

Амарил®
Глімепірид

Амарил® — висока ефективність^{1,2} при дбайливому впливі на β-клітини³



- Амарил®
- ✓ Стартова доза — 1 мг⁴
- ✓ Високий комплаєнс⁵: застосування — 1 раз на добу⁴
- ✓ Зручність підбору дози: різноманітні форми випуску (2, 3, 4 мг), застосування 1 таблетки⁴

1. Полозова Л. Г. МЭЖ. 2013; 4 (52): 36—41. 2. Weitgasser et al. Diabetes Research and Clinical Practice. 2003; 61: 13—19. 3. Müller G. et al. Diabetes Res Clin Pract. 1995 Aug; 28 Suppl: S115—37. 4. Інструкція для медичного застосування препарату АМАРИЛ®. Наказ МОЗ України № 945 від 23.11.2012, зі змінами, внесеними наказом МОЗ України № 1225 від 10.11.2016. 5. Colombo G. et al. Patient Prefer Adherence. 2012; 6:653—61.

Інформація про препарат АМАРИЛ®

Реєстраційне посвідчення в Україні № UA/7389/01/01, UA/7389/01/02, UA/7389/01/03 (Амарил®), наказ МОЗ України № 945 від 23.11.2012. Зміни, внесені до реєстраційного посвідчення, затверджені наказом МОЗ України № 1225 від 10.11.2016.

Склад*. Активна речовина: глімепірид; 1 таблетка містить глімепіриду 2 мг або 3 мг, або 4 мг.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Гіпоглікемічні засоби, за винятком інсулінів. Сульфонаміди, похідні сечовини. Код АТС A10B B12.

Фармакологічні властивості*. Глімепірид — гіпоглікемічний (цукрознижувальний) препарат для перорального застосування — похідне сульфонілсечовини. Глімепірид діє переважно шляхом стимуляції вивільнення інсуліну із бета-клітин підшлункової залози. Крім того, глімепірид чинить виражену позапанкреатичну дію.

Показання. Цукровий діабет 2-го типу у дорослих, якщо рівень цукру в крові не можна підтримувати лише дієтою, фізичними вправами та зниженням маси тіла.

Протипоказання. Амарил® не призначений для інсулінозалежного цукрового діабету 1-го типу, діабетичного кетоацидозу, діабетичної коми. Застосування препарату протипоказане хворим із тяжкими порушеннями функції нирок або печінки. У випадку тяжких порушень функції нирок або печінки потрібно перевести пацієнта на інсулін. Амарил® не можна застосовувати хворим із підвищеною чутливістю до глімепіриду або до будь-якого допоміжного інгредієнта, що входить до складу препарату, до похідних сульфонілсечовини або інших сульфаніламідних препаратів (ризик розвитку реакції підвищеної чутливості). Період вагітності або годування груддю.

Спосіб застосування та дози*. Початкова доза становить 1 мг (1/2 таблетки по 2 мг) глімепіриду на добу. Якщо така доза дозволяє досягти контролю захворювання, її слід застосовувати для підтримувальної терапії. Якщо глікемічний контроль не є оптимальним, дозу потрібно збільшувати до 2, 3 чи 4 мг глімепіриду на добу поетапно (з інтервалом в 1—2 тижні). Максимальна рекомендована доза — 6 мг препарату Амарил® на добу.

Побічні реакції*. Метаболічні та аліментарні розлади. Рідко ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$): гіпоглікемія. З боку крові та лімфатичної системи. Рідко ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$): тромбоцитопенія, лейкопенія, гранулоцитопенія, агранулоцитоз, еритропенія, гемолітична анемія та панцитопенія, які, як правило, є зворотними після відміни препарату.

Упаковка. № 30 (15 × 2): по 15 таблеток у блистері, по два блистери в картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

* Інформацію подано скорочено. Повна інформація про препарат міститься в інструкції з медичного застосування препарату, затвердженій наказом МОЗ України № 945 від 23.11.2012, зі змінами, внесеними наказом МОЗ України № 1225 від 10.11.2016.

Інформація для розміщення у спеціалізованих виданнях, призначених для медичних установ, лікарів та фармацевтичних працівників, а також для розповсюдження на семінарах, конференціях, симпозиумах з медичної тематики. Матеріал призначений виключно для спеціалістів охорони здоров'я. Перед використанням препарату обов'язково ознайомтесь з повною інструкцією для медичного застосування препарату. SAUA.GLI.16.12.0796.

Сахароснижающая терапия СД 2 типа: как выбрать оптимальный вариант?

Лечение сахарного диабета (СД) 2 типа недаром сравнивают с рычажными весами, равновесие которых легко нарушить. Недостаточно интенсивное лечение склоняет чашу весов в сторону хронических диабетических осложнений, а чрезмерно жесткое или нерационально подобранное – в сторону гипогликемии и прибавки массы тела. Однако существуют сахароснижающие препараты, с которыми врачу не приходится чувствовать себя канатоходцем, рискуя в любой момент сорваться в пропасть. О них участником конференции «Проблемы и перспективы семейной медицины в Украине», которая прошла 26-27 октября в г. Киеве, рассказала заведующая отделом профилактики и лечения сахарного диабета и его осложнений Украинского научно-практического центра эндокринной хирургии, трансплантации эндокринных органов и тканей МЗ Украины (г. Киев), доктор медицинских наук Татьяна Юрьевна Юзвенко.

В начале своего выступления докладчик отметила, что СД 2 типа остается одной из наиболее актуальных проблем современной медицины, а в нашей стране она стоит особо остро. Во-первых, это связано с тем, что в Украине имеет место гиподиагностика СД 2 типа. Так, согласно эпидемиологическим исследованиям, проведенным в разных странах мира, распространенность СД в популяции варьирует от 4 до 7%. В Украине же на сегодняшний день зарегистрировано примерно 1,2 млн больных диабетом, что составляет менее 3%. По оценкам экспертов, этот показатель ниже реальной распространенности заболевания почти в 3 раза. Это значит, что примерно 2 млн людей в нашей стране не знают о наличии у них диабета, не получают необходимого лечения и подвергаются высочайшему риску развития осложнений и преждевременной смерти.

Во-вторых, серьезные опасения вызывает неудовлетворительный контроль заболевания у лиц с уже диагностированным СД 2 типа. По имеющимся сегодня данным, средний показатель гликозилированного гемоглобина (HbA_{1c}) у больных диабетом в Украине составляет 8,7%, что существенно выше целевого уровня. В результате почти у всех больных СД 2 типа имеют место микрососудистые и у 50% – макрососудистые осложнения (регистр IDMP5, 2014). Основными причинами неудовлетворительного контроля СД 2 типа считают несвоевременную диагностику данного заболевания, его сложный и многофакторный патогенез, прогрессирующее течение, клиническую инерцию врачей и др.

Критически важная роль контроля гликемии у пациентов с СД признана давно. Еще в исследовании UKPDS, завершившемся почти 20 лет назад, было показано, что снижение уровня HbA_{1c} на 1% ассоциируется с сокращением риска развития микрососудистых осложнений на 37%, инфаркта миокарда – на 14%, смерти по причине СД – на 21%.

Что же следует подразумевать под гликемическим контролем? Согласно современным рекомендациям для каждого пациента с СД 2 типа устанавливается индивидуальный целевой уровень HbA_{1c}, который может быть достигнут без неприемлемых рисков. Для большинства больных такой целью может служить показатель HbA_{1c} <7%. У некоторых относительно молодых и здоровых пациентов может быть рассмотрен более жесткий контроль (HbA_{1c} <6,5%). В то же время при наличии тяжелой гипогликемии в анамнезе, небольшой ожидаемой продолжительности жизни, серьезных осложнениях или сопутствующих заболеваниях возможна более мягкая гликемическая цель (HbA_{1c} <8%). Контроль уровня HbA_{1c} должен осуществляться каждые 3-6 мес (чаще на старте лечения, реже при относительно стабильном контроле гликемии).

Что касается алгоритма сахароснижающей терапии при СД 2 типа, то, согласно современным рекомендациям, в большинстве случаев лечение начинается с метформина (при отсутствии противопоказаний к его назначению и хорошей переносимости). У пациентов с уровнем HbA_{1c} ≥9% для скорейшего достижения гликемического

контроля должна быть рассмотрена комбинированная стартовая терапия. Если целевой уровень HbA_{1c} на фоне стартовой терапии не достигнут или же с течением времени контроль был утрачен в связи с прогрессирующим характером СД 2 типа, необходима интенсификация лечения, то есть добавление других сахароснижающих препаратов. Выбор лекарственных средств второй и третьей линии терапии современные клинические руководства оставляют за врачом, ведь в каждой конкретной клинической ситуации он может отличаться. При этом важно учитывать механизм действия сахароснижающих средств, то есть они должны дополнять, а не дублировать друг друга.

Одним из наиболее широко используемых классов сахароснижающих препаратов, назначаемых в дополнение к метформину или же вместо него (в случае непереносимости), являются производные сульфонилмочевины. Безоговорочными преимуществами этих лекарственных средств является их высокая сахароснижающая активность и низкая стоимость. Среди некоторых недостатков данного класса называют прибавление массы тела, а также повышенный риск гипогликемии и сердечно-сосудистых осложнений. Справедливо будет отметить, что указанные побочные эффекты больше характерны для производных сульфонилмочевины первых поколений. Действительно, старые представители этого класса характеризуются чрезмерной стимуляцией инсулиновой секреции, истощением β-клеток, частыми гипогликемическими состояниями, неблагоприятным влиянием на сердечно-сосудистую систему. Новая генерация препаратов сульфонилмочевины при столь же выраженном сахароснижающем эффекте обладает намного лучшим профилем безопасности.

По мнению докладчика, особого внимания среди производных сульфонилмочевины заслуживает глимепирид (оригинальный препарат Амарил®) – представитель третьего поколения данного класса. Его важным отличием является двойной механизм действия, включающий не только стимуляцию секреции

инсулина, но и уменьшение инсулинорезистентности, что реализуется за счет увеличения концентрации и активности белков-транспортёров глюкозы (GLUT-4) в клетках периферических тканей. Немаловажен и тот факт, что для глимепирида характерна глюкозозависимая стимуляция секреции инсулина, что обеспечивает близкий к физиологическому профиль инсулинемии и не истощает β-клетки поджелудочной железы. При сравнении его с другими препаратами сульфонилмочевины заслуживает внимание тот факт, что при эквивалентном снижении уровня глюкозы в крови глимепирид в меньшей степени стимулирует секрецию инсулина.

Благодаря уникальному механизму действия глимепирид ассоциируется с низким риском гипогликемии и прибавки веса. Более того, по некоторым данным, глимепирид даже может приводить к некоторой потере массы тела (R. Weitgasser et al., 2003; S. Martin et al., 2003). Еще одним преимуществом является кардиоваскулярная безопасность препарата, что очень важно с учетом высокого сердечно-сосудистого риска у пациентов с СД 2 типа.

Препарат Амарил® нужно принимать всего 1 раз в сутки, что наряду с хорошей гастроинтестинальной переносимостью обеспечивает высокий комплаенс. Амарил® представлен в нескольких дозировках (2; 3 и 4 мг), что существенно облегчает процесс титрации дозы.

Амарил® успешно применяется на разных ступенях алгоритма сахароснижающей терапии. Например, он может быть назначен в монотерапии при непереносимости метформина или наличии противопоказаний к его применению. В одном из рандомизированных двойных слепых плацебо-контролируемых исследований с участием 249 пациентов с недавно выявленным СД 2 типа стартовая монотерапия препаратом Амарил® привела к снижению показателя уровня HbA_{1c} на 2,2%, в то время как в группе плацебо он уменьшился только на 1,1%. В другом исследовании с участием 391 пациента с СД 2 типа стартовая терапия



Т.Ю. Юзвенко

глимепиридом в течение 16 нед обеспечила снижение среднего уровня HbA_{1c} на 1,7%, благодаря чему 61% участников достигли целевого уровня гликемии.

В связи с тем что СД 2 типа является прогрессирующим заболеванием, рано или поздно у большинства пациентов возникает необходимость в назначении комбинированной терапии. Ранее начало такой терапии имеет ряд преимуществ по сравнению с повышением дозы препарата в монотерапии. Так, два сахароснижающих средства разных классов обладают разными механизмами действия и, соответственно, дополняют друг друга. Это позволяет быстрее достичь гликемического контроля и использовать при этом меньшие дозы, а значит – снизить риск нежелательных явлений. Комбинация глимепирида и метформина является отличным вариантом, поскольку оказывает влияние на все основные звенья патогенеза СД 2 типа (снижение секреции инсулина, повышение секреции глюкагона, инсулинорезистентность, гиперпродукция глюкозы печенью) (рис.). Повышения приверженности к лечению в случае необходимости назначения двойной сахароснижающей терапии можно добиться с помощью фиксированной комбинации метформина и глимепирида (оригинальный препарат Амарил® М).

У значительной части больных СД 2 типа возникает необходимость в назначении заместительной инсулинотерапии. В настоящее время практически все производные сульфонилмочевины не рекомендуются применять в комбинации с базальным инсулином из-за высокого риска гипогликемии, однако это ограничение не касается глимепирида. В многочисленных исследованиях было показано, что комбинация метформина, глимепирида и инсулинотерапии при ее недостаточной эффективности позволяет улучшить контроль гликемии, снизить дозу экзогенного инсулина, сократить частоту гипогликемических эпизодов (H. Ose et al., 2005; A.J. Garber et al., 2003; M.U. Kabadi et al., 2003 и др.).

Завершая свое выступление, докладчик подчеркнула, что любая сахароснижающая терапия требует определения индивидуального целевого уровня HbA_{1c} с регулярным контролем его достижения каждые 3 мес, особенно на старте лечения. Клиническая инерция в лечении пациентов с СД 2 типа намного увеличивает риск осложнений, поэтому очень важно начинать лечение как можно раньше и своевременно его интенсифицировать. При выборе схемы лечения особое внимание нужно уделить оценке риска гипогликемии. Комбинированная терапия метформином и глимепиридом помогает обеспечить надежный контроль гликемии у большинства больных СД 2 типа, она хорошо переносится пациентами и ассоциируется с низким риском гипогликемии и прибавления массы тела. Фиксированная комбинация препарата Амарил® М повышает комплаенс, а следовательно, и эффективность лечения.

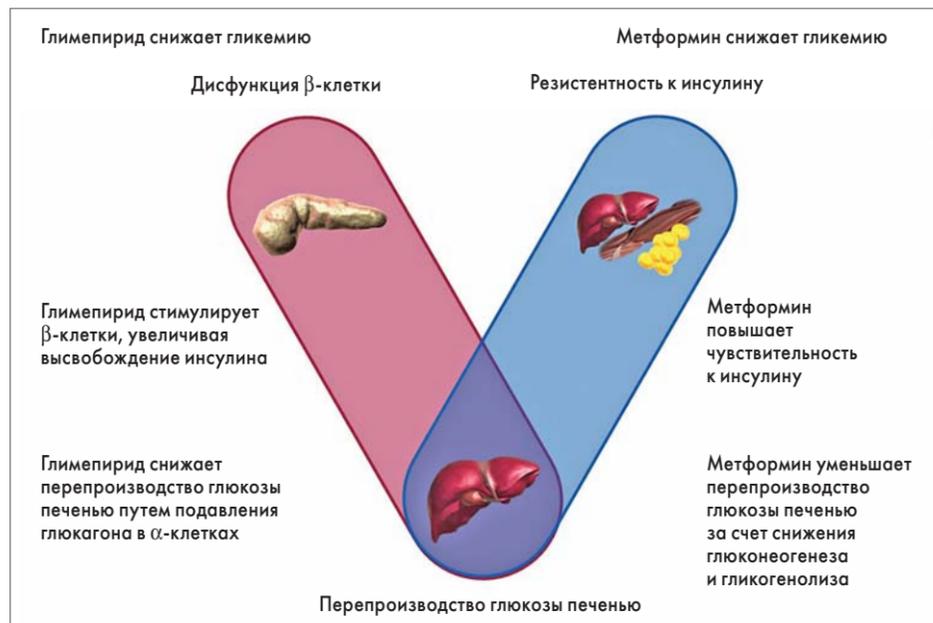


Рис. Глимепирид и метформин дополняют друг друга, обеспечивая влияние на все основные звенья патогенеза СД 2 типа

Подготовила Наталья Мищенко