LIPANTYL®

GLIMEPIRIDA

LIPANTYL ® 2

Glimepirida 2 mg

FORMULA:

Cada comprimido contiene:

Glimepirida...................................................................................................................2 mg

Excipientes..................................................................................................................c.s.p.

LIPANTYL® 4

Glimepirida 4 mg

FORMULA:

Cada comprimido contiene:

Glimepirida...................................................................................................................4 mg

Excipientes..................................................................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Hipoglucemiante oral.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

La Glimepirida es una sustancia con actividad hipoglucemiante por vía oral, que pertenece al grupo de las sulfonilureas. Está indicado en la diabetes mellitus no insulinodependiente. La Glimepirida actúa principalmente estimulando la liberación de Insulina por las células ß-pancreáticas. Mediante el incremento de la respuesta de las células ß-pancreáticas al estímulo fisiológico de la glucosa. También parece poseer pronunciados efectos extrapancreáticos. Las sulfonilureas regulan la secreción de Insulina cerrando los canales de potasio ATP-sensibles en la membrana de la célula ß. El cierre de los canales de potasio induce la despolarización de la célula ß y origina un incremento en el flujo de calcio en la célula, por apertura de los canales de calcio. Esto resulta en la liberación de insulina por exocitosis. La Glimepirida se une, con una alta tasa de intercambio a una proteína de la membrana de la célula beta asociada con el canal de potasio ATP-sensible por que es distinta del lugar de unión usual de la sulfonilurea.

Actividad extrapancreática: Son entre otros la mejoría de la sensibilidad del tejido periférico para Insulina y el descenso de la captación hepática de Insulina. La captación de glucosa sanguínea a músculo periférico y tejidos adiposos sucede a través de proteínas de transporte de la membrana celular. El transporte de glucosa en estos tejidos constituye el paso limitante de su utilización. La Glimepirida incrementa muy rápidamente el número de moléculas transportadoras activas de glucosa en las membranas de las células musculares y adiposas, resultando en un estímulo de la captación de glucosa.

La Glimepirida incrementa la actividad de la fosfolipasa C glucosil-fosfatidilinositol específica, la cual puede correlacionarse con la lipogénesis, y la glucogénesis inducidas en adipocitos y células musculares aisladas. La Glimepirida inhibe la producción de glucosa en el hígado incrementando la concentración intracelular de fructosa 2,6 bifosfato, que a su vez inhibe la gluconeogénesis.

En personas sanas la dosis oral mínima eficaz es de, aproximadamente 0,6 mg. El efecto de la Glimepirida es dosis-dependiente y reproducible. La reducción en la secreción de Insulina como respuesta fisiológica al ejercicio físico intenso está presente durante el tratamiento con Glimepirida. No hay diferencias significativas en el efecto, respecto a que la Glimepirida se administre 30 minutos o inmediatamente antes de una comida.

En pacientes diabéticos puede conseguirse un buen control durante 24 horas con una dosis única diaria. Aunque el hidroxi-metabolito de la Glimepirida causa un pequeño pero significativo descenso en la glucemia en personas sanas, sólo representa una pequeña parte del efecto total del fármaco.

Tratamiento combinado con Insulina:

Los datos para el tratamiento combinado con Insulina son limitados. En pacientes no adecuadamente controlados con dosis máximas de Glimepirida puede iniciarse un tratamiento concomitante con Insulina. En dos estudios, la combinación alcanzó la misma mejora en el control metabólico que la Insulina sola; sin embargo, en el tratamiento combinado fue requerida una dosis media de Insulina más baja. La biodisponibilidad de la Glimepirida tras su administración oral es completa. La ingesta alimenticia no tiene influencia relevante en su absorción, aunque está reducida ligeramente su velocidad. La vida media sérica dominante, relevante para las concentraciones séricas en condiciones de dosis múltiples, es de 5 - 8 horas. Después se han encontrado valores ligeramente superiores en sus vidas medias a dosis más altas.

Tras una dosis única de Glimepirida marcada radioactivamente, el 58 % de la radioactividad se recuperó en la orina y el 35 % en las heces. No se detectó sustancia sin metabolizar en la orina. Se detectaron en orina y heces dos metabolitos, el hidroxi y el carboxi-derivado procedentes muy probablemente del metabolismo hepático. Después de la administración oral de Glimepirida, las vidas medias finales de estos metabolitos fueron de 3 a 6 y de 5 a 6 horas respectivamente. La comparación de dosis únicas y múltiples 1 vez al día reveló diferencias no significativas en la farmacocinética y la variabilidad intraindividual fue muy baja. No se detectó acumulación relevante del fármaco.

La farmacocinética fue similar en hombres y en mujeres, así como en pacientes jóvenes y ancianos (mayores de 65 años). En pacientes con un reducido aclaramiento de Creatinina se detectó una tendencia al incremento del aclaramiento de Glimepirida y al descenso de sus concentraciones medias séricas, probablemente resultado de una eliminación más rápida causada por una menor unión a proteínas. La eliminación renal de ambos metabolitos estaba también disminuida.

En general no se asume un riesgo adicional de acumulación en dichos pacientes. La farmacocinética en 5 pacientes no diabéticos tras cirugía biliar fue similar a la de personas sanas. En animales la Glimepirida se excreta en la leche. La Glimepirida atraviesa la barrera placentaria. Su capacidad de atravesar la barrea hematoencefálica es muy reducida.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Diabetes mellitus no insulinodependiente (tipo II) del adulto, en aquellos sujetos que no pueden estabilizar su glucemia adecuadamente por la dieta, el ejercicio físico y la disminución de peso.

POSOLOGIA:

La dosis inicial aconsejada es de 1 mg una sola vez por día.

Esta posología puede aumentarse en forma gradual según los siguientes incrementos: 2 mg, 3 mg, 4 mg, 6 mg, 8 mg.

La ingesta de la medicación se hará inmediatamente antes del desayuno o, en caso de no desayunar, antes de la primera comida principal. Es importante no suprimir comidas después de haber recibido el fármaco cuando la respuesta de éste disminuye. Es necesario recordar que podría ser necesario un ajuste posológico en aquellos pacientes que varíen su peso o estilo de vida.

CONTRAINDICACIONES:

Diabetes mellitus insulinodependiente (tipo I). Cetoacidosis diabética. Pre-coma o coma diabético. Antecedentes de hipersensibilidad a la droga o a las sulfonilureas en general, embarazo y lactancia. Sepsis grave en diabéticos.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Bajo ciertas circunstancias pueden presentarse casos aislados de trombocitopenia, leucopenia, anemia hemolítica, insuficiencia hepática con colestasis e ictericia, de allí la necesidad de realizar controles laboratoriales periódicos del funcionamiento hemático y hepático. La capacidad de reacción puede estar afectada debido a una hiperglucemia especialmente para conducir vehículos o maquinarias riesgosas. Durante el embarazo los pacientes deben reemplazar el tratamiento por Insulina.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Son las comunes para otras sulfonilureas: Cefalea, rash cutáneo, prurito, urticaria, astenia, somnolencia, depresión, náuseas, vómitos, mareos, diarrea, colestasis, ictericia. Puede causar hipoglucemia prolongada y severa con signos neurológicos, respiración superficial, bradicardia, colapso vascular y coma similares a un ictus cerebral. En casos aislados pueden observarse vasculitis alérgica o hipersensibilidad de la piel a la luz.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

Sobre la base de la experiencia obtenida con Glimepirida y con otras sulfonilureas deben considerarse las siguientes interacciones:

• Potenciación del efecto hipoglucemiante y, por lo tanto, en algunos casos puede ocurrir hipoglucemia cuando se administra alguno de los siguientes fármacos: Insulina y otros antidiabéticos orales; inhibidores de la ECA; esteroides anabólicos y hormonas sexuales masculinas, Cloranfenicol; derivados Cumarínicos; Ciclofosfamida; Disopiramida; Fenfluramina; Feniramidol; Fibratos; Fluoxetina; Guanetidina; Fosfamida; inhibidores de la MAO; Miconazol; Acido para-amino salicílico; Pentoxifilina (alta dosis parenteral); Fenilbutazona; Azapropazona; Oxifenbutazona; Probenecid; Quinolonas; salicilatos; Sulfinpirazona; Sulfamidas; Tetraciclinas; Tritocualina; Trofosfamida.

• Puede atenuarse el efecto hipoglucemiante y por consiguiente, incrementarse los niveles de glucemia cuando se administra uno de los siguientes medicamentos: Acetazolamida; Barbitúricos; Corticosteroides; Diazóxido; diuréticos; Epinefrina (adrenalina) y otros fármacos simpaticomiméticos; Glucagon; laxantes (después de empleo prolongado); ácido nicotínico (en dosis altas); estrógenos y progestágenos; fenotiazidas; Fenitoína, Rifampicina, hormonas tiroideas.

• Los antagonistas de receptores H2, ß-bloqueadores, la Clonidina y la Reserpina pueden ocasionar potenciación o atenuación del efecto hipoglucemiante.

• Bajo la influencia de medicamentos simpaticolíticos como los ß-bloqueadores, la Clonidina, la Guanetidina y la Reserpina, los signos de contrarregulación adrenérgica a la hipoglucemia pueden estar disminuidos o ausentes.

• La ingestión de alcohol tanto aguda como crónica puede potenciar o atenuar la acción hipoglucemiante de Glimepirida de modo impredecible.

• El efecto de los derivados cumarínicos puede ser aumentado o disminuido.

SOBREDOSIFICACION:

Signos y síntomas: La sobredosificación aguda así como el tratamiento prolongado con dosis muy altas de Glimepirida pueden ocasionar hipoglucemia con amenaza para la vida.

Manejo: Tan pronto como se haya identificado una sobredosis se debe consultar inmediatamente al médico. El paciente debe ingerir azúcar inmediatamente, de ser posible en forma de glucosa, a menos que algún médico ya esté tratando la sobredosis. El monitoreo cuidadoso es esencial hasta que el médico considere que el paciente se encuentra fuera de peligro. Debe recordarse que la hipoglucemia puede recurrir después de la recuperación inicial. La hospitalización puede ser necesaria en algunas ocasiones, aún como medida precautoria. En particular, la sobredosis significativa y las reacciones severas como los signos de pérdida de la conciencia u otros trastornos neurológicos graves son urgencias médicas que requieren tratamiento inmediato y hospitalización. Si, por ejemplo, el paciente está inconsciente, está indicada la inyección intravenosa de una solución de glucosa concentrada (por ejemplo, en los adultos iniciar con 40 mL de solución al 20 %).

Una alternativa que puede considerarse para los adultos es la administración de Glucagon, por ejemplo, en dosis de 0,5 a 1 mg I.V, S.C o I.M. En particular, cuando se trata de hipoglucemia debida a la ingestión accidental en niños y jóvenes, la dosis de glucosa administrada debe ser ajustada cuidadosamente en vista de la posibilidad de producir hiperglucemia peligrosa, y debe ser controlada por medio de monitoreo estricto de la glucosa sanguínea. Los pacientes que han ingerido cantidades que amenazan la vida requieren de desintoxicación, por ejemplo, con lavado gástrico y carbón activado. Después de que se ha completado el reemplazo agudo de glucosa es especialmente necesario administrar por vía intravenosa una infusión de glucosa en concentraciones más bajas, para asegurar que no van a presentarse recurrencias de la hipoglucemia. Las concentraciones de glucosa en sangre deben monitorearse cuidadosamente por lo menos 24 horas.

En caso de sobredosis o ingestión accidental, consultar

En Paraguay: al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel.: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

En Bolivia: al Servicio Hospitalario más cercano.

RESTRICCIONES DE USO:

La Glimepirida debe ser tomada inmediatamente antes o durante una comida. En caso de comidas a intervalos irregulares el tratamiento con Glimepirida puede originar hipoglucemia con los correspondientes signos asociados a ésta, pueden presentarse también signos de adrenérgica (sudoración, ansiedad, taquicardias, hipertensión, palpitaciones, angina de pecho y arritmias). El tratamiento con Glimepirida requiere determinación periódica de los niveles de glucosa en sangre y orina. Se recomienda la determinación de la proporción de hemoglobina A I y posiblemente la de fructosamina. Durante el tratamiento con Glimepirida se requiere realizar periódicamente un control hematológico (especialmente leucocitos y trombocitos) y de la función hepática.

En situaciones de estrés(p.ej, accidentes, operaciones, infecciones con fiebre) puede estar indicado el cambio temporal a Insulina. No se tiene experiencia sobre el uso de Glimepirida en pacientes con trastornos hepáticos graves o en pacientes en diálisis. En tales pacientes está indicado el cambio a Insulina.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30°C

PRESENTACION:

Envase conteniendo 30 comprimidos.

Estos medicamentos deben ser usados únicamente por prescripción médica y no podrán repetirse sin nueva indicación del facultativo.

En caso de uso de estos medicamentos sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quien lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma estos productos sin consultar a su médico.

Paraguay: QUIMFA S.A. | D.T.: Q.F. Laura Ramírez Reg. Prof. Nº 4142 | Venta Bajo Receta. Bolivia: Para QUIMFA BOLIVIA S.A. Calle Francisco Gutiérrez Nº 93 Telef.: (591)-3-3333346 | Santa Cruz | D. T.: Farm. Lizeth Yucra Peredo - Mat. Y-37 | Venta Bajo Receta Médica.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS