

Gliptin

(Coated tablets)



COMPOSITION:

Each coated tablet contains:
Sitagliptin phosphate monohydrate, equivalent to 25, 50, 100 mg of sitagliptin.

MECHANISM OF ACTION:

Gliptin is a member of a class of oral anti-hyperglycaemic agents called dipeptidyl peptidase 4 (DPP-4) inhibitors. The improvement in glycaemic control observed with this agent may be mediated by enhancing the levels of active incretin hormones. Incretin hormones, including glucagon-like peptide-1 (GLP-1) and glucose-dependent insulinotropic peptide (GIP), are released by the intestine throughout the day, and levels are increased in response to a meal. The incretins are part of an endogenous system involved in the physiologic regulation of glucose homeostasis. When blood glucose concentrations are normal or elevated, GLP-1 and GIP increase insulin synthesis and release from pancreatic beta cells.

In addition, GLP-1 lowers glucagon secretion from pancreatic alpha cells. Decreased glucagon concentrations, along with higher insulin levels, lead to reduced hepatic glucose production, resulting in a decrease in blood glucose levels. The activity of GLP-1 and GIP is limited by the DPP-4 enzyme, which rapidly hydrolyses the incretin hormones to produce inactive products.

Gliptin prevents the hydrolysis of incretin hormones by DPP-4, thereby increasing plasma concentrations of the active forms of GLP-1 and GIP. By enhancing active incretin levels, **Gliptin** increases insulin release and decreases glucagon levels in a glucose-dependent manner. In patients with type 2 diabetes with hyperglycaemia, these changes in insulin and glucagon levels lead to lower haemoglobin A1c (HbA1c) and lower fasting and postprandial glucose concentrations.

Gliptin decreases the amount of sugar made by the body. Gliptin is unlikely to cause your blood sugar to be lowered to a dangerous level (hypoglycemia) because it does not work when your blood sugar is low.

INDICATIONS & USAGE:

- **Gliptin** is indicated as an adjunct to diet and exercise to improve glycaemic control in patients with type 2 diabetes mellitus.–
- **Gliptin** is indicated as a monotherapy or combination therapy with metformin or a peroxisome proliferator-activated receptor gamma (PPAR γ) agonist (e.g. thiazolidinediones) when the single agent does not provide adequate glycaemic control.

PREGNANCY:

Pregnancy Category B. There are no adequate data from the use of this drug in pregnant women, so this drug should be used during pregnancy only if clearly needed.

LACTATION:

It is unknown whether this drug is excreted in human breast milk. Caution should be exercised when this drug is administered to a nursing woman.

GERIATRIC USE:

No overall differences in safety or effectiveness were observed between subjects 65 years and over and younger subjects

PEDIATRIC USE:

Safety and effectiveness in pediatric patients under 18 years of age have not been established.

METABOLISM & EXCRETION:

Approximately 79% of this drug is excreted unchanged in the urine. In vitro studies indicated that the primary enzyme responsible for the limited metabolism of this drug was CYP3A4, with contribution from CYP2C8.

The apparent terminal t $\frac{1}{2}$ following a 100 mg oral dose of this drug was approximately 12.4 hours. The renal clearance was approximately 350 ml/min. This drug is eliminated in feces (13%) and urine (87%).

SIDE EFFECTS:

Upper respiratory tract infection, nasopharyngitis, headache, stomach discomfort and diarrhea.

CONTRAINDICATIONS:

Hypersensitivity to the active substance or to any of the excipients, ketoacidosis.

WARNINGS:

A dosage adjustment is recommended in patients with moderate or severe renal insufficiency or with end stage renal disease (ESRD) requiring hemodialysis or peritoneal dialysis.

DRUG INTERACTIONS:

Gliptin had a small effect on plasma digoxin concentrations. Following administration of 0.25 mg digoxin concomitantly with 100 mg of this drug daily for 10 days, the plasma AUC of digoxin was increased on average by 11%, and the plasma C max on average by 18%. No dosage adjustment of digoxin or this drug is recommended.

DOSAGE & ADMINISTRATION:

The recommended dose of this drug is 100 mg once daily, it can be taken with or without food as a monotherapy or a combination therapy with metformin or thiazolidinediones or as an adjunct to diet and exercise.

Patients with Renal insufficiency:

For patients with mild renal insufficiency (creatinine clearance (CrCl) \geq 50 mL/min, no dosage adjustment for this drug is required.

For patients with moderate renal insufficiency (CrCl \geq 30 to <50 mL/min, the dose of **Gliptin** is 50 mg once daily.

For patients with severe renal insufficiency (CrCl < 30 mL/min, or with end-stage renal disease (ESRD) requiring hemodialysis or peritoneal dialysis, the dose of **Gliptin** is 25 mg once daily. **Gliptin** may be administered without regard to the timing of hemodialysis.

OVERDOSE:

Single doses of up to 800 mg of this drug were generally well tolerated. Minimal increases in QTc, not considered to be clinically relevant, were observed in one study at a dose of 800 mg sitagliptin.

STORAGE:

Store in dry place up to 25°C.

PACKAGE:

Gliptin 25: Carton box of 20 coated tablets, blister packed.

Gliptin 50: Carton box of 20 coated tablets, blister packed.

Gliptin 100: Carton box of 10 coated tablets, blister packed.

Gliptin 100: Carton box of 20 coated tablets, blister packed.

PK0414/01

Issue: Aug. 1/10 V2

TPP1301467	THIS IS A MEDICAMENT
<ul style="list-style-type: none">– A medicament is a product which affects your health, and its consumption contrary to instructions is dangerous for you.– Follow strictly the doctor's prescription, the method of use and the instructions of the pharmacist who sold the medicament.– The doctor and the pharmacist are experts in medicine, its benefits and risks.– Do not by yourself interrupt the period of treatment prescribed for you.– Do not repeat the same prescription without consulting your doctor.– Keep medicaments out of reach of children.	
(Council of Arab Health Ministers & Arab Pharmacists Association)	

Ultra Medica Pharmaceutical Industries: Sednaya - Damascus - Syria

Tel.: +963 11 5955339 – Fax: +963 11 5975174

E-mail: ultramed@scs-net.org – www.ultra-medica.net

غلبتين

(مضغوظات ملبسة)



التركيب:

كل مضغوظة ملبسة تحتوي على:

سينتاغلبتين فوسفات أمادي الماء بما يعادل ٢٥ ملغ، ٥٠ ملغ، و ١٠٠ ملغ من السينتاغلبتين.

آلية التأثير:

يعد غلبتين (Gliptin) من الأدوية الخافضة لسكر الدم الفموية التي تثبط إنزيم ديببتيديل بيتيداز-٤.

يعزز غلبتين (Gliptin) مستويات هرمونات الإنكريتين مما يحسن من ضبط سكر الدم.

تشمل هرمونات الإنكريتين البيبتيد الشبيهة بالغلوكاغون (GLP-1)، وعديد البيبتيد المعتمد على الغلوكوز (GIP)، تتحرر هرمونات الإنكريتين من الأمعاء خلال اليوم، وتزداد مستوياتها استجابة لوجبة الطعام. تعد الإنكريتين جزء من الجهاز الداخلي المسؤول عن التنظيم الفيزيولوجي لتوازن الغلوكوز.

عندما تكون مستويات غلوكوز الدم طبيعية أو مرتفعة، فإن (GLP-1) و (GIP) تزيد من تركيب الأنسولين وتحرره من خلايا بيتا البنكرياسية بينما يعمل البيبتيد الشبيهة بالغلوكاغون (GLP-1) على إنقاص إفراز الغلوكاغون من خلايا ألفا البنكرياسية.

إن زيادة تركيب الأنسولين وتحرره من خلايا بيتا البنكرياسية وتناقص إفراز الغلوكاغون من خلايا ألفا البنكرياسية ينتج عنهما تناقص مستويات غلوكوز الدم. إن فعالية البيبتيد الشبيهة بالغلوكاغون (GLP-1) وعديد البيبتيد المعتمد على الغلوكوز (GIP) تتحدد بواسطة إنزيم ديببتيديل بيتيداز-٤، الذي يعمل على حلمهة هرمونات الإنكريتين إلى منتجات غير فعالة.

يمنع غلبتين (Gliptin) حلمهة هرمونات الإنكريتين بواسطة إنزيم ديببتيديل بيتيداز-٤ (DPP-4)، مما يزيد التركيز البلازمية للأشكال الفعالة للبيبتيد الشبيهة بالغلوكاغون (GLP-1) وعديد البيبتيد المعتمد على الغلوكوز (GIP)، وهذا بدوره يعزز من مستويات هرمونات الإنكريتين الفعالة.

يزيد غلبتين (Gliptin) تحرر الأنسولين وينقص مستويات الغلوكاغون على نحو معتمد على الغلوكوز.

تؤدي هذه التبدلات في مستويات الأنسولين والغلوكاغون عند مرضى النمط الثاني من داء السكري إلى انخفاض الهيموغلوبين الغليكوزي (HbA1c) وانخفاض تركيز الغلوكوز الصيامي وما بعد الوجبة الطعامة.

يؤدي غلبتين (Gliptin) إلى خفض كمية السكر التي يفرزها الجسم، وليس من المحتمل أن يتسبب غلبتين (Gliptin) في تخفيض معدل سكر الدم إلى مستوى خطير (مرض نقص السكر في الدم) لأن هذا الدواء لا يعمل عندما يكون مستوى سكر الدم منخفضاً.

الاستطبايات والاستعمال:

يستعمل غلبتين (Gliptin) لمعالجة مرضى النمط الثاني من داء السكري، حيث يُحسّن ضبط سكر الدم إضافة للحمية الغذائية والتمارين الرياضية.

يستعمل غلبتين (Gliptin) كعلاج أحادية لداء السكري أو بالمشاركة مع الميتفورمين أو زمرة التيازوليديين ديون وذلك عندما تكون المعالجة بدواء واحد غير كافية لضبط سكر الدم.

الحمل:

ينتمي للفتة B عند الحامل، ولا توجد بيانات كافية عن استعماله عند النساء الحوامل، لذلك تتوجب استشارة الطبيب خلال فترة الحمل.

الإرضاع:

لم يعرف إذا كان هذا الدواء يطرح في حليب الأم أم لا، لذا يجب الحذر عند استعماله خلال فترة الإرضاع.

المسنين:

لا يلاحظ وجود اختلاف في السلامة والفعالية عند الأشخاص الذين تزيد أعمارهم أو تقل عن ٦٥ عاماً.

الأطفال:

لم تتم حتى الآن دراسة تأثير هذا الدواء على من تقل أعمارهم عن ١٨ سنة.

الاستقلاب والإطراح:

الاستقلاب ٧٩٪ منه دون تبدل بالبول تقريباً. بينت الدراسات أن الإزيمات المسؤولة عن الاستقلاب هي (CYP3A4) مع مساهمة من (CYP2C8).

يبلغ عمره النصفى ١٢,٤ ساعة بعد جرعة فموية ١٠٠ ملغ، وتصفيته الكلوية حوالي ٣٥٠ مل/دقيقة. يطرح ١٣٪ منه بالبراز و٨٧٪ بالبول.

التأثيرات الجانبية:

التهاب الطرق التنفسية العلوية، التهاب البلعوم الأنفي، صداع، ألم معدى، إسهال.

مضادات الاستطباب:

فرط التحسس نحو المادة الفعالة أو إحدى سواغاتها، والحمض الكيتوني.

التحذيرات:

يجب ضبط الجرعة عند مرضى قصور الكلية المعتدل أو الشديد والمصابين بالداء الكلوي بمراحله الأخيرة الذين يحتاجون للديال الدموي أو الديال البريتواني.

التداخلات الدوائية:

يمتلك هذا الدواء تأثيراً قليلاً على تركيز ديجوكسين البلازما، فبعد إعطاء ٢٥٠ ملغ من الديجوكسين على نحو متزامن مع ١٠٠ ملغ غلبتين لمدة ١٠ أيام، فإن المساحة تحت المنحنى البلازمي للديجوكسين تزداد بمعدل ١١٪، ويزداد التركيز البلازمي الأعظمي بمعدل ١٨٪. ولا داعي لتعديل جرعة الديجوكسين أو الغلبتين.

الجرعة وطريقة الاستعمال:

– الجرعة الموصى بها ١٠٠ ملغ مرة واحدة يومياً مع الطعام أو بدونه، كعلاج أحادي أو مشاركة مع الميتفورمين أو زمرة التيازوليديين ديون وكعلاج مساعد للحمية والتمارين.

مرضى القصور الكلوي:

– الجرعة عند مرضى قصور الكلية الخفيف (تصفية الكرياتينين أكبر أو تساوي ٥٠ مل/دقيقة): لا يحتاج هؤلاء المرضى إلى ضبط جرعة الدواء.

– الجرعة عند مرضى قصور الكلية المعتدل (تصفية الكرياتينين أقل من ٥٠ مل/دقيقة – أكبر أو تساوي ٣٠ مل/دقيقة): يعطى هؤلاء المرضى ٥٠ ملغ مرة واحدة يومياً.

– الجرعة عند مرضى قصور الكلية الشديد (تصفية الكرياتينين أقل من ٣٠ مل/دقيقة) أو مرضى الداء الكلوي بالمرحلة النهائية الذين يحتاجون للتحال الدموي أو البريتواني: يعطى هؤلاء المرضى ٢٥ ملغ مرة واحدة يومياً دون الاهتمام بتوقيت التحال الدموي.

فرط الجرعة:

تعتبر ٨٠٠ ملغ كجرعة وحيدة من هذا الدواء جيدة التحمل. ولا تعد الزيادة الصغيرة بالك (QTc)، التي لوحظت بجرعة ٨٠٠ ملغ ذات أهمية سريرية.

الحفظ:

يحفظ في مكان جاف بدرجة حرارة أقل من ٢٥°م.

العبوة:

غلبتين ٢٥: عبوة كرتونية تحتوي ٢٠ مضغوظة ملبسة مغلقة ضمن بلستر.

غلبتين ٥٠: عبوة كرتونية تحتوي ٢٠ مضغوظة ملبسة مغلقة ضمن بلستر.

غلبتين ١٠٠: عبوة كرتونية تحتوي ١٠ مضغوظة ملبسة مغلقة ضمن بلستر.

غلبتين ١٠٠: عبوة كرتونية تحتوي ٢٠ مضغوظة ملبسة مغلقة ضمن بلستر.

PK0414/01

Issue: Aug. 1/10 V2

TPP1301467	إن هذا دواء
-	الدواء مستحضر يؤثر على صحتك، واستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر.
-	اتباع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المخصوص عليها، وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك.
-	إن الطبيب والصيدلاني هما الخبيران بالدواء وضعه وضرره.
-	لا تقطع مدة العلاج المحددة من تلقاء نفسك.
-	لا تكسر صرف الدواء بدون وصفة طبية.
-	احفظ الدواء بعيداً عن متناول الأطفال.
-	(تعليمات مجلس وزراء الصحة العرب واتحاد الصيدلة العرب)

التراميدیکا للصناعات الدوائية: سورية – دمشق – صيدنايا

هاتف: ٠٩٦٣ ١١ ٥٩٥٣٣٩ - فاكس: ٠٩٦٣ ١١ ٥٩٧٥١٧٤

بريد الكتروني: www.ultra-medica.net - ultramed@scs-net.org