

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Diazidan, 80 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 tabletkę zawiera 80 mg gliklazydu (*Gliclazidum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu:

1 tabletkę zawiera 32,1 mg laktozy jednowodnej.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka.

Biała lub lekko kremowa, okrągła, obustronnie płaska tabletkę, ze ściętym obrzeżem, z linią podziału po jednej stronie. Tabletkę można podzielić na równe dawki.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Cukrzyca insulinoniezależna (typ 2) u osób dorosłych, u których przestrzeganie diety, ćwiczenia fizyczne oraz zmniejszenie masy ciała nie wystarczają do utrzymania prawidłowego stężenia glukozy we krwi.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

▪ Dawka początkowa

Całkowita dawka dobową podawaną doustnie wynosi od 40 do 320 mg. Dawka powinna być dostosowana indywidualnie w zależności od reakcji pacjenta, rozpoczynając od 40 do 80 mg na dobę (od pół do jednej tabletki) i zwiększając ją aż do osiągnięcia odpowiedniej kontroli. Pojedyncza dawka nie powinna przekraczać 160 mg (2 tabletki). Jeśli wymagana jest większa dawka, Diazidan należy przyjmować dwa razy na dobę, z głównymi posiłkami w ciągu dnia.

U pacjentów z otyłością lub tych, u których nie wykazano odpowiedniej odpowiedzi na tabletkę Diazidan, może być konieczne wdrożenie dodatkowego leczenia.

▪ Zamiana innego, doustnego leku przeciwcukrzycowego na produkt leczniczy Diazidan

Diazidan może być stosowany w celu zastąpienia innego, doustnego leku przeciwcukrzycowego. Podczas zamiany na produkt leczniczy Diazidan należy wziąć pod uwagę dawkę oraz okres półtrwania uprzednio stosowanego leku przeciwcukrzycowego.

Zastosowanie okresu przejściowego nie jest konieczne. Należy zastosować dawkę początkową wynosząca 40 do 80 mg (od pół do jednej tabletki) i tak ją modyfikować, aby była dostosowana do reakcji stężenia glukozy we krwi danego pacjenta, tak jak to przedstawiono powyżej.

W razie zmiany z innych hipoglikemizujących pochodnych sulfonilomocznika o przedłużonym okresie półtrwania, może być konieczna kilkudniowa przerwa w leczeniu, aby zapobiec wystąpieniu efektu addycyjnego dwóch produktów leczniczych, który może powodować hipoglikemię.

▪ Leczenie skojarzone z innymi lekami przeciwcukrzycowymi

Diazidan może być stosowany z biguanidami, inhibitorami alfa-glukozydazy lub insuliną. U pacjentów ze stężeniem glukozy we krwi niedostatecznie kontrolowanym z użyciem produktu leczniczego Diazidan, leczenie skojarzone z insuliną powinno być wprowadzone pod ścisłą opieką medyczną.

Szczególne grupy pacjentów

Pacjenci w podeszłym wieku

Produkt leczniczy Diazidan należy stosować zgodnie z tymi samymi zasadami dawkowania, jakie są zalecane u pacjentów w wieku poniżej 65 lat.

Zaburzenie czynności nerek

U pacjentów z łagodną i umiarkowaną niewydolnością nerek powinny być zastosowane takie same zasady dawkowania jak u pacjentów z prawidłową czynnością nerek. Pacjenci ci powinni pozostawać pod obserwacją. Dane te zostały potwierdzone w badaniach klinicznych.

Pacjenci z ryzykiem wystąpienia hipoglikemii:

- pacjenci niedożywieni lub źle odżywieni;
- z ciężkimi lub niedostatecznie wyrównanymi zaburzeniami endokrynologicznymi (niedoczynność przysadki, niedoczynność tarczycy, niewydolność nadnerczy);
- po zaprzestaniu długotrwałego leczenia i (lub) leczenia dużymi dawkami kortykosteroidów;
- z ciężkimi chorobami naczyń (ciężka choroba wieńcowa, ciężka niewydolność tętnicy szyjnej, choroba naczyń obwodowych).

Zaleca się stosowanie minimalnej dobowej dawki początkowej wynoszącej od 40 do 80 mg.

Dzieci i młodzież

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania i skuteczności produktu leczniczego Diazidan u dzieci i młodzieży.

Brak danych dotyczących stosowania u dzieci.

Sposób podawania

Podanie doustne.

4.3. Przeciwwskazania

Ten produkt leczniczy jest przeciwwskazany w przypadku:

- nadwrażliwości na gliklazyd lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1, inne pochodne sulfonilomocznika, sulfonamidy;
- cukrzycy typu 1;
- stanu przedśpiączkowego i śpiączki cukrzycowej, cukrzycowej kwasicy ketonowej;
- ciężkiej niewydolności nerek lub wątroby: w tych przypadkach zaleca się zastosowanie insuliny;
- leczenia mikonazolem (patrz punkt 4.5);
- karmienia piersią (patrz punkt 4.6).

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Hipoglikemia

To leczenie powinno być stosowane jedynie u pacjentów regularnie odżywiających się (w tym śniadanie). Jest ważne, aby regularnie spożywać węglowodany ze względu na zwiększone ryzyko hipoglikemii, jeśli posiłek jest przyjęty późno, jeśli spożyta jest nieodpowiednia ilość pokarmu lub posiłek zawiera mało węglowodanów. Hipoglikemia częściej pojawia się podczas stosowania diet niskokalorycznych, w następstwie długotrwałego lub forsownego wysiłku fizycznego, picia alkoholu lub w przypadku, gdy zastosowano leczenie skojarzone lekami przeciwcukrzycowymi.

Hipoglikemia może wystąpić w następstwie stosowania pochodnych sulfonylmocznika (patrz punkt 4.8). Niektóre przypadki ciężkiej i przedłużonej hipoglikemii mogą wymagać leczenia szpitalnego i podawania glukozy przez kilka dni.

Aby zmniejszyć ryzyko hipoglikemii, należy ostrożnie dobierać pacjentów oraz ustalać dawkę, a pacjentów należy odpowiednio poinformować.

Czynniki zwiększające ryzyko wystąpienia hipoglikemii:

- pacjent odmawia współpracy lub nie jest do niej zdolny (zwłaszcza osoby w podeszłym wieku);
- niedożywienie, nieregularne pory spożywania posiłków, pomijanie posiłków, okresy postzczenia lub zmiany w diecie;
- brak równowagi pomiędzy wysiłkiem fizycznym a podażą węglowodanów;
- niewydolność nerek;
- ciężka niewydolność wątroby;
- przedawkowanie produktu leczniczego Diazidan;
- niektóre zaburzenia endokrynologiczne: zaburzenia czynności tarczycy, niedoczynność przysadki oraz niewydolność nadnerczy;
- równoczesne podawanie niektórych leków (patrz punkt 4.5).

Niewydolność nerek i wątroby

Farmakokinetyka i (lub) farmakodynamika gliklazydu może być zmieniona u pacjentów z niewydolnością wątroby lub ciężką niewydolnością nerek. U tych pacjentów hipoglikemia może się przedłużać, co może wymagać wdrożenia odpowiedniego postępowania.

Informowanie pacjenta

Ryzyko hipoglikemii, jej objawy (patrz punkt 4.8), leczenie i czynniki predysponujące do jej wystąpienia, należy wyjaśnić pacjentowi oraz członkom jego rodziny.

Pacjent powinien być poinformowany o istotnej roli, jaką spełniają zalecenia dietetyczne, regularne uprawianie ćwiczeń oraz regularne oznaczanie stężenia glukozy we krwi.

Słaba kontrola glikemii

Kontrolę glikemii u pacjentów otrzymujących leki przeciwcukrzycowe może zaburzać: stosowanie preparatów zawierających ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*) (patrz punkt 4.5), gorączka, uraz, infekcja lub zabieg chirurgiczny. W niektórych przypadkach może być konieczne podanie insuliny.

Skuteczność działania hipoglikemizującego jakiegokolwiek doustnego leku przeciwcukrzycowego, w tym gliklazydu, z czasem ulega osłabieniu u wielu pacjentów: może to wynikać ze stopniowego nasilania się cukrzycy lub ze zmniejszenia reakcji na leczenie. Zjawisko to, znane jest jako wtórne niepowodzenie terapeutyczne, w odróżnieniu od pierwotnego, kiedy to substancja czynna jest nieskuteczna w leczeniu pierwszego rzutu. Przed stwierdzeniem wystąpienia u pacjenta wtórnego niepowodzenia terapeutycznego należy rozważyć odpowiednie dostosowanie dawki oraz sprawdzić

przestrzeżenie przez pacjenta zaleceń dietetycznych.

Zaburzenia stężenia glukozy we krwi

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

Badania laboratoryjne

Do oceny kontroli glikemii zaleca się oznaczanie stężeń hemoglobiny glikowanej (lub pomiar glukozy w osoczu krwi żyłnej na czczo). Użyteczna może być również samokontrola stężenia glukozy we krwi.

Stosowanie pochodnych sulfonylomocznika u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej może prowadzić do rozwoju niedokrwistości hemolitycznej. Ponieważ glikazyd należy do pochodnych sulfonylomocznika, u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej należy zachować ostrożność i rozważyć zastosowanie leczenia lekami nie będącymi pochodnymi sulfonylomocznika.

Produkt leczniczy nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, brakiem laktazy lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

Produkt leczniczy zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu w jednej tabletkie, to znaczy produkt leczniczy uznaje się za „wolny od sodu”.

4.5. Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Następujące produkty lecznicze zazwyczaj zwiększają ryzyko hipoglikemii:

Równoczesne stosowanie przeciwwskazane:

- **Mikonazol** (stosowany ogólnie, żel do stosowania w jamie ustnej): nasila działanie hipoglikemizujące z możliwością wywołania objawów hipoglikemii, lub nawet śpiączki.

Równoczesne stosowanie niezalecane:

- **Fenylobutazon** (stosowany ogólnie): nasila działanie hipoglikemizujące pochodnych sulfonylomocznika (przez wypieranie z połączeń z białkami osocza i (lub) zmniejszenie ich wydalania).
Zaleca się zastosowanie innego leku przeciwzapalnego lub należy poinformować pacjenta o ryzyku i podkreślić istotną rolę samokontroli. W razie konieczności należy dostosować dawkę w trakcie i po zakończeniu leczenia lekiem przeciwzapalnym.
- **Alkohol**: nasila działanie hipoglikemizujące (przez blokowanie reakcji kompensacyjnych), co może prowadzić do wystąpienia śpiączki hipoglikemicznej.
Należy unikać spożywania alkoholu lub leków zawierających alkohol.

Równoczesne stosowanie z zachowaniem ostrożności:

Nasilenie działania zmniejszającego stężenie glukozy we krwi i w niektórych przypadkach hipoglikemia może wystąpić podczas jednoczesnego przyjmowania następujących leków: inne leki przeciwcukrzycowe (insulina, akarboza, metformina, tiazolidinediony, inhibitory peptydazy dipeptydylowej IV, agoniści receptora 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.

Następujące produkty lecznicze mogą zwiększać stężenie glukozy we krwi:

Równoczesne stosowanie niezalecane:

- **Danazol:** wpływ diabetogenny danazolu.
Jeżeli zastosowania tej substancji czynnej nie można uniknąć, pacjenta należy ostrzec i podkreślić znaczenie kontroli stężenia glukozy we krwi i w moczu. W razie konieczności należy dostosować dawkę gliklazydu w trakcie i po zakończeniu leczenia danazolem.

Równoczesne stosowanie z zachowaniem ostrożności:

- **Chloropromazyne** (lek neuroleptyczny): duże dawki (> 100 mg chloropromazyne na dobę) zwiększają stężenie glukozy we krwi (zmniejszenie wydzielania insuliny).
Należy uprzedzić pacjenta i podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi. Może być konieczne dostosowanie dawki przeciw cukrzycowej substancji czynnej w trakcie i po zakończeniu leczenia lekiem neuroleptycznym.
- **Glikokortykosteroidy** (stosowane ogólnie i miejscowo: produkty lecznicze dostawowe, na skórę i doodbytnicze) oraz tetrakozaktyd: zwiększenie stężenia glukozy we krwi z możliwą kwasicyą ketonową (zmniejszona tolerancja na węglowodany spowodowana przez glikokortykosteroidy).
Należy uprzedzić pacjenta i podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi, zwłaszcza na początku leczenia. Może być konieczne dostosowanie dawki przeciw cukrzycowej substancji czynnej w trakcie i po zakończeniu leczenia glikokortykosteroidami.
- **Rytodryna, salbutamol, terbutalina** (dożylnie).
Zwiększenie stężenia glukozy następuje w związku z pobudzeniem receptorów beta-2. Należy podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi. W razie konieczności należy zastosować insulinoterapię.
- **Preparaty zawierające ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*)**
Ziele dziurawca zwyczajnego (*Hypericum perforatum*) zmniejsza ekspozycję na gliklazyd.
Należy podkreślić znaczenie monitorowania stężenia glukozy we krwi.

Następujące produkty lecznicze mogą powodować zaburzenia stężenia glukozy we krwi

Równoczesne stosowanie z zachowaniem ostrożności:

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

Równoczesne stosowanie po rozważeniu ryzyka:

- **Leki przeciwzakrzepowe** (np. warfaryna). Pochodne sulfonilomocznika mogą nasilać działanie przeciwzakrzepowe podczas jednoczesnego stosowania.
Może być konieczna zmiana leku przeciwzakrzepowego.

4.6. Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak danych lub istnieją tylko ograniczone dane (mniej niż 300 kobiet w ciąży) dotyczące stosowania gliklazydu u kobiet w ciąży, aczkolwiek istnieją nieliczne dane dotyczące innych pochodnych sulfonilomocznika.

W badaniach na zwierzętach gliklazyd nie wykazywał działania teratogennego (patrz punkt 5.3).

W celu zachowania ostrożności, zaleca się unikanie stosowania gliklazydu podczas ciąży.

Normoglikemię należy uzyskać przed poczęciem, w celu zmniejszenia niebezpieczeństwa wystąpienia wad wrodzonych u płodu w wyniku niewyrównanej cukrzycy u matki.

Stosowanie doustnych leków hipoglikemizujących jest niewłaściwe. Lekiem pierwszego wyboru w leczeniu cukrzycy u kobiet w ciąży jest insulina. Zaleca się odstawienie doustnych leków hipoglikemizujących i rozpoczęcie insulinoterapii przed próbą zajścia w ciążę, lub niezwłocznie po jej stwierdzeniu.

Karmienie piersią

Nie wiadomo, czy gliklazyd lub jego metabolity przenikają do mleka ludzkiego. Zważywszy na niebezpieczeństwo wystąpienia hipoglikemii u noworodka stosowanie produktu leczniczego jest zatem przeciwwskazane u kobiet karmiących piersią. Nie można wykluczyć zagrożenia dla noworodków lub niemowląt.

Płodność

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

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Produkt leczniczy Diazidan nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Jednakże, należy poinformować pacjenta o możliwym wpływie na koncentrację, jeśli cukrzyca nie jest odpowiednio kontrolowana, zwłaszcza na początku leczenia (patrz punkt 4.4).

4.8. Działania niepożądane

Na podstawie doświadczenia ze stosowaniem gliklazylu donoszono o następujących działaniach niepożądanych.

Działania niepożądane przedstawiono uwzględniając klasyfikację układów i narządów MedDRA a częstość występowania według następującego schematu: bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$); bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$), częstość nieznana (nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Rzadko: zmiany hematologiczne. Mogą obejmować niedokrwistość, leukopenię, małopłytkowość, granulocytopenię. Zmiany te zazwyczaj przemijają po zaprzestaniu leczenia.

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Często: najczęstszym działaniem niepożądanym gliklazylu jest hipoglikemia.

Tak jak w przypadku innych pochodnych sulfonilomocznika leczenie produktem leczniczym Diazidan może powodować hipoglikemię, jeśli posiłki są nieregularne, a zwłaszcza, gdy są pomijane. Możliwe objawy hipoglikemii to: ból głowy, silny głód, nudności, wymioty, zmęczenie, zaburzenia snu, pobudzenie, agresja, osłabiona koncentracja, zaburzenia świadomości oraz spowolnienie reakcji, depresja, uczucie splątania, zaburzenia widzenia i mowy, afazja, drżenie, niedowład, zaburzenia czucia, zawroty głowy, uczucie bezsilności, utrata samokontroli, majaczenie, drgawki, płytki oddech, bradykardia, senność i utrata świadomości, co może prowadzić do śpiączki oraz zgonu.

Dodatkowo mogą być obserwowane objawy pobudzenia adrenergicznego takie jak: pocenie się, wilgotność skóry, niepokój, tachykardia, nadciśnienie, kołatanie serca, dławica piersiowa oraz zaburzenia rytmu serca.

Zazwyczaj objawy ustępują po podaniu węglowodanów (cukru). Należy jednak pamiętać, że sztuczne

substancje słodzące nie wywołują żadnego efektu. Doświadczenia z innymi pochodnymi sulfonylomocznika wykazały, że hipoglikemia może wystąpić ponownie, nawet jeśli pomiary początkowo wskazują na skuteczność leczenia.

W przypadku ciężkiej lub długotrwałej hipoglikemii, nawet jeśli jest okresowo kontrolowana poprzez spożycie cukru, niezwłocznie należy rozpocząć leczenie lub może być nawet konieczna hospitalizacja.

Zaburzenia oka

Rzadko: przemijające zaburzenia widzenia mogą wystąpić szczególnie na początku leczenia, na skutek zmian stężenia glukozy we krwi.

Zaburzenia żołądkowo-jelitowe

Niezbyt często: ból brzucha, nudności, wymioty, niestrawność, biegunka oraz zaparcia: można ich uniknąć lub można je zminimalizować przyjmując gliklasyd w trakcie śniadania.

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Rzadko: zwiększona aktywność enzymów wątrobowych (AST, ALT, fosfatazy zasadowej), zapalenie wątroby (pojedyncze przypadki). Należy przerwać leczenie w przypadku wystąpienia żółtaczki cholestatycznej. Objawy te zazwyczaj przemijają po odstawieniu produktu leczniczego.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Rzadko: wysypka, świąd, pokrzywka, obrzęk naczynioruchowy, rumień, wysypki plamkowo-grudkowe, odczyny pęcherzowe (takie jak zespół Stevensa-Johnsona i martwica toksyczno-rozplywna naskórka) i wyjątkowo wysypka polekowa z eozynofilią oraz objawami ogólnymi (DRESS, ang. *Drug Rush with Eosinophilia and Systemic Symptoms*).

Działania niepożądane danej grupy leków:

Tak jak po innych pochodnych sulfonylomocznika obserwowano następujące zdarzenia niepożądane: przypadki erytrocypenii, agranulocytozy, niedokrwistości hemolitycznej, pancytopenii, alergicznego zapalenia naczyń, hiponatremii, zwiększenia aktywności enzymów wątrobowych, a nawet zaburzenia czynności wątroby (np. z zastojem żółci i żółtaczką) oraz zapalenie wątroby, które przemijało po odstawieniu pochodnej sulfonylomocznika lub, w pojedynczych przypadkach, prowadziło do zagrażającej życiu 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 sulfonylomocznika może wywołać hipoglikemię.

Umiarkowane objawy hipoglikemii, bez utraty przytomności lub objawów neurologicznych, muszą być korygowane poprzez podanie węglowodanów, dostosowanie dawki i (lub) zmianę diety. Pacjent powinien znajdować się pod ściłą obserwacją aż do momentu, gdy lekarz nie upewni się, że zagrożenie minęło.

Ciężkie objawy hipoglikemii ze śpiączką, drgawkami lub innymi zaburzeniami neurologicznymi muszą być leczone w ramach natychmiastowej pomocy medycznej, w tym z niezwłoczną hospitalizacją.

W razie rozpoznania lub podejrzenia śpiączki hipoglikemicznej należy podać pacjentowi w szybkim wstrzyknięciu dożylnym 50 ml stężonego roztworu glukozy (20-30%). Następnie należy podać we wlewie ciągłym bardziej rozcieńczony roztwór glukozy (10%), z szybkością, która utrzyma wartości stężenia glukozy we krwi powyżej 1 g/l. Pacjenci powinni znajdować się pod ścisłą obserwacją i w zależności od późniejszego stanu, lekarz zdecydować, czy dalsza obserwacja jest konieczna.

Dializa nie jest skuteczna u pacjentów ze względu na silne wiązanie się gliklazydu z białkami osocza.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: sulfonamidy, pochodne mocznika, kod ATC: A 10 BB 09.

Mechanizm działania

Gliklazyd jest hipoglikemizującą pochodną sulfonylomocznika, substancją czynną, o działaniu przeciwcukrzycowym, różniącą się od innych pochodnych heterocyklicznym pierścieniem z wbudowanym atomem azotu i wiązaniem endocyklicznym.

Gliklazyd zmniejsza stężenie glukozy we krwi pobudzając wydzielanie insuliny przez komórki beta wysp Langerhansa. Zwiększone poposiłkowe wydzielanie insuliny i białka C w trzustce utrzymuje się nawet po dwóch latach leczenia.

Poza działaniem na metabolizm, gliklazyd wpływa również na naczynia krwionośne.

Skuteczność kliniczna i bezpieczeństwo stosowania

Wpływ na uwalnianie insuliny

W cukrzycy typu 2, gliklazyd przywraca wczesny wzrost wydzielania insuliny w odpowiedzi na obecność glukozy oraz nasila drugą fazę wydzielania insuliny.

Znaczący wzrost wydzielania insuliny jest obserwowany jako odpowiedź na stymulację indukowaną pokarmem lub glukozą.

Wpływ na naczynia krwionośne

Gliklazyd zmniejsza proces formowania się mikrozakrzepów w dwóch mechanizmach, które mogą być zaangażowane w powstawanie powikłań cukrzycy, przez:

- częściowe hamowanie agregacji i adhezji płytek, ze zmniejszeniem aktywności markerów aktywacji płytek krwi (β -tromboglobulina, tromboksan B₂),
- wpływ na aktywność fibrynolityczną śródbłonna naczyń ze zwiększeniem aktywności tkankowego aktywatora plazminogenu (tPA).

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Stężenie leku w osoczu zwiększa się, osiągając maksymalne stężenie pomiędzy drugą a szóstą godziną od podania.

Gliklazyd dobrze się wchłania. Posiłek nie wpływa na szybkość ani na stopień wchłaniania.

Dystrybucja

Wiązanie z białkami osocza wynosi około 95%. Objętość dystrybucji wynosi około 19 l.

Metabolizm

Gliklazyd jest metabolizowany głównie w wątrobie i wydalany z moczem, przy czym w moczu wykrywa się zaledwie 1% w postaci niezmienionej. Nie wykryto żadnego czynnego metabolitu w osoczu.

Eliminacja

Okres półtrwania w fazie eliminacji gliklazydu wynosi od 10 do 12 godzin.

Liniowość lub nieliniowość

Związek pomiędzy podaną dawką od 40 do 400 mg, a średnim stężeniem w osoczu jest liniowy.

Szczególne grupy pacjentów

Pacjenci w podeszłym wieku

Nie zaobserwowano istotnych klinicznie zmian parametrów farmakokinetycznych u pacjentów w podeszłym wieku.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie na podstawie konwencjonalnych badań toksyczności i genotoksyczności z zastosowaniem powtórzonej dawki wykazały brak istotnego zagrożenia dla ludzi. Długoterminowe badania dotyczące wpływu rakotwórczego nie zostały przeprowadzone.

W badaniach na zwierzętach nie zaobserwowano zmian o podłożu teratogennym, natomiast obserwowano zmniejszenie masy ciała płodów u zwierząt otrzymujących 9,4 razy większą dawkę niż maksymalna dawka terapeutyczna zalecana do stosowania 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

Laktoza jednowodna, celuloza mikrokrystaliczna (E 460), powidon, karboksymetyloskrobia sodowa (typ A), magnezu stearynian (E 572).

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3. Okres ważności

3 lata

6.4. Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C. Przechowywać w oryginalnym opakowaniu.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Tabletki leku Diazidan pakowane są w blistry Al/PVC. Każdy blister zawiera 20 tabletek. Tekturowe pudełko zawiera 60 tabletek wraz z ulotką informacyjną.

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

Bez szczególnych wymagań.

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Bausch Health Ireland Limited
3013 Lake Drive
Citywest Business Campus
Dublin 24, D24PPT3
Irlandia

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr 9111

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 21 grudnia 2001 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 05 lutego 2008 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO