

POVZETEK GLAVNIH ZNAČILNOSTI ZDRAVILA

1. IME ZDRAVILA

Gliklazid Lek 60 mg tablete s prirejenim sproščanjem

2. KAKOVOSTNA IN KOLIČINSKA SESTAVA

Ena tableta s prirejenim sproščanjem vsebuje 60 mg gliklazida.
Za celoten seznam pomožnih snovi glejte poglavje 6.1.

3. FARMACEVTSKA OBLIKA

Tableta s prirejenim sproščanjem.

Bela ali skoraj bela podolgovata tableta, neobložena, dolga 13,5 mm, široka 6,5 mm in debeline 4,2 mm, z zarezo na obeh straneh in vrezano oznako "60" na eni strani zareze na eni strani tablete.

Tableta se lahko deli na enake odmerke.

4. KLINIČNI PODATKI

4.1 Terapevtske indikacije

Od insulina neodvisna sladkorna bolezen (tipa 2) pri odraslih, kadar ni možno zadovoljivo urejati glukoze v krvi le z dietnimi ukrepi, telesno dejavnostjo in zmanjševanjem telesne mase.

4.2 Odmerjanje in način uporabe

Odmerjanje

Dnevni odmerek zdravila Gliklazid Lek se lahko giblje od ene polovice tablete do dveh tablet na dan, to je od 30 do 120 mg, peroralno, ki ga bolnik vzame naenkrat, ob zajtrku.

Priporočamo, da bolniki odmerek pogoltnejo brez žvečenja ali drobljenja.

Če bolnik pozabi vzeti odmerek, ne sme povečati odmerka naslednji dan.

Kot velja za vsa hipoglikemična zdravila, je treba odmerek prilagoditi odzivu presnove posameznega bolnika (glukoza v krvi, HbA1c).

Začetni odmerek

Priporočeni začetni odmerek je 30 mg na dan (polovica tablete Gliklazid Lek 60 mg).

Če je koncentracija glukoze v krvi učinkovito urejena, se lahko ta odmerek uporablja tudi za vzdrževalno zdravljenje.

Če raven glukoze v krvi ni ustrezno urejena, se lahko odmerek postopno poveča na 60, 90 ali 120 mg na dan. Presledok med vsakim povečanjem odmerka mora znašati najmanj 1 mesec, razen pri bolnikih, pri katerih se vrednost glukoze v krvi po 2 tednih zdravljenja ni zmanjšala. V takih primerih se lahko odmerek poveča na koncu drugega tedna zdravljenja. Največji priporočeni dnevni odmerek je 120 mg.

Ena tableta zdravila Gliklazid Lek 60 mg tablete s prirejenim sproščanjem je ekvivalentna dvema tabletama s prirejenim sproščanjem, ki vsebujeta 30 mg gliklazida. Deljivost tablet zdravila Gliklazid Lek omogoča doseganje prilaganja odmerjanja.

Prehod s tablet, ki vsebujejo 80 mg gliklazida, na zdravilo Gliklazid Lek 60 mg tablete s prirejenim sproščanjem

Ena tableta, ki vsebuje 80 mg gliklazida, je primerljiva 30 mg formulaciji s prirejenim sproščanjem (to je polovici tablete zdravila Gliklazid Lek 60 mg). Zamenjavo lahko opravite, če skrbno spremljate bolnikovo kri.

Prehod z drugega peroralnega antidiabetika na zdravilo Gliklazid Lek

Z zdravilom Gliklazid Lek lahko nadomestite druge peroralne antidiabetike.

Ob prehodu na zdravilo Gliklazid Lek morate upoštevati odmerjanje in razpolovni čas prejšnjega antidiabetičnega zdravila.

Na splošno prehodno obdobje ni potrebno. Kot začetni odmerek je treba uporabiti 30 mg in ga nato prilagoditi glede na odziv glukoze v krvi pri posameznem bolniku, kot je opisano zgoraj.

Pri prehodu s hipoglikemične sulfonilsečnine s podaljšanim razpolovnim časom na drugo zdravilo bo morda potrebno obdobje nekaj dni brez zdravljenja, da bi se izognili seštevanju učinka obeh zdravil, ki bi lahko povzročilo hipoglikemijo. Opisani postopek za uvedbo zdravljenja uporabite tudi pri prehodu na zdravilo Gliklazid Lek, se pravi, da se začne z odmerkom 30 mg na dan, potem pa nadaljuje s postopnim povečevanjem odmerka glede na odziv presnove.

Kombinirano zdravljenje z drugimi antidiabetiki

Zdravilo Gliklazid Lek lahko bolniki jemljejo v kombinaciji z bigvanidi, zaviralci α -glukozidaze ali insulinom.

Pri bolnikih, pri katerih zdravilo Gliklazid Lek 60 mg ne zadostuje za zadovoljivo urejanje bolezn, se lahko uvede sočasno zdravljenje z insulinom pod strogim zdravniškim nadzorom.

Posebne skupine bolnikov

Starejši

Zdravilo Gliklazid Lek se predpisuje z enakim režimom odmerjanja kot bolnikom, mlajšim od 65 let.

Okvara ledvic

Bolnikom z blago do zmerno okvarjenim delovanjem ledvic se lahko predpiše enak režim odmerjanja kot tistim z normalnim ledvičnim delovanjem, vendar jih je treba skrbno spremljati. Ti podatki so bili potrjeni v kliničnih študijah.

Bolniki s tveganjem za pojav hipoglikemije

- bolniki z nedohranjenostjo ali slabo prehranjenostjo,
- bolniki z resnimi ali slabo kompenziranimi endokrinimi motnjami (hipopituitarizem, hipotiroidizem, adrenokortikotropna insuficienca),
- bolniki, ki prekinejo podaljšano in/ali zdravljenje z velikimi odmerki kortikosteroidov,
- bolniki z resnimi žilnimi boleznimi (huda ishemična bolezen srca, huda prizadetost karotidnih arterij, difuzno žilna bolezen).

Priporočeno je jemanje najmanjšega začetnega dnevnega odmerka 30 mg.

Pediatrična populacija

Varnost in učinkovitost zdravila Gliklazid Lek pri otrocih in mladostnikih nista bili dokazani. Podatkov ni na voljo.

Način jemanja zdravila

Zdravilo Gliklazid Lek je za peroralno uporabo.

4.3 Kontraindikacije

Zdravilo je kontraindicirano v naslednjih primerih:

- preobčutljivost na gliklazid ali katero koli pomožno snov, navedeno v poglavju 6.1, druge sulfonilsečnine in sulfonamide,
- sladkorna bolezen tipa 1,
- diabetična predkoma in stanja in koma, diabetična ketoacidoza,
- hudo okvarjeno delovanje ledvic ali jeter: v teh primerih se priporoča insulin,
- zdravljenje z mikonazolom (glejte poglavje 4.5),
- dojenje (glejte poglavje 4.6).

4.4 Posebna opozorila in previdnostni ukrepi

Hipoglikemija

Zdravilo Gliklazid Lek se predpiše le, če bo bolnik imel redne obroke hrane (vključno z zajtrkom). Reden vnos ogljikovih hidratov je pomemben, ker se tveganje za pojav hipoglikemije poveča, če bolnik z obrokom zamuja, če količina zaužite hrane ni ustrezna ali če hrana vsebuje malo ogljikovih hidratov. Hipoglikemija je verjetnejša ob dieti z malo kalorijami, po dolgotrajni ali naporni telesni vadbi, ob pitju alkohola ali če bolnik jemlje kombinacijo hipoglikemičnih zdravil.

Hipoglikemija se lahko pojavi po jemanju sulfonilsečnin (glejte poglavje 4.8). Pri nekaterih bolnikih je lahko huda in dolgotrajna. Lahko je potrebno bolnišnično zdravljenje, dajanje glukoze pa je treba včasih nadaljevati več dni.

Da se zmanjša tveganje za pojav epizod hipoglikemije, je treba pazljivo izbirati bolnike in predpisani odmerki, ter jim dati jasna navodila.

Dejavniki, ki povečujejo tveganje za pojav hipoglikemije:

- bolnik zavrača sodelovanje ali (zlasti starejši) ne more sodelovati,
- nedohranjenost, neredni obroki, izpuščanje obrokov, obdobje posta ali spremembe prehrane,
- neravnovesje med telesno dejavnostjo in vnosom ogljikovih hidratov,
- insuficienca ledvic,
- huda insuficienca jeter,
- preveliko odmerjanje gliklazida,
- nekatere endokrine motnje: ščitnične motnje, hipopituitarizem in okvarjeno delovanje nadledvične žleze,
- sočasno jemanje nekaterih drugih zdravil (glejte poglavje 4.5).

Insuficienca ledvic in jeter

Pri bolnikih z insuficienco jeter ali hudo ledvično odpovedjo se lahko spremenita farmakokinetika in/ali farmakodinamika gliklazida. Pri teh bolnikih so epizode hipoglikemije lahko dolgotrajne in potrebno je uvesti ustrezno zdravljenje.

Informacije za bolnike

Bolniku in njegovim družinskim članom je treba pojasniti nevarnosti hipoglikemije, skupaj z njenimi simptomi (glejte poglavje 4.8), zdravljenjem in pogoji, ki povečajo nagnjenost bolnika k nastanku hipoglikemije.

Bolnika je treba obvestiti o pomembnosti upoštevanja nasvetov o dieti, redni telesni dejavnosti in rednem spremljanju vrednosti glukoze v krvi.

Nezadovoljivo urejanje glukoze v krvi

Na urejanje ravni glukoze v krvi pri bolniku, ki jemlje antidiabetična zdravila, lahko vpliva kateri koli od naslednjih dejavnikov: pripravki iz šentjanževke (*Hypericum perforatum*) (glejte poglavje 4.5), povišana telesna temperatura, poškodba, okužba ali kirurški poseg. V določenih primerih je lahko potrebno dajanje insulina.

Hipoglikemična učinkovitost vseh antidiabetičnih zdravil, tudi gliklazida, se pri mnogih bolnikih sčasoma zmanjša: razlog je lahko napredovanje stopnje sladkorne bolezni ali zmanjšan bolnikov odziv na zdravljenje. Pojav se imenuje sekundarna neučinkovitost in se razlikuje od primarne neučinkovitosti, pri kateri učinkovina ni uspešna že kot zdravljenje prve izbire. Preden se oceni, ali je pri bolniku prišlo do sekundarne neučinkovitosti, je treba ustrezno prilagoditi odmere in preveriti, ali se bolnik drži navodil o prehrani.

Disglikemija

Pri bolnikih s sladkorno boleznijo, ki so bili sočasno zdravljeni s fluorokinoloni, zlasti pri starejših, so poročali o spremembah vrednosti ravni glukoze v krvi, vključno s hipoglikemijo in hiperglikemijo. Pri vseh bolnikih, ki se sočasno zdravijo z gliklazidom in fluorokinoloni, je priporočeno skrbno spremljanje koncentracije glukoze v krvi.

Laboratorijske preiskave

Pri ovrednotenju urejanja glukoze v krvi je priporočeno merjenje vrednosti glikoziliranega hemoglobina (ali ravni glukoze v venski plazmi na tešče). Prav tako je lahko koristno, če si bolnik sam meri raven glukoze v krvi.

Zdravljenje bolnikov s pomanjkanjem encima glukoza-6-fosfat-dehidrogenaze (G6PD) s sulfonilsečninami lahko privede do hemolitične anemije. Ker gliklazid sodi v kemijski razred sulfonilsečnin, ga moramo previdno uporabljati pri bolnikih s pomanjkanjem encima G6PD in razmisliti o uvedbi zdravila, ki ne sodi v razred sulfonilsečnin.

4.5 Medsebojno delovanje z drugimi zdravili in druge oblike interakcij

Navedena zdravila bodo verjetno povečala tveganje za pojav hipoglikemije

Kombinacija, ki je kontraindicirana

- **Mikonazol** (sistemska uporaba, oralni gel): poveča hipoglikemični učinek; lahko se pojavijo simptomi hipoglikemije ali celo koma.

Kombinacije, ki niso priporočljive

- **Fenilbutazon** (sistemska uporaba): poveča hipoglikemični učinek sulfonilsečnin (izriva jih iz vezave na plazemske beljakovine in/ali zmanjšuje njihovo odstranjevanje iz telesa).

Najbolje je predpisati drugo protivnetno zdravilo ali bolnika opozoriti na ta pojav in poudariti pomen samokontrole. Če je potrebno, prilagodite odmerek zdravila med zdravljenjem s protivnetnim zdravilom in po njem.

- **Alkohol:** poveča hipoglikemični odziv (z zaviranjem kompenzacijskih reakcij), kar lahko vodi do pojava hipoglikemične kome.

Izogibati se je treba alkoholu in zdravilom, ki vsebujejo alkohol.

Kombinacije, pri katerih je potrebna previdnost pri uporabi

Do povečanja hipoglikemičnega učinka in včasih do hipoglikemije lahko pride ob jemanju katerega od naslednjih zdravil:

drugih antidiabetičnih zdravil (insulinov, akarboze, metformina, tiazolidindionov, inhibitorjev dipeptidil peptidaze 4, agonistov GLP-1 receptorja), antagonistov adrenergičnih receptorjev beta, flukonazola, zaviralcev angiotenzinske konvertaze (kaptoprila, enalaprila), antagonistov receptorjev H₂, zaviralcev monoaminooksidaze (MAO), sulfonamidov, klaritromicina in nesteroidnih protivnetnih zdravil.

Navedena zdravila lahko povzročijo zvišanje ravni glukoze v krvi

Kombinacija, ki ni priporočljiva

- **Danazol:** ker ima diabetogeni učinek.
Če se uporabi te učinkovine ni možno izogniti, bolnika opozorite na to in poudarite pomembnost spremljanja ravni glukoze v krvi in urinu. Med zdravljenjem z danazolom in po njem bo morda potrebno prilagoditi odmerek antidiabetičnega zdravila.

Kombinacije, pri katerih je potrebna previdnost med uporabo

- **Klorpromazin** (nevroleptik): veliki odmerki (> 100 mg klorpromazina na dan) zvišajo raven glukoze v krvi (zmanjšano sproščanje insulina).
Bolnika je treba opozoriti na ta pojav in poudariti pomembnost spremljanja vrednosti glukoze v krvi. Med zdravljenjem z nevroleptikom in po njem bo morda treba prilagoditi odmerek antidiabetične učinkovine.
- **Glukokortikoidi** (sistemski in lokalni: intraartikularni, dermalni in rektalni pripravki) in tetrakosaktrin: zvišanje ravni glukoze v krvi z možnostjo pojava ketoze (zmanjšanje tolerance za ogljikove hidrate zaradi glukokortikoidov).
Bolnika je treba opozoriti na to dogajanje in poudariti pomembnost spremljanja glukoze v krvi, še posebej na začetku zdravljenja. Med zdravljenjem z glukokortikoidi in po njem bo morda treba prilagoditi odmerek antidiabetičnega zdravila.
- **Ritodrin, salbutamol, terbutalin** (I.V.):
Povišanje ravni glukoze v krvi zaradi agonističnega učinka na adrenergične receptorje beta-2.
Poudariti pomembnost spremljanja ravni glukoze v krvi. Če je treba, se zdravilo zamenja z insulinom.
- **Pripravki s šentjanževko (*Hypericum perforatum*)**
Šentjanževka (*Hypericum perforatum*) zmanjša izpostavljenost gliklazidu. Poudarite pomembnost spremljanja vrednosti glukoze v krvi.

Naslednja zdravila lahko povzročijo disglukemijo

Kombinacije, pri katerih je potrebna previdnost med uporabo

- **Fluorokinolini**

V primeru sočasnega zdravljenja z gliklazidom in fluorokinolonom je treba bolnika opozoriti na tveganje za pojav disglukemije in poudariti pomen spremljanja vrednosti glukoze v krvi.

Kombinacije, ki jih morate upoštevati

- **Antikoagulantno zdravljenje (npr. varfarin)**

Sulfonilsečnine lahko okrepijo antikoagulacijske učinke med sočasnim zdravljenjem. Morda bo treba prilagoditi odmerek antikoagulantnega zdravila.

4.6 Plodnost, nosečnost in dojenje

Nosečnost

Podatkov o uporabi gliklazida pri nosečnicah ni oziroma so omejeni (manj kot 300 izpostavljenih nosečnosti), obstajajo pa maloštevilni podatki za druge sulfonilsečnine. V študijah na živalih gliklazid ni teratogen (glejte poglavje 5.3).

Kot preventivni ukrep je priporočeno izogibanje uporabi gliklazida med nosečnostjo.

Pred zanositvijo mora biti sladkorna bolezen urejena, da bi zmanjšali tveganje za prirojene nepravilnosti zaradi neurejene sladkorne bolezni.

Peroralni hipoglikemiki niso primerni, zato je insulin zdravilo prve izbire za zdravljenje sladkorne bolezni med nosečnostjo. Priporočamo zamenjavo peroralnih hipoglikemikov z insulinom, preden bolnica poskuša zanositi ali takoj ko ugotovi, da je noseča.

Dojenje

Ni znano, ali se gliklazid ali njegovi presnovki izločajo v materino mleko. Zaradi tveganja za hipoglikemijo pri novorojenčku je zdravilo za doječe matere kontraindicirano. Tveganje za novorojenčka/dojenčka ni izključeno.

Plodnost

Učinki na plodnost ali razmnoževanje pri podganah niso bili zabeleženi (glejte poglavje 5.3).

4.7 Vpliv na sposobnost vožnje in upravljanja strojev

Zdravilo Gliklazid Lek nima vpliva ali ima zanemarljiv vpliv na sposobnost vožnje in upravljanja strojev. Kljub temu morate bolnikom povedati, da lahko pride do vpliva na koncentracije glukoze v krvi, če njihova sladkorna bolezen ni ustrezno obvladovana, zlasti na začetku zdravljenja (glejte poglavje 4.4.).

4.8 Neželeni učinki

Glede na izkušnje z gliklazidom so poročali o naslednjih neželenih učinkih. Neželeni učinki so razvrščeni po pogostnosti pojavljanja in po organskih sistemih skladno z MedDRA konvencijo:

zelo pogosti ($\geq 1/10$)

pogosti ($\geq 1/100$ do $< 1/10$)

občasni ($\geq 1/1.000$ do $< 1/100$)

redki ($\geq 1/10.000$ do $< 1/1.000$)

zelo redki (< 1/10.000)
neznana (pogostnosti iz razpoložljivih podatkov ni mogoče oceniti)

Bolezni krvi in limfatičnega sistema

Redki: hematološke spremembe, kot so anemija, levkopenija, trombocitopenija, granulocitopenija.

Na splošno izginejo po ukinitvi zdravila.

Presnovne in prehranske motnje

Neznana: hipoglikemija.

Očesne bolezni

Neznana: prehodne motnje vida.

To se lahko pojavi zlasti na začetku zdravljenja, zaradi sprememb ravni glukoze v krvi.

Bolezni prebavil

Neznana: bolečine v trebuhu, navzea, bruhanje, dispepsija, diareja in zaprtje.

Če se pojavijo te težave, se jim je mogoče izogniti ali jih ublažiti z jemanjem gliklazida med zajtrkom.

Bolezni jeter, žolčnika in žolčevodov

Neznana: povečanje vrednosti jetrnih encimov (AST, ALT, alkalne fosfataze), hepatitis (posamezni primeri).

Če se pojavi holestatska zlatenica, je zdravljenje potrebno prekiniti. Zgoraj navedeni simptomi po prenehanju zdravljenja navadno izginejo.

Bolezni kože in podkožja

Neznana: izpuščaji, srbenje, koprivnica, angioedem, eritem, makulopapularni izpuščaji, bulozne reakcije (kot so Stevens-Johnsonov sindrom in toksična epidermalna nekroliza) in izjemoma z zdravilom povzročeni kožni izpuščaji z eozinofilijo in sistemskimi simptomi (DRESS - *Drug Rash with Eosinophilia and Systemic Symptoms*).

- *Učinki razreda zdravil*

Kot pri drugih sulfonilsečninah so opazili naslednje neželene učinke: primere eritrocitopenije, agranulocitoze, hemolitične anemije, pancitopenije, alergijskega vaskulitisa, hiponatriemije, povečanja vrednosti jetrnih encimov in celo poslabšanja delovanja jeter (na primer obolestazi in zlatenici) ter hepatitisa, ki so se po ukinitvi sulfonilsečnine ublažili, pri posameznih bolnikih pa je prišlo do jetrne odpovedi, ki je ogrožala življenje.

Opis izbranih neželenih učinkov

Hipoglikemija

Kot velja tudi za druge sulfonilsečnine, lahko zdravljenje z zdravilom Gliklazid Lek povzroči hipoglikemijo, če bolnik nima rednih obrokov in zlasti če jih izpusti. Možni simptomi hipoglikemije so: glavobol, huda lakota, navzea, bruhanje, utrujenost, motnje spanja, agitiranost, agresivnost, slaba koncentracija, zmanjšana budnost in upočasnjene reakcije, depresija, zmedenost, motnje vida in govora, afazija, tremor, pareza, senzorične motnje, omotica, občutek nemoči, izguba nadzora nad sabo, delirij, konvulzije, plitvo dihanje, bradikardija, dremavost in izguba zavesti, kar se lahko konča s komo ali smrtjo.

Opazimo lahko tudi znake adrenergične kontraregulacije: potenje, lepljivo in vlažno kožo, anksioznost, tahikardijo, hipertenzijo, palpitacije, angino pectoris in srčne aritmije. Običajno simptomi izginejo po zaužitju ogljikovih hidratov (sladkorja), medtem ko umetna sladila nimajo nikakršnega učinka. Izkušnje z drugimi sulfonilsečninami kažejo, da se hipoglikemija lahko ponovi, tudi če se ukrepi sprva izkažejo za učinkovite. Če je epizoda hipoglikemije huda ali dolgotrajna, čeprav smo jo z zaužitjem sladkorja trenutno uredili, je potrebno takojšnje zdravljenje pri zdravniku ali celo v bolnišnici.

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih zdravila po izdaji dovoljenja za promet je pomembno. Omogoča namreč stalno spremljanje razmerja med koristmi in tveganji zdravila. Od zdravstvenih delavcev se zahteva, da poročajo o katerem koli domnevnem neželenem učinku zdravila na:

Javna agencija Republike Slovenije za zdravila in medicinske pripomočke, Sektor za farmakovigilanco, Nacionalni center za farmakovigilanco, Slovenčeva ulica 22, SI-1000 Ljubljana; Tel: +386 (0)8 2000 500, Faks: +386 (0)8 2000 510, e-pošta: h-farmakovigilanca@jazmp.si, spletna stran: www.jazmp.si

4.9 Preveliko odmerjanje

Preveliko odmerjanje sulfonilsečnin lahko povzroči hipoglikemijo.

Zmerne simptome hipoglikemije brez izgube zavesti ali kakršnih koli nevroloških znakov je mogoče odpraviti z vnosom ogljikovih hidratov, prilagajanjem odmerka in/ali spremembo diete. Zdravnik mora bolnika strogo nadzorovati, dokler ni prepričan, da ni več v nevarnosti.

Možne so hude hipoglikemične reakcije s komo, konvulzijami ali drugimi nevrološkimi motnjami. Tovrstne bolnike je treba zdraviti urgentno in jih takoj hospitalizirati.

Če ugotovite hipoglikemično komo ali sumite nanjo, dajte bolniku hitro intravensko injekcijo 50 ml koncentrirane raztopine glukoze (20-30 %). Temu mora slediti stalna infuzija bolj razredčene raztopine glukoze (10 %) s hitrostjo, ki ohranja koncentracijo glukoze v krvi nad 1 g/l. Bolnike je treba pozorno spremljati. Glede na njihovo stanje po teh ukrepih se zdravnik odloči, ali je potrebno nadaljnje spremljanje.

Dializa v primeru prevelikega odmerjanja ni koristna zaradi močne vezave gliklazida na beljakovine.

5. FARMAKOLOŠKE LASTNOSTI

5.1 Farmakodinamične lastnosti

Farmakoterapevtska skupina: zdravila za zdravljenje sladkorne bolezni, zdravila za zniževanje krvnega sladkorja, brez insulinov, sulfonilsečnine
Oznaka ATC: A10BB09

Mehanizem delovanja

Gliklazid je hipoglikemična sulfonilsečnina, peroralna antidiabetična učinkovina, ki se od sorodnih spojin razlikuje po heterocikličnem obroču, ki vsebuje dušik in ima endociklično vez.

Gliklazid znižuje raven glukoze v krvi s spodbujanjem izločanja insulina iz celic β v Langerhansovih otočjih trebušne slinavke. Povišanje ravni insulina in C-peptida po obroku nastopa tudi še po dveh letih zdravljenja.

Poleg teh presnovnih lastnosti ima gliklazid tudi hemovaskularne lastnosti.

Farmakodinamični učinki

Učinek na sproščanje insulina

Pri bolnikih s sladkorno boleznijo tipa 2, gliklazid ponovno vzpostavi prvi vrh izločanja insulina kot odziv na glukozo ter poveča drugo fazo izločanja insulina. Signifikantno povečanje odziva insulina opazimo po spodbujanju z obroki ali glukozo.

Hemovaskularne lastnosti

Gliklazid zmanjšuje mikrotrombozo preko dveh mehanizmov, ki bi lahko bila udeležena pri zapletih sladkorne bolezni:

- delno zaviranje agregacije in adhezije trombocitov z zmanjšanjem kazalcev aktivacije trombocitov (beta tromboglobulina, tromboksana B₂).
- delovanje na fibrinolitično aktivnost v žilnem endoteliju s povečanjem aktivnosti tkivnega aktivatorja plazminogena (tPA).

5.2 Farmakokinetične lastnosti

Absorpcija

Koncentracija gliklazida v plazmi se postopoma povečuje v prvih 6 urah, nato pa doseže končno raven, ki se ohranja od 6 do 12 ur po jemanju.

Razlike med posamezniki so majhne.

Gliklazid se v celoti absorbira. Uživanje hrane ne vpliva na hitrost ali stopnjo absorpcije.

Porazdelitev

Vezava na beljakovine v plazmi je približno 95 %. Prostornina porazdelitve je približno 30 litrov. Učinkovito koncentracijo gliklazida v plazmi lahko 24 ur vzdržujemo z enim samim odmerkom zdravila Gliklazid Lek na dan.

Biotransformacija

Gliklazid se presnovi predvsem v jetrih in se izloča z urinom: v njem najdemo manj kot 1 % zdravila v nespremenjeni obliki. V plazmi niso zasledili nobenega od aktivnih presnovkov.

Izločanje

Razpolovni čas izločanja gliklazida se giblje med 12 in 20 urami.

Linearnost/nelinearnost

Odvisnost površine pod krivuljo koncentracije po času od prejetih odmerkov v razponu do 120 mg je linearna.

Posebne skupine bolnikov

Starejši

Pri starejših bolnikih niso opazili klinično pomembnih sprememb farmakokinetičnih parametrov.

5.3 Predklinični podatki o varnosti

Predklinični podatki niso pokazali nikakršnih posebnih nevarnosti za človeka na podlagi konvencionalnih študij o toksičnosti pri ponavljajočih se odmerkih in genotoksičnosti. Dolgoročnih študij o kancerogenosti niso opravili. Študije pri živalih niso pokazale nikakršnih teratogenih sprememb, opazali pa so manjšo telesno maso ploda pri živalih, ki so prejemale 25-krat večje odmerke od največjega priporočenega odmerka za človeka. V študijah na živalih plodnost in sposobnost razmnoževanja po uporabi gliklazida nista bili prizadeti.

6. FARMACEVTSKI PODATKI

6.1 Seznam pomožnih snovi

kalcijev hidrogen fosfat dihidrat
povidon K30
hipromeloza K100
hipromeloza K4M
magnezijev stearat

6.2 Inkompatibilnosti

Navedba smiselno ni potrebna.

6.3 Rok uporabnosti

2 leti

6.4 Posebna navodila za shranjevanje

Shranjujte pri temperaturi do 25 °C.

6.5 Vrsta ovojnine in vsebina

Pretisni omot iz prozornega polivinilklorida in aluminija (PVC-Al)
Pretisni omot iz prozornega polivinilklorida, poliklorotrifluoroetilena in aluminija (PVC/Aclar-Al)

Velikost pakiranja: 10, 30, 60, 90, 100 in 180 tablet s prirejenim sproščanjem.
Na trgu morda ni vseh navedenih pakiranj.

6.6 Posebni varnostni ukrepi za odstranjevanje in ravnanje z zdravilom

Ni posebnih zahtev.

Neuporabljeno zdravilo ali odpadni material zavržite v skladu z lokalnimi predpisi.

7. IMETNIK DOVOLJENJA ZA PROMET Z ZDRAVILOM

Lek farmacevtska družba d.d., Verovškova 57, 1526 Ljubljana, Slovenija

8. ŠTEVILKA (ŠTEVILKE) DOVOLJENJA (DOVOLJENJ) ZA PROMET Z ZDRAVILOM

H/18/02472/001-012

9. DATUM PRIDOBITVE/PODALJŠANJA DOVOLJENJA ZA PROMET Z ZDRAVILOM

Datum prve odobritve: 9.7.2018

Datum zadnjega podaljšanja: 3.11.2020

10. DATUM ZADNJE REVIZIJE BESEDILA

24.6.2020