

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Glikuron, 60 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 60 mg gliklazydu.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki o przedłużonym uwalnianiu

Biała lub prawie biała, owalna, niepowlekana, podzielna tabletki z linią podziału po obu stronach i napisem „60” wytłoczonym po jednej stronie linii na jednej powierzchni tabletki. Wielkość tabletki: około 13,5 mm x 6,5 mm.

Tabletkę można podzielić na równe dawki.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Cukrzyca insulinoniezależna (typu 2) u dorosłych, u których nie uzyskano kontroli glikemii mimo leczenia dietetycznego, aktywności fizycznej i zmniejszenia masy ciała.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Glikuron 60 mg stosuje się doustnie w dawce 30-120 mg na dobę (od połowy do dwóch tabletek). Lek zażywa się raz na dobę podczas śniadania.

Zaleca się połykanie tabletek w całości. Nie zaleca się kruszenia ani rozgryzania tabletek.

W razie pominięcia dawki nie należy zwiększać dawki w kolejnym dniu.

Podobnie jak w przypadku innych leków hipoglikemizujących, dawkę należy dostosować w zależności od indywidualnej odpowiedzi na leczenie (stężenie glukozy we krwi, poziom HbA1c).

Dawka początkowa

Zalecana dawka początkowa to 30 mg (pół tabletki produktu Glikuron 60 mg) na dobę. Jeśli dawka umożliwia kontrolę glikemii, można ją kontynuować w leczeniu podtrzymującym. Jeśli kontrola glikemii jest niewystarczająca, dawkę można stopniowo zwiększać do 60, 90 lub 120 mg na dobę.

Odstęp pomiędzy każdym zwiększeniem dawki powinien wynosić przynajmniej 1 miesiąc. Nie dotyczy to tylko pacjentów, u których stężenie glukozy nie uległo zmniejszeniu po dwóch tygodniach leczenia. W takich przypadkach dawka może być zwiększona pod koniec drugiego tygodnia leczenia.

Maksymalna zalecana dawka dobowa wynosi 120 mg.

Jedna tabletko o przedłużonym uwalnianiu produktu Glikuron 60 mg jest równoważna dwóm tabletkom o przedłużonym uwalnianiu o mocy 30 mg. Tabletki Glikuron 60 mg o przedłużonym uwalnianiu są podzielne, dzięki czemu można łatwo modyfikować dawkowanie.

Przejsie na leczenie produktem Glikuron 60 mg z leczenia innym doustnym lekiem przeciwcukrzycowym:

Produkt leczniczy Glikuron 60 mg można stosować w celu zastąpienia innego doustnego leku przeciwcukrzycowego.

Przy przejściu na leczenie produktem Glikuron 60 mg należy uwzględnić dawkę i okres półtrwania poprzedniego leku przeciwcukrzycowego.

Nie ma potrzeby stosowania przejściowego okresu dawkowania. Leczenie należy rozpocząć od dawki 30 mg, a następnie w razie potrzeby dostosować dawkowanie w zależności od glikemii, zgodnie z opisem powyżej.

Jeśli dotychczas stosowano pochodne sulfonilomocznika o długim okresie półtrwania, konieczna może być kilkudniowa przerwa w leczeniu, aby zapobiec nakładaniu się działania leków i hipoglikemii. Podczas przechodzenia na leczenie produktem Glikuron 60 mg należy stosować taki sam schemat dawkowania jak na początku leczenia produktem Glikuron 60 mg (początkowo dawka 30 mg na dobę, a następnie stopniowo zwiększać dawkę w zależności od odpowiedzi na leczenie).

Leczenie skojarzone z innymi lekami przeciwcukrzycowymi:

Produkt Glikuron 60 mg można stosować w skojarzeniu z pochodnymi biguanidu, inhibitorami alfa-glukozydazy lub insuliną.

W przypadku nieadekwatnej kontroli glikemii przy monoterapii produktem Glikuron 60 mg można dołączyć insulinę pod ścisłą kontrolą lekarza.

Szczególne grupy pacjentów

Osoby w podeszłym wieku

Należy stosować takie samo dawkowanie produktu Glikuron 60 mg jak u pacjentów w wieku poniżej 65 lat.

Pacjenci z zaburzeniem czynności nerek

U pacjentów z łagodnym lub umiarkowanym zaburzeniem czynności nerek należy stosować taki sam schemat dawkowania jak u pacjentów z prawidłową czynnością nerek. Podczas leczenia należy ściśle kontrolować stan pacjenta. Zalecenie potwierdzono w badaniach klinicznych.

Ryzyko hipoglikemii jest zwiększone w następujących zaburzeniach:

- Niedożywienie, zaburzenia odżywiania.
- Ciężkie lub niewyrównane zaburzenia endokrynologiczne (niedoczynność przysadki, niedoczynność tarczycy, niewydolność kory nadnerczy).
- Przerwanie kortykosteroidoterapii prowadzonej przez długi okres i (lub) dużymi dawkami.
- Ciężkie zaburzenia naczyniowe (ciężka choroba wieńcowa, ciężka niewydolność tętnicy szylnej, rozlane zmiany naczyń obwodowych).

Zalecana minimalna dawka początkowa to 30 mg na dobę.

Dzieci i młodzież

Nie określono dotychczas bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności produktu leczniczego Glikuron 60 mg u dzieci i młodzieży. Nie ma dostępnych danych.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1 lub pochodne sulfonilomocznika, sulfonamidy, cukrzyca typu I, stan przedśpiączkowy lub śpiączka cukrzycowa, kwasica ketonowa, ciężkie zaburzenie czynności nerek lub wątroby (w takich przypadkach zaleca się insulinoterapię); leczenie mikonazolem (patrz punkt 4.5), karmienie piersią (patrz punkt 4.6).

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Hipoglikemia

Lek można stosować wyłącznie u pacjentów regularnie spożywających śniadania i pozostałe posiłki. Ważne jest regularne przyjmowanie węglowodanów ze względu na zwiększone ryzyko hipoglikemii w przypadku opóźnienia lub pominięcia posiłku, albo przyjmowania niewystarczającej ilości pożywienia lub węglowodanów. Hipoglikemia jest bardziej prawdopodobna podczas stosowania diet niskokalorycznych, po długotrwałym lub forsownym wysiłku fizycznym, po spożyciu alkoholu lub w przypadku skojarzonego stosowania leków hipoglikemizujących.

Hipoglikemia może wystąpić po podaniu pochodnych sulfonilomocznika (patrz punkt 4.8). Niekiedy hipoglikemia może mieć znaczne nasilenie i długotrwały przebieg. Może być konieczne podawanie roztworu glukozy i leczenie w szpitalu przez kilka dni.

Aby zmniejszyć ryzyko hipoglikemii, należy ostrożnie dobierać pacjentów i ustalać dawkowanie oraz dokładnie informować pacjentów o metodach zapobiegania i objawach hipoglikemii.

Czynniki zwiększające ryzyko hipoglikemii:

- brak współpracy pacjenta lub niezdolność do współpracy (szczególnie w przypadku pacjentów w podeszłym wieku),
- niedożywienie, nieregularne przyjmowanie posiłków, opuszczanie posiłków, post lub zmiany diety,
- brak równowagi pomiędzy wysiłkiem fizycznym i przyjmowaniem węglowodanów,
- zaburzenie czynności nerek,
- ciężkie zaburzenie czynności wątroby,
- przedawkowanie produktu Glikuron,
- określone zaburzenia endokrynologiczne: zaburzenia czynności tarczycy, niedoczynność przysadki oraz niewydolność nadnerczy,
- skojarzone stosowanie określonych produktów leczniczych (patrz punkt 4.5).

Zaburzenie czynności nerek i wątroby: niewydolność wątroby lub ciężka niewydolność nerek może wpływać na farmakokinetykę i (lub) farmakodynamikę gliklazydu. W takich przypadkach incydenty hipoglikemii mogą się przedłużać i konieczne może być specjalne postępowanie.

Informacje dla pacjentów:

Należy wyjaśnić pacjentowi i członkom rodziny pacjenta czynniki ryzyka hipoglikemii, jej objawy (patrz punkt 4.8), leczenie i zaburzenia zwiększające ryzyko wystąpienia.

Należy poinformować pacjenta jak ważne jest stosowanie się do zaleceń dietetycznych, regularne ćwiczenia fizyczne i regularne oznaczanie stężenia glukozy we krwi.

Niedostateczna kontrola glikemii:

Na kontrolę glikemii u pacjentów przyjmujących leki przeciwcukrzycowe mogą wpływać następujące stany: stosowanie preparatów zawierających ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*)

(patrz punkt 4.5), gorączka, uraz, zakażenie lub zabieg chirurgiczny. W niektórych przypadkach może być konieczne podanie insuliny.

U wielu pacjentów skuteczność działania hipoglikemizującego gliklazydu i pozostałych leków przeciwcukrzycowych stosowanych doustnie ulega z czasem stopniowemu osłabieniu. Może to wynikać ze stopniowego pogłębiania się cukrzycy lub z osłabienia odpowiedzi na leczenie. Zjawisko to jest określane jako wtórna nieskuteczność leczenia i różni się od pierwotnej nieskuteczności rozpoznawanej na początku leczenia pierwszego rzutu. Przed rozpoznaniem wtórnej nieskuteczności leczenia należy rozważyć dostosowanie dawki oraz potwierdzić stosowanie właściwej diety.

Zaburzenia stężenia glukozy we krwi:

U pacjentów z cukrzycą stosujących jednocześnie leczenie fluorochinolonami, zwłaszcza w podeszłym wieku, zgłaszano zaburzenia stężenia glukozy we krwi, w tym hipoglikemię i hiperglikemię. U wszystkich pacjentów stosujących w tym samym czasie produkt leczniczy Glikuron i fluorochinolony zaleca się staranne monitorowanie stężenia glukozy we krwi.

Wyniki badań laboratoryjnych:

Zaleca się kontrolę glikemii przez badania hemoglobiny glikowanej (bądź badanie stężenia glukozy w krwi żyłnej na czczo). Pomocna może być samodzielna kontrola stężenia glukozy we krwi przez pacjentów.

Leczenie pochodnymi sulfonylomocznika u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej może wywoływać niedokrwistość hemolityczną. Gliklazyd należy do pochodnych sulfonylomocznika. U pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej należy rozważyć wskazania i zastosowanie innego leku spoza grupy pochodnych sulfonylomocznika.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

1) Następujące produkty lecznicze mogą zwiększać ryzyko hipoglikemii:

Przeciwwskazane skojarzenie lekowe

Mikonazol (do stosowania ogólnego, żel do stosowania w jamie ustnej): nasila działanie hipoglikemizujące i zwiększa ryzyko objawów hipoglikemii lub nawet śpiączki.

Niezalecane skojarzenia lekowe

Fenylobutazon (do stosowania ogólnoustrojowego): nasila działanie hipoglikemizujące pochodnych sulfonylomocznika poprzez zaburzenie łączenia z białkami osocza i (lub) zmniejszenie wydalania.

Zaleca się stosowanie innego leku przeciwzapalnego. Jeśli nie jest to możliwe, należy poinformować pacjenta o ryzyku i podkreślić istotną rolę samodzielnego monitorowania glikemii. W razie konieczności należy zmodyfikować dawkę podczas leczenia przeciwzapalnego i po jego zakończeniu.

Alkohol: nasila działanie hipoglikemizujące poprzez blokowanie mechanizmów kompensacyjnych. Po spożyciu alkoholu może wystąpić śpiączka hipoglikemiczna.

Należy unikać napojów alkoholowych i produktów leczniczych na bazie alkoholu.

Skojarzenia lekowe wymagające zachowania ostrożności

Następujące leki mogą nasilać działanie hipoglikemizujące a w konsekwencji (w niektórych przypadkach) zwiększać ryzyko hipoglikemii:

inne leki przeciwcukrzycowe (insuliny, akarboza, metformina, tiazolidynodiony, inhibitory dipeptylopeptydazy IV, agoniści receptorów GLP-1), leki blokujące receptory beta-adrenergiczne, flukonazol, inhibitory konwertazy angiotensyny (kaptopryl, enalapryl), leki blokujące receptory H₂, inhibitory MAO, sulfonamidy, klarytromycyna i niesteroidowe leki przeciwzapalne.

2) Następujące produkty lecznicze mogą zwiększać stężenie glukozy we krwi

Niezalecane skojarzenie lekowe

Danazol: działanie diabetogenne.

Jeżeli stosowanie danazolu jest konieczne, należy pouczyć pacjenta i podkreślić rolę kontroli stężenia glukozy we krwi i w moczu. Podczas leczenia danazolem i po jego zakończeniu konieczna może być modyfikacja dawkowania leku przeciwcukrzycowego.

Skojarzenia lekowe wymagające zachowania ostrożności

Chlorpromazyna (neuroleptyk): w dużych dawkach (>100 mg na dobę) zwiększa stężenie glukozy we krwi (zmniejsza wydzielanie insuliny).

Należy uprzedzić pacjenta i podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi. Podczas leczenia neuroleptykiem i po jego zakończeniu konieczna może być modyfikacja dawkowania leku przeciwcukrzycowego.

Glikokortykosteroidy (stosowane ogólnoustrojowo i miejscowo: produkty dostawowe, do stosowania na skórę oraz doodbytnicze) oraz tetrakozaktyd: zwiększenie stężenia glukozy we krwi i ryzyko wystąpienia kwasicy ketonowej wskutek zmniejszenia tolerancji węglowodanów pod wpływem działania glikokortykosteroidów.

Należy uprzedzić pacjenta i podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi, szczególnie na początku leczenia. Podczas leczenia glikokortykosteroidami i po jego zakończeniu konieczna może być modyfikacja dawkowania leku przeciwcukrzycowego.

Rytodryna, salbutamol, terbutalina (produkty dożyłne):

Zwiększenie stężenia glukozy we krwi wskutek działania agonistycznego na receptory beta-2-adrenergiczne. Należy podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi. W razie potrzeby należy przejść na leczenie insuliną.

Preparaty zawierające ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*)

Ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*) zmniejsza ekspozycję na gliklazyd. Należy podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi.

3) Następujące produkty mogą powodować zaburzenia stężenia glukozy we krwi

Równoczesne stosowanie wymagające ostrożności podczas stosowania

Fluorochinolony: w przypadku jednoczesnego stosowania produktu Glikuron i fluorochinolonów należy ostrzec pacjenta o ryzyku zaburzenia stężeń glukozy we krwi, należy podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi.

4) Leczenie skojarzone wymagające zachowania ostrożności

Leki przeciwzakrzepowe (np. warfaryna):

W przypadku leczenia skojarzonego pochodne sulfonilomocznika mogą nasilać działanie przeciwkrzepliwe.

Może być konieczna modyfikacja dawkowania antykoagulantu.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak danych dotyczących stosowania gliklazydu u kobiet w ciąży. Istnieją tylko ograniczone dane dotyczące stosowania pochodnych sulfonilomocznika u kobiet w ciąży.

Badania na zwierzętach nie wykazały działania teratogenne gliklazydu (patrz punkt 5.3).

W przypadku planowanej ciąży należy zapewnić dobrą kontrolę glikemii, aby zmniejszyć ryzyko wad wrodzonych u płodu wskutek niewyrównanej cukrzycy matki.

W leczeniu cukrzycy ciężarnych lekiem z wyboru jest insulina. Nie zaleca się stosowania doustnych leków hipoglikemizujących. Zaleca się odstawienie doustnych leków hipoglikemizujących i rozpoczęcie insulinoterapii przed planowaną ciążą lub bezzwłocznie po stwierdzeniu ciąży.

Karmienie piersią

Nie wiadomo czy gliklazyd/metabolity przenikają do mleka ludzkiego. Produkt jest przeciwwskazany podczas karmienia piersią ze względu na ryzyko wystąpienia hipoglikemii u noworodków.

Płodność

Nie obserwowano wpływu na płodność lub zdolność do rozrodu u samców czy samic szczurów (patrz punkt 5.3).

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Glikuron 60 mg nie ma wpływu na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Należy poinformować pacjenta o objawach hipoglikemii i konieczności zachowania ostrożności w czasie prowadzenia pojazdów i obsługi maszyn, zwłaszcza na początku leczenia.

4.8 Działania niepożądane

U pacjentów leczonych gliklazydem obserwowano poniższe działania niepożądane.

Hipoglikemia

Podobnie jak w przypadku innych pochodnych sulfonilomocznika podczas leczenia gliklazydem może wystąpić hipoglikemia, szczególnie jeśli pacjent nieregularnie spożywa posiłki. Ryzyko jest szczególnie duże u pacjentów opuszczających posiłki. Objawy hipoglikemii mogą obejmować ból głowy, silne uczucie głodu, nudności, wymioty, uczucie zmęczenia, zaburzenia snu, pobudzenie, agresję, zaburzenia koncentracji, zaburzenia świadomości, spowolnienie reakcji, depresję, splątanie, zaburzenia widzenia i mowy, afazję, drżenia mięśniowe, niedowład, zaburzenia czucia, zawroty głowy, uczucie bezsilności, utratę samokontroli, *delirum*, drgawki, spływanie oddechu, bradykardię, senność i utratę świadomości. Nieleczona hipoglikemia może prowadzić do śpiączki i zgonu.

Mogą również występować objawy pobudzenia adrenergicznego: potliwość, wilgotna skóra, lęk, tachykardia, zwiększenie ciśnienia tętniczego, kołatanie serca, objawy dławicowe i zaburzenia rytmu serca.

Zazwyczaj objawy ustępują po podaniu węglowodanów (cukru). Należy pamiętać, że sztuczne środki słodzące są nieskuteczne. Doświadczenia z innymi pochodnymi sulfonilomocznika sugerują, że hipoglikemia może nawracać po początkowej poprawie po leczeniu.

W przypadku ciężkiej lub długotrwałej hipoglikemii należy niezwłocznie rozpocząć kwalifikowane leczenie medyczne lub leczenie szpitalne, również jeśli po podaniu cukru nastąpiła tymczasowa poprawa.

Inne działania niepożądane:

Zaburzenia ze strony układu pokarmowego: ból brzucha, nudności, wymioty, niestrawność, biegunka i zaparcia. Objawom tym można zapobiec lub je złagodzić, przyjmując gliklazyd w trakcie śniadania.

Rzadziej obserwowano następujące działania niepożądane:

- Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej: wysypka, świąd, pokrzywka, obrzęk naczynioruchowy, rumień, wykwity plamkowo-grudkowe, odczyny pęcherzowe (np. zespół Stevensa-Johnsona i toksyczne martwicze oddzielanie się naskórka) i wyjątkowo wysypka polekowa z eozynofilią oraz objawami ogólnymi (DRESS, ang. *Drug Rash with Eosinophilia and Systemic Symptoms*).
- Zaburzenia krwi i układu chłonnego: Zmiany hematologiczne występują rzadko. Mogą obejmować niedokrwistość, leukopenię, małopłytkowość i granulocytopenię. Zmiany są zazwyczaj odwracalne i ustępują po zaprzestaniu leczenia.
- Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych: zwiększenie aktywności enzymów wątrobowych (AST, ALT, fosfatazy alkalicznej), zapalenie wątroby (odosobnione doniesienia). W razie wystąpienia żółtaczki cholestatycznej należy odstawić leczenie.

Objawy zazwyczaj ustępują po zakończeniu leczenia.

- Zaburzenia oka: Mogą wystąpić przejściowe zaburzenia widzenia wskutek zmian stężenia glukozy we krwi, szczególnie na początku leczenia.
- Działania niepożądane wspólne dla grupy farmaceutycznej: Podczas stosowania pochodnych sulfonilomocznika obserwowano występowanie: erytropenii, agranulocytozy, niedokrwistości hemolitycznej, pancytopenii, alergicznego zapalenia naczyń, hiponatremii, zwiększenia aktywności enzymów wątrobowych, a nawet zaburzenie czynności wątroby (np. z zastojem żółci i żółtaczką) oraz zapalenie wątroby (zmiany ustępują po odstawieniu pochodnych sulfonilomocznika), a nawet, w pojedynczych przypadkach, niebezpiecznej niewydolności wątroby.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem:

Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C

02-222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Przedawkowanie pochodnych sulfonilomocznika może prowadzić do hipoglikemii.

W przypadku umiarkowanej hipoglikemii bez utraty przytomności i objawów neurologicznych należy podać węglowodany, dostosować dawkowanie leków hipoglikemizujących i (lub) dietę.

Należy ściśle kontrolować stan pacjenta do czasu, gdy lekarz uzna, że zagrożenie minęło.

W przypadku ciężkiej hipoglikemii ze śpiączką, drgawkami i innymi zaburzeniami neurologicznymi należy postępować jak w stanach nagłych wymagających hospitalizacji w trybie pilnym.

W razie podejrzenia lub rozpoznania śpiączki hipoglikemicznej należy podać 50 ml stężonego roztworu glukozy (20-30%) w szybkim wlewie dożylnym, a następnie bardziej rozcieńczony 10% roztwór glukozy we wlewie ciągłym z szybkością zapewniającą stężenie glukozy we krwi ponad 1 g/l. Należy ściśle monitorować stan pacjenta. W zależności od stanu klinicznego lekarz zadecyduje, czy dalsza obserwacja jest konieczna.

Dializa jest nieskuteczna ze względu na silne wiązanie się gliklazynu z białkami osocza.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: pochodne sulfonilomocznika,
kod ATC: A10BB09

Mechanizm działania

Gliklazyn jest doustnym lekiem przeciwcukrzycowym o działaniu hipoglikemizującym z grupy pochodnych sulfonilomocznika. Od pozostałych pochodnych różni się obecnością pierścienia heterocyklicznego z endocyklicznym atomem azotu.

Gliklazyn pobudza wydzielanie insuliny przez komórki beta wysp Langerhansa i dzięki temu zmniejsza stężenie glukozy we krwi. Zwiększenie poposiłkowego wydzielania insuliny i peptydu C w trzustce utrzymuje się nawet po dwóch latach leczenia.

Poza działaniem metabolicznym gliklazyn wpływa również na właściwości reologiczne krwi.

Działanie farmakodynamiczne

Wpływ na wydzielanie insuliny

W cukrzycy typu 2 gliklazyn przywraca pierwszy szczyt wydzielania insuliny i zwiększa wydzielanie insuliny w opóźnionej fazie po podaniu glukozy. Powoduje również istotne zwiększenie wydzielania insuliny w odpowiedzi na pokarm lub glukozę.

Wpływ na właściwości reologiczne krwi:

Gliklazyn hamuje tworzenie mikrozakrzepów w dwóch procesach, które mogą leżeć u podstaw powikłań cukrzycy:

- lek powoduje częściowe hamowanie agregacji i adhezji płytek krwi oraz zmniejszenie aktywności markerów aktywacji płytek (beta-tromboglobulina, tromboksan B₂).
- oraz pobudza procesy fibrynolityczne w śródbłonku naczyń i zwiększa aktywność tPA.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Stężenie leku w osoczu wzrasta stopniowo przez 6 godzin po podaniu, a następnie utrzymuje się na stałym poziomie przez kolejnych 6 godzin.

Zmienność u poszczególnych osobników jest niska.
Gliklazyd wchłania się w całości. Posiłki nie wpływają na szybkość ani na stopień wchłaniania.

Dystrybucja

Lek wiąże się z białkami osocza w około 95%. Objętość dystrybucji wynosi około 30 l.
Stężenie terapeutyczne gliklazydu w osoczu utrzymuje się przez 24 godziny po podaniu jednej dawki produktu Glikuron 60 mg na dobę.

Metabolizm

Gliklazyd jest metabolizowany głównie w wątrobie i wydalany z moczem; w moczu stwierdza się mniej niż 1% leku w postaci niezmienionej. W osoczu nie występują aktywne metabolity.

Eliminacja

Okres półtrwania w fazie eliminacji gliklazydu wynosi 12-20 godzin.

Liniowość lub nieliniowość

Zależność dawka-pole powierzchni pod krzywą stężenia jest liniowa dla dawek do 120 mg.

Szczególne grupy pacjentów

Osoby w podeszłym wieku

U osób w podeszłym wieku nie obserwowano istotnych klinicznie zmian parametrów farmakokinetycznych.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne, wynikające z konwencjonalnych badań toksyczności po podaniu wielokrotnym oraz genotoksyczności, nie ujawniają żadnego szczególnego zagrożenia dla człowieka. Nie prowadzono długotrwałych badań kancerogenności. W badaniach na zwierzętach nie wykazano zmian teratogennych, jednak obserwowano zmniejszenie masy ciała płodów zwierząt otrzymujących dawki 25-krotnie większe niż maksymalne dawki zalecane u ludzi. W badaniach na zwierzętach, po podaniu gliklazydu, nie obserwowano wpływu na płodność lub zdolność do rozrodu.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Wapnia wodorofosforan dwuwodny
Powidon (K30)
Hypromeloza (K100)
Hypromeloza (K4M)
Magnezu stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3 Okres ważności

2 lata.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii PCV/Al i folii PCV/Aclar/Al.

Dostępne są opakowania zawierające po 10, 28, 30, 60, 90 i 120 tabletek.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Orion Corporation
Orionintie 1
02200 Espoo
Finlandia

8. NUMER(Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

22928

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

08/01/2016

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

18.05.2020