



Синтетические пероральные противодиабетические препараты

Классификация современных сахароснижающих препаратов

- Бигуаниды
- Глиниды (меглитиниды)
- Препараты сульфонилмочевины
- Тиазолидиндионы (глитазоны)
- Ингибиторы α -глюкозидаз
- Комбинированные препараты



Бигуаниды (метформины)



- Глюкофаж («Мерк Сантэ для Никомед», Франция)
- Сиофор (Берлин-Хеми, Германия)
- Багомет (Баго, Аргентина)
- НовоФормин® (Ново Нордиск)



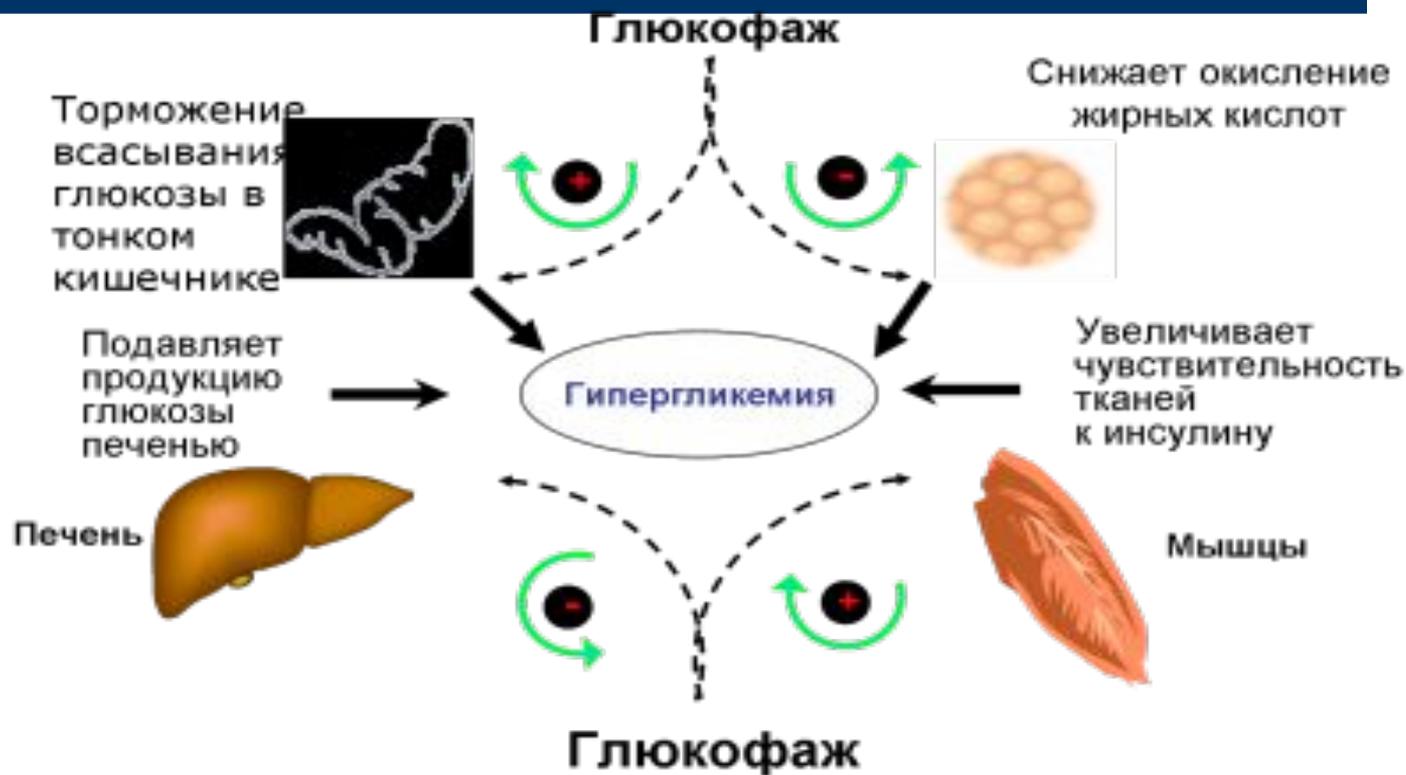
Механизм действия бигуанидов (метформина)



Преимущества метформинов

- Не увеличивают массу тела
- Риск гипогликемий минимальный
- Улучшают клинические исходы у пациентов с сахарным диабетом 2 типа и ожирением

Места воздействия препарата



Уменьшение риска развития осложнений сахарного диабета 2 типа

На фоне приема метформина:

Общая смертность

-36%

Смертность от диабета

-42%

Все диабетические сосудистые осложнения

-32%

Инфаркт миокарда

-39%



Метформин

«Единственный препарат, снижающий уровень смертности, связанной с наличием сахарного диабета, число приступов стенокардии и острых нарушений мозгового кровообращения»

(Konnoeth Curi, De Fronzo R.A., 1998)

Метформин

Побочные эффекты

- металлический привкус во рту,
- метеоризм, тошнота,
- кожные аллергические реакции.

Противопоказания

- почечная и печеночная недостаточность,
- выраженная декомпенсация сахарного диабета,
- беременность и лактация

Глиниды -

Прандиальные регуляторы глюкозы

**Новый класс пероральных
сахароснижающих средств.**

Репаглинид (НОВОНОРМ)

Достоинства глинидов

Эффективность

- эффективно улучшает уровень контроля гликемии у пациентов с сахарным диабетом 2-го типа как в монотерапии, так и в комбинации с инсулином или метформином

Безопасность

- низкий риск гипогликемий
- физиологическая стимуляция секреции инсулина

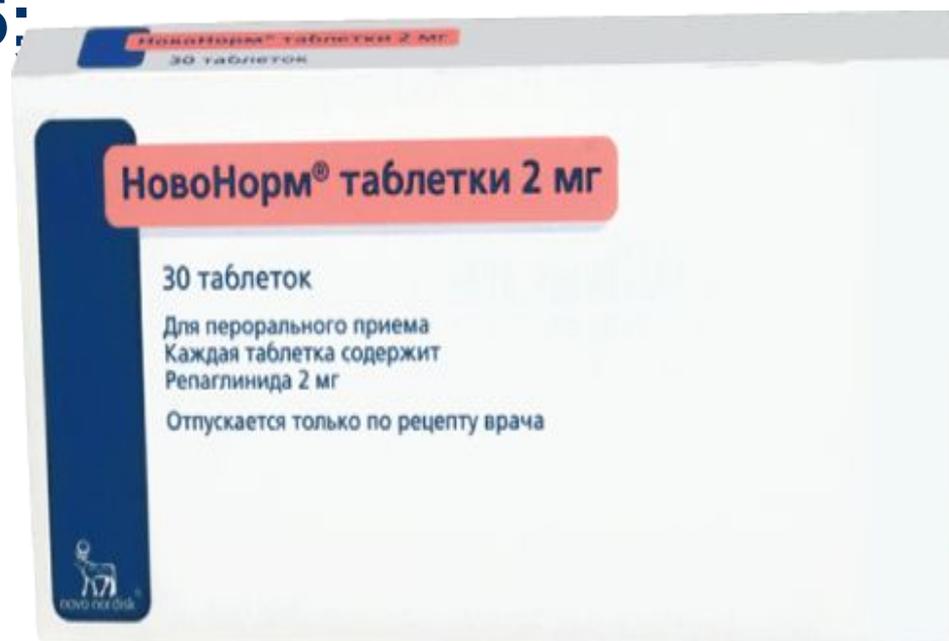
Удобство в применении

- гибкий режим дозирования («Прием пищи – прием препарата»)

Репаглинид НовоНорм

- Таблетки по 0,5;
1 и 2 мг.

Максимальная
доза – 16мг



Недостатки

- прибавка массы тела
- применение кратно количеству приемов пищи
- гипогликемия
- возможна сердечная недостаточность
- высокая стоимость

Производные сульфонилмочевины

- **Механизм действия: стимулируют β -клетки поджелудочной железы, что сопровождается усилением выброса инсулина.**

Особенности

- Назначаются больным старше 35 лет, без осложнений, требующих немедленной инсулинотерапии.
- Не назначаются при тяжелых формах диабета, когда суточная потребность в инсулине превышает 40 ЕД.
- При длительном применении могут вызывать привыкание.

Производные сульфонилмочевины

ПЕРВАЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1955-1956 гг.

карбутамид, толбутамид, хлорпропамид
(эффективная пероральная терапия для пациентов с сахарным диабетом второго типа).

ВТОРАЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1969 г.

глибенкламид, глипизид, гликвидон, гликлазид
(эффективная пероральная терапия с усилением характеристик безопасности).

ТРЕТЬЯ ГЕНЕРАЦИЯ
1995 г.

глимепирид: **Амарил®**
(эффективная пероральная терапия с усилением характеристики безопасности и низким риском развития гипогликемии, инсулино-сберегающим эффектом, удобным режимом дозирования).

Производные сульфонилмочевины

- Глибенкламид (манинил, бетаназ)
- Гликлазид (диабетон МВ)
- Гликвидон (глюренорм)
- Глипизид (минидиаб)
- Глимепирид (амарил)

Глибенкламид (манинил)

- Длительность действия 8-12 часов
- Дозировки: 1,75 мг; 3,5 мг; 5 мг.
- Максимальная суточная доза – 20 мг.
- Прием препарата за 30 минут до еды.



На фоне приема глибенкламида:

Все диабетические осложнения

-12%

Микрососудистые осложнения

-25%

Инфаркт миокарда

-16%

Ретинопатии

-21%

Альбуминурия

-33%

Гликлазид (диабетон МВ)



ADVANCE



Обоснование выбора Диабетона МВ

- **Инновационная структура - эффективное 24-часовое действие при однократном приеме во время завтрака**
- **Разовая доза – 80 мг, мах суточная доза – 320 мг**
- **Эффективный и долгосрочный гликемический контроль**
- **Прекрасная переносимость даже в высоких дозах**
- **Антиоксидантные свойства и прямая сосудистая защита**

Гликвидон Глюренорм



- Производное сульфонилмочевины
- Отличием от других препаратов: 95% препарата выделяется через ЖКТ и 5% через почки.
- Форма выпуска в таблетках по 30 мг, высшая суточная доза 120 мг.
- Может применяться у больных с диабетической нефропатией 1 и 2 ст.

Глимепирид (амарил) препарат 3 поколения

- Таблетки по 1, 2, 3, 4 мг
- 100% биодоступность
- Начало действия: 15-20 минут
- Максимальная концентрация: через 2 часа
- Длительность действия: 24 часа
- Двойной путь выведения: 58% через почки, 42% через ЖКТ



Побочные эффекты производных сульфонилмочевины

- Прибавка веса
- Гипогликемия
- нарушение физиологической регуляции секреции инсулина
- повышение риска у больных:
 - пожилого возраста
 - с хронической почечной недостаточностью

Противопоказания к применению ПСМ

- Коматозные и прекоматозные состояния
- Беременность и лактация
- Тяжелое инфекционное заболевание
- Операционные вмешательства
- Прогрессирующая почечная и печеночная недостаточность
- Аллергические и токсические реакции

Тиазолидиндионы

Росиглитазон (роглит, авандия)

- Повышают чувствительность тканей к инсулину
- Снижают инсулинорезистентность



Побочные эффекты

- Медленное начало действия
- Задержка жидкости
- Сердечная недостаточность
- Прибавка веса
- Склонность к переломам

Противопоказания

- **Заболевания печени**
- **Отеки любого генеза**
- **ХСН любого функционального генеза**
- **ИБС с приемом нитратов**
- **Комбинация с инсулином**
- **Декомпенсация сахарного диабета**
- **При беременности и лактации**

Ингибиторы α -глюкозидаз (глюкобай)



- Основное действие связано с угнетением активности ферментов, участвующих в переваривании углеводов
- Начальные дозы – 50 мг в сутки
- Через 3 дня доза увеличивается до 50 мг - 3 раза в день
- Затем до 100 мг – 3 раза в день
- Прием препарата одновременно с приемом пищи

Комбинированная сахароснижающая терапия

Сахарный диабет типа 2:
два механизма, два
дефекта

Инсулино
резистентность + β -клеточная
дисфункция = СД
типа 2

Метформин + Глибенкламид = Лучший
контроль

Комбинированные препараты



Глибомет, глюкованс



Авандамет



Авандамет:

**росиглитазона малеат/
метформин**

1 мг/500 мг, 2 мг/500 мг, 2 мг/1000

- **Режим дозирования подбирается и устанавливается индивидуально.**
- **Начальная доза - 4 мг/1000 мг.**
- **Максимальная суточная - 8 мг /2000 мг .**
- **Авандамет можно принимать независимо от еды. Прием Авандамета во время или после еды уменьшает нежелательные реакции со стороны желудочно-кишечного тракта, обусловленные метформином.**