диабетон MR 60 мг эквивалентная двум таблеткам с модифицированным высвобождением препарата Диабетон MR по 30 мг. Таблетку с модифицированным высвобождением препарата Диабетон MR 60 мг можно делить, что дает возможность применять препарат в дозе 30 мг (1/2 таблетки) и в дозе 90 мг (1,5 таблетки). Переход пациента с лечения препаратом, содержащим гликлазид 80 мг, на прием Диабетона MR 60 мг, таблетки с модифицированным высвобождением: 1 таблетка, содержащая гликлазид 80 мг, соответствует 1/2 таблетки Диабетона MR 60 мг. Необходимо тщательно контролировать показатели крови во время перехода на Диабетон MR 60 мг.

- Переход пациента с лечения другими пероральными сахароснижающими препаратами на Диабетон MR 60 мг: Диабетон MR 60 мг может быть назначен вместо другого перорального сахароснижающего препарата. При этом надо учитывать дозирование и период полувыведения последнего. Переходный период, как правило, не нужен.
- Начинать нужно с дозы 30 мг с последующей коррекцией дозы. При переходе с сахароснижающих препаратов сульфаниламочевины, имеющих более продолжительный период полувыведения, чем Диабетон MR 60 мг, перерыв в лечении на несколько дней может быть необходим с целью предупреждения аддитивного эффекта двух препаратов и развития гипогликемии. Лечение препаратом Диабетон MR 60 мг начинают с дозы 30 мг/сут (1/2 таблетки) с последующей коррекцией дозы с соблюдением правил, которые описаны ранее
- Одновременное применение с другими противодиабетическими препаратами: Диабетон MR 60 мг может применяться в комбинации с бигуанидами, ингибиторами α -глюкозидазы и инсулином.



