

**Глюкагоноподобного  
пептида-1 в терапии  
сахарного диабета 2-го  
типа**



ГПП-1 очень быстро выводится из организма, благодаря почечному клиренсу и разрушению ферментом DPP-4, то был вначале разработан устойчивый к разрушению DPP-4 рецепторов ГПП-1 (ГПП-1Р), названный Экзенатидом. Он начал использоваться в США для лечения СД2 с агонист апреля 2005 года. Далее был разработан другой агонист ГПП-1Р, который отличается от нативного ГПП-1 только одной аминокислотой и который назвали Лираглутид.



**Лираглутид** – это аналог ГПП-1 человека, так как мало отличается от нативного ГПП-1, в противоположность Экзенатиду и потому последний называется миметиком ГПП-1. Но оба они – агонисты ГПП-1R, то есть реализуют эффект за счет соединения с рецепторами ГПП-1.





Агонисты ГПП-1Р глюкозозависимо усиливают секрецию инсулина, подавляют секрецию глюкагона и восстанавливают первую фазу секреции инсулина при СД2. Они замедляют опорожнение желудка, снижают аппетит, что ведет к постепенному, но заметному снижению веса, что особенно важно для больных СД2 с избыточной массой тела. ГПП-1Р представлены в кардиомиоцитах и эндотелиальных клетках и в доклинических исследованиях было показано, что стимуляция ГПП-1Р может оказывать кардиопротективное действие и уменьшать размер зоны инфаркта в эксперименте на животных. В ограниченных исследованиях было показано, что ГПП-1 может способствовать сохранению функции желудочка и улучшает сердечный выброс у лиц с сердечной недостаточностью или инфарктом миокарда. Агонисты ГПП-1Р снижают АД и улучшают липидный профиль плазмы у больных СД2



### **Торговое название**

Виктоза®

### **Международное непатентованное название**

Лираглутид

### **Лекарственная форма**

Раствор для подкожного введения 6 мг/мл

### **Состав**

1 мл раствора содержит

**активное вещество** - лираглутид 6 мг,

**вспомогательные вещества:** натрия гидрофосфата дигидрат, пропиленгликоль, фенол, кислота хлороводородная (2М раствор)/натрия гидроксид (2М раствор), вода для инъекций.

### **Описание**

Прозрачный бесцветный или почти бесцветный раствор, практически свободный от механических включений.



## ***Фармакотерапевтическая группа***

Средства для лечения сахарного диабета.

Сахароснижающие препараты для перорального приема.

Прочие сахароснижающие препараты. Лираглутид.

Код АТХ А10ВХ07

# Фармакокинетика



Всасывание лираглутида после подкожного введения происходит медленно, время достижения максимальной концентрации в плазме крови – 8-12 часов. Уровень максимальной концентрации лираглутида в плазме после подкожной инъекции в разовой дозе 0,6 мг составляет 9,4 нмоль/л. При введении лираглутида в дозе 1,8 мг средний показатель его равновесной концентрации в плазме ( $AUC_{ст}/24$ ) достигает приблизительно 34 нмоль/л. Действие лираглутида усиливается пропорционально введённой дозе. После введения лираглутида в разовой дозе внутривнутрипопуляционный коэффициент вариации площади под кривой «концентрация-время» ( $AUC$ ) составляет 11%. Уровень абсолютной биологической активности лираглутида после подкожного введения составляет приблизительно 55%.

# Фармакодинамика



Лираглутид представляет собой аналог человеческого глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1), произведенный методом биотехнологии рекомбинантной ДНК с использованием штамма *Saccharomyces cerevisiae*, имеющий 97% гомологичности с человеческим ГПП-1, который связывается и активирует рецепторы ГПП-1 у человека. Рецептор ГПП-1 служит мишенью для нативного ГПП-1 – эндогенного гормона инкретина, вызывающего стимуляцию глюкозозависимой секреции инсулина в бета-клетках поджелудочной железы. В отличие от нативного ГПП-1, фармакокинетический и фармакодинамический профили лираглутида позволяют вводить его пациентам ежедневно один раз в сутки.



# Показания к применению



- при сахарном диабете 2 типа для достижения гликемического контроля.

Препарат Виктоза® показан для применения один раз в день в качестве:

- комбинированной терапии с сахароснижающими препаратами (с одним препаратом (метформином или производными сульфонилмочевины) или с двумя препаратами (метформином и производными сульфонилмочевины или метформином и тиазолидиндионами)) и/или базальным инсулином, когда указанные препараты, в сочетании с диетой и физическими упражнениями не достигают адекватного гликемического контроля на предшествующей терапии.

# Способ применения и дозы



Начальная доза препарата Виктоза® составляет 0,6 мг в день. После применения препарата в течение минимум одной недели дозу следует увеличить до 1,2 мг. Есть данные о том, что у некоторых пациентов польза от лечения возрастает при увеличении дозы препарата с 1,2 мг до 1,8 мг. С целью достижения наилучшего гликемического контроля у больного и с учётом клинической эффективности дозу препарата Виктоза® можно увеличить до 1,8 мг после применения его в дозе 1,2 мг в течение минимум одной недели. Применение препарата в ежедневной дозе выше 1,8 мг не рекомендуется.

# Противопоказания



- повышенная чувствительность к активному веществу или другим компонентам, входящим в состав препарата
- использование у пациентов с сахарным диабетом 1 типа
- для лечения диабетического кетоацидоза
- тяжелая почечная и печеночная недостаточность
- детский и подростковый возраст до 18 лет
- беременность и кормление грудью

# Дизопирамид



Возможная комбинация дизопирамида с БАБ или АК влечении симптомов (одышка или стенокардия) в случае неэффективности монотерапии БАБ или АК.

Монотерапия дизопирамидом ГКМП с ФП, без сочетания с БАБ или верапамилом, опасна, вследствие способности дизопирамида ускорять AV-проводимость, тем самым увеличивая ЧСС (класс III, уровень доказательности B).

Препарат	Период полувыведения из сыворотки, ч.	Орган элиминации	Стандартные дозы при стенокардии	Максимально разрешенные дозы
Дизопирамид капсулы	4-10		Нагрузочная доза 300 мг, однократно. Поддерживающая доза 100-200 мг. Каждые 6 часов.	
Дизопирамид таблетки пролонгированного высвобождения	6,9-16,4		300 мг каждые 12 часов.	