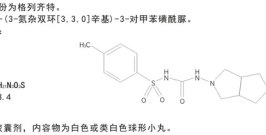
核准日期：2009年03月16日
修改日期：2009年06月26日 2011年11月08日 2012年09月19日
2014年11月26日 2015年06月17日 2020年09月29日

格列齐特缓释胶囊说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】通用名称：格列齐特缓释胶囊
英文名称：Gliclazide Sustained-release Capsules
汉语拼音：Gelieqite Huanshi Jiaonang
【成　分】
本品主要成份为格列齐特，
化学名称：1-(3-氮杂双环[3.3.0]辛基)-3-对甲苯磺酰脲。
化学结构式：



分子式：$C_{15}H_{21}N_3O_3S$
分子量：323.4
【性　　状】
本品为胶囊剂，内容物为白色或类白色球形小丸。
【适 应 症】
当单用饮食疗法、运动治疗和减轻体重不足以控制血糖水平的成人2型糖尿病。
【规　　格】
30mg
【用法用量】
口服，仅用于成年人。每日1次，剂量为30～120mg(1至4粒)，建议于早餐时服用。
如某日忘记服用药物，第二日服药剂量不得增加。与所有降血糖药一样，应根据患者的代谢反应(血糖，HbAlc)来调整剂量。
※首次剂量 首次建议剂量为每日30mg。
一如血糖水平令人满意，可采用此剂量用作维持治疗；
一如血糖水平不佳，剂量可逐次增至每日60、90或120mg。每次增量间隔至少1个月，治疗2周后血糖仍无下降时除外。遇到这种情况，可提议于治疗二周后增加剂量。最大建议剂量必须不得超过每日120mg。
据国外文献报道：
※ 用格列齐特缓释胶囊代替格列齐特80mg：格列齐特80mg一片相当于格列齐特缓释胶囊一粒，替代时，必须提供血糖检测。
※ 用格列齐特缓释胶囊代替其他口服降血糖药物：格列齐特缓释胶囊可代替其他口服治疗糖尿病药物治疗。在这种情况下，必须考虑先前所用降血糖药物的剂量和半衰期。
一一般用格列齐特缓释胶囊时无须过渡期，开始以剂量为30mg为较好。然后如前述按照患者的血糖情况进行调整。如患者从具有长半衰期的磺脲类药物改用格列齐特缓释胶囊，为了避免两种药物的药效叠加以及随后发生的低血糖危险，几天的治疗窗口期可能证明是必须的。
在换用本药物时，建议遵照前述首次服用格列齐特缓释胶囊治疗所采用的步骤，即首次治疗剂量每日30mg，然后根据代谢情况逐次增量。
※ 与其他口服治疗糖尿病药联合应用：格列齐特缓释胶囊可与双胍类、α 葡萄糖苷酶抑制剂或胰岛素合用。
格列齐特缓释胶囊不能充分控制的患者，在严密的医疗监测下，治疗初期合并胰岛素治疗。
※ 对轻度或中度肾功能不全患者：治疗方案与肾功能正常的患者相同，但需小心监测。
这些资料已被临床实验所证实。
※ 对低血糖症的高危患者：

一肾与肝功能不全：肝功能不全或严重肾功能不全患者，格列齐特的药代动力学和/或药效学可能发生改变。这些患者低血糖可能持续时间长，应进行适当的处理。
一需向患者说明的资料：应向患者和其家属解释清楚低血糖的危险性，包括症状、治疗以及引起低血糖的原因。并告诉患者遵守饮食治疗，按时运动及监测血糖水平的重要性。
一一血糖不平衡：患者有下列任何情况，口服治疗糖尿病药物，可使血糖浓度受到影响：发热、外伤、感染或手术、某些情况可能需要应用胰岛素。所有口服降糖药，包括格列齐特，长期应用时，药效对许多病人都会减弱。这可能由于糖尿病的严重程度进展，或者是由于对治疗的反应降低，这些现象称为继发性失效，应与原发性失效区分，后者指该药物指定为对某一患者作为非常前期治疗而证明是无效者。在将患者定为继发性失效前必须考虑可调整剂量以及监督其饮食治疗和运动。
一实验室检查：糖基化血红蛋白水平(或空腹血糖水平)是评估降糖疗效较好的指标。自我监测血糖是非常有效的。
一对驾驶及操作机器的影响：在驾驶和/或操作机器时患者应警惕低血糖症状，特别是在开始治疗时。
【孕妇及哺乳期妇女用药】
妊娠 缺乏怀孕妇女使用格列齐特的临床资料，其它磺脲类药物的资料很少。在动物中，格列齐特非致畸。为了减少在未控制糖尿病中先天性畸形的危险，在怀孕前必须控制糖尿病。
妊娠期间口服降糖药不适用，因此采用胰岛素作为糖尿病的继续治疗。建议从计划要怀孕的时候或发现怀孕的时候，将口服降糖药物改为用胰岛素治疗。
哺乳 缺乏格列齐特及其代谢物进入母乳的资料。考虑到新生儿低血糖危险性，哺乳期妇女禁止使用格列齐特。
【儿童用药】
缺乏在儿童中的临床研究或数据。
【老年患者用药】
对65岁以上患者，格列齐特缓释胶囊的服用方法按65岁以下患者相同治疗方案，或遵医嘱。
【药物相互作用】
1）以下药品可能会增加低血糖的危险
禁止联合应用：
一双氢苯咪唑(全身途径，口服凝胶)：增加降糖作用并可能会出现低血糖症状，甚至昏迷。
不推荐联合应用：
一保泰松(全身途径)：增加磺脲类药物的降糖效应(取代它们与血浆蛋白的结合和/或减少它们的排出)。
最好使用一种不同的消炎药剂，否则，需警告患者并强调自我监测的重要性：在与消炎药剂一同使用时，有必要在消炎药治疗期间和治疗后调整药物剂量。
一酒精：增加低血糖反应(通过抑制代偿性反应)，同时具有低血糖昏迷发作的潜在的危险，避免酒精或含有酒精的药物。
联合应用需谨慎：
降血糖效应可能增强，低血糖可能发生在与以下药物合用时的一些情况下：其它降血糖药物(胰岛素，阿卡波糖，双胍类)，β-受体阻滞剂，氟康唑，血管紧张素转换酶抑制剂(卡托普利、依那普利)，H2-受体拮抗剂，MAOIs，磺胺类，非甾体抗炎药。
2)以下药品可能引起血糖水平提高
建议不要联合应用
一达那唑：致糖尿病效应。如果无法避免使用该种药物，需要警告患者并强调自我监测尿糖和血糖的重要性。在使用和停止达那唑治疗时需要调整糖尿病治疗药物剂量。
联合应用需谨慎
一氯丙嗪(抗精神病药)：使用大剂量氯丙嗪治疗(每日氯丙嗪100mg)会增加血糖水平(降低胰岛素的释放)。需要告知患者并强调自我监测血糖的重要性。在使用抗精神病药治疗时和停药后需调整糖尿病治疗药物剂量。
一糖皮质激素(全身途径和局部途径：关节内静、皮肤和直肠制剂)和替可克肽(促皮质类激素)：由可能的酮症而使血糖水平升高(由肾上腺皮质激素引起的对碳水化合物耐受性降低)。需要告知患者并强调自我监测血糖的重要性。在使用肾上腺皮质激素治疗时和停药后需要调整糖尿病治疗药物剂量。
一拉平轻麻黄碱，舒喘宁，三丁喘宁：(静注)由于 β-2激动剂作用，提高血糖水平。需要强调自我监测血糖的重要性。必要时改用胰岛素。
3)合并用药应考虑的其它问题

一营养不足或营养不良状态；
一严重或代偿较差的内分泌疾病(垂体前叶功能不足，甲状腺机能减退，肾上腺功能不足)；
一长期和 / 或大剂量皮质激素治疗撤停；
一严重血管性疾病(严重冠心病，颈动脉严重受损，弥漫性血管病变)，建议以30mg/天的最小剂量开始治疗，或遵医嘱。
【不良反应】
低血糖：如同其它磺脲类药物，尤其在进餐间隔时间不规则，或少吃了一餐或数餐的情况下，用格列齐特缓释胶囊治疗可能导致低血糖发生。
低血糖可有如下症状：头痛，极度饥饿，恶心，呕吐，倦怠，嗜睡，睡眠障碍，激动，攻击性行为，集中力和注意力下降，反应迟缓，抑郁，精神错乱，视觉及语言障碍，失语，震颤，轻瘫，感觉障碍，头晕，乏力感，自我控制丧失，谵妄，惊厥，呼吸表浅，心动徐缓，意识丧失甚至昏迷至死亡。
另外，观察到肾上腺素能反馈调节症状：出汗，皮肤潮湿，焦虑，心动过速，高血压，心悸、心绞痛及心律失常。
这些症状通常在摄入碳水化合物(糖)后消失。然而，人造糖类替代品无效。
对于长期严重低血糖病例，即使因吸收了糖而暂时得到控制，仍然可能需要立即药物治疗，甚至需要住院治疗。
胃肠道功能障碍：例如腹痛，恶心，呕吐，消化不良，腹泻，便秘都有过较少报导，但如在早餐时服用格列齐特，这些症状可以避免或使风险降到最低。
罕见的不良反应：
一皮肤和皮下反应：皮疹，瘙痒，荨麻疹，红斑，斑丘疹，起泡。其它磺脲类药物，极少数病例有过敏性结节性脉管炎。
一血液疾病：极罕见，包括贫血，白细胞减少，血小板减少，粒细胞减少等。这些异常通常是可逆的，治疗停止时消失。其它磺脲类药物，少数病例可见红细胞减少，粒细胞缺乏，贫血及各类血细胞减少等。
一肝-胆障碍：肝酶水平增高(ALT，AST，碱性磷酸酶)，肝炎(罕见)。如有胆汁淤积性黄疸出现，中止治疗。其他磺脲类药物，少数病例罕见肝酶水平增高。肝功能不全(胆汁淤积和黄疸)，甚至出现肝炎中断治疗后，症状消退。仅有少数病例出现危及生命的肝功能衰竭。通常这些症状于中断治疗后一般都会消失。
一视力障碍：暂时性视力障碍，可能因为开始治疗时的血糖水平变化。
【禁　　忌】
一已知对格列齐特或其中某一种赋形剂，其它磺脲类、磺胺类药物过敏；
一Ⅰ型糖尿病；
一糖尿病昏迷前期、糖尿病酮症酸中毒；
一严重肾或肝功能不全：对这些病例建议应用胰岛素；
一应用咪康唑治疗者(参见【药物相互作用】)；
一哺乳期(参见【孕妇及哺乳期妇女用药】)。
【注意事项】
低血糖：此药物治疗时应建议用于有可能定时进餐(包括早餐)的患者，因为延迟进餐，食物不足或低碳水化合物，可使低血糖危险增加，所以定时摄食碳水化合物很重要。低血糖更可能发生于食用低热量食物，相当大量或长时间运动后，饮酒后或合并应用其他降糖药物之患者。
低血糖可发生于应用顺服类药物后(参见【不良反应】)。有些病例可以很严重且持续很长时间。可能需要住院，并且葡萄糖溶注持续数天。
为了减少低血糖发作的危险，必须小心选择病人及所用的剂量以及对患者解释清楚低血糖的情况。
下列因素将促进低血糖的发生：
一患者拒绝合作或无能力合作(特别是老年人)；
一营养不良，不按时进餐，忘记进餐，禁食或改变食物；
一运动和摄取碳水化合物二者间不平衡；
一肾功能不全；
一严重肝功能不全；
一格列齐特缓释胶囊服用过量；
一某些内分泌疾病：甲状腺功能低减；垂体和肾上腺功能不全；
一与某些其他的药物合并应用(参见【药物相互作用】)。

一抗凝剂(华法令)一般应用中，磺脲类可能导致潜在的抗凝性。可能必须考虑调整抗凝剂的剂量。
【药物过量】
磺脲类药物过量可产生低血糖。
中度低血糖症状，无意识丧失或神经系统体征者，必须以摄取碳水化合物，调整剂量和/或改变饮食来完全纠正之。医师应继续严密监护直至患者已脱离危险。
严重的低血糖反应出现昏迷，惊厥，或可能出现其他的神经功能障碍，应作为内科急诊处理，患者需立即住院治疗。
如诊断或怀疑低血糖昏迷，应给患者快速静脉注射50ml高浓度(20-30%)葡萄糖溶液，随后持续滴注浓度相对较低的葡萄糖溶液(10%)，注入速度以维持血糖浓度在1g/L以上为准。
医师应密切监护患者，根据患者情况决定是否需要加强监护。
由于格列齐特与蛋白质结合率图，透析对这些患者无用。
【药理毒理】
药理作用　格列齐特是一种磺脲类口服治疗糖尿病药物，结构中含有氮杂环，因而具有不同于其它磺脲类药物的特点。
格列齐特通过刺激胰岛β细胞分泌颗粒而来降低血糖水平，显著增加餐后胰岛素和C-肽分泌水平，疗效持续至治疗二年以上。
除了这些代谢性质外，格列齐特还有一些独特的血液生化性质。
(1) 对胰岛素释放的作用：对2型糖尿病，格列齐特可以恢复对葡萄糖作出反应的第一相胰岛素分泌高峰并增加第二相胰岛素分泌。可以观察到进餐后诱导或葡萄糖刺激的胰岛素分泌反应明显增加。
(2) 血液生化性质：格列齐特直接抑制以下两个导致糖尿病血管并发症发生的途径，明显减少微血栓的形成：
一部分抑制血小板凝聚和粘连，并减少血小板活性标记物(β-血栓球蛋白，血栓烷B2)。
一通过增加t-PA活性，对血管内皮产生纤溶活性发挥作用。
毒理研究
重复剂量的毒理实验及遗传毒性实验，未发现提示可能对人体有害的异常。无长期致癌试验。动物中未见畸形发生：仅有在用药剂量达到人类最大推荐治疗剂量的25倍时，观察到动物胚胎重量减轻。
【药代动力学】
据文献报道：
药代动力学性质
一口服后，药物血浆浓度在最初的6个小时内逐行性升高，在6小时至12小时之间达到稳定状态。
一个体间可能由于遗传因素存在一些差异，但个体内差异很小。
一格列齐特吸收完全。摄食并不影响其吸收的速度和程度。
一用药剂量与浓度曲线下面覆盖的面积之间呈线性关系，持续到剂量高达120mg。
一血浆蛋白结合约为95%。
一格列齐特主要在肝内代谢，且大部分从尿中排泄：尿内所含未起变化的成分不到1%。
一血浆内检测不到有效的代谢产物。
一格列齐特的清除半衰期大约在12小时至20小时之间。
一分布容积大约为30升。
一老年患者的药代动力学参数没有明显变化。
一每天一次格列齐特缓释胶囊，能够维持格列齐特有效血浆浓度24小时。
【贮　　藏】遮光，密封，不超过25℃保存。
【包　　装】药品包装用铝箔/聚氯乙烯固体药用硬片包装，
(1)10粒/板，2板/盒；(2)10粒/板，3板/盒；(3)12粒/板，1板/盒；(4)12粒/板，2板/盒；
(5)12粒/板，3板/盒；(6)12粒/板，4板/盒。
【有 效 期】24个月
【执行标准】YBH02852009
【批准文号】国药准字H20090125
【药品上市许可持有人】桂林华信制药有限公司
【注册地址】广西桂林灵川县灵川镇灵北路一街89号
【生产企业】桂林华信制药有限公司
【生产地址】广西桂林灵川县灵川镇灵北路一街89号
【邮政编码】541299
【电　　话】0773-6818778　【传　　真】0773-6817722

如有问题可与生产企业直接联系