GLOKITA Film Coated Tablets

REVA PHARMA

Composition:
Each GLOKITA Film Coated Tablets contains Sitagliptin Phosphate Monohydrate equivalent to Sitagliptin 50-100 mg.

Pharmacological Classification:
Dipeptidyl peptidase 4 (DPP-4) inhibitors - oral hypoglycemic agents.

Intended Use (Common Use of the Drug):
Reducing blood glucose levels for adult patients with type 2 diabetes.

Mechanism of action:
GLOKITA is an orally-active, potent, and highly selective inhibitor of the dipeptidyl peptidase 4 (DPP-4) enzyme. It increases the levels of glucagon-like peptide-1 (GLP-1) and glucose-dependent insulinotropic polypeptide (GIP), which increase Insulin synthesis and release. GLP-1 also lowers glucagon secretion, reducing hepatic glucose production.

Pharmacokinetics:
Absorption Following oral administration GLOKITA was rapidly absorbed, with peak plasma concentrations occurring 1 to 4 hours post-dose The absolute bioavailability of Sitagliptin is approximately 87 %.
Distribution: The mean volume of distribution is approximately 198 liters. The fraction of GLOKITA reversibly bound to plasma proteins is low (38 %).
Biotransformation: GLOKITA is primarily eliminated unchanged in urine, and metabolism is a minor pathway.
Excretion: The renal clearance of GLOKITA was approximately 350 mL/min. Elimination of GLOKITA occurs primarily via renal excretion and involves active tubular secretion.

Indications:
Use GLOKITA exactly as described in this leaflet or as directed by your doctor or pharmacist.
For adult patients with type 2 diabetes mellitus, GLOKITA is indicated in the following cases:
as monotherapy:
- in patients inadequately controlled by diet and exercise alone and for whom metformin is inappropriate due to contraindications or intolerance.
as dual oral therapy in combination with:
- metformin when diet and exercise plus metformin alone do not provide adequate glycaemic control.
- a sulphonylurea when diet and exercise plus maximal tolerated dose of a sulphonylurea alone do not provide adequate glycaemic control and when metformin is inappropriate due to contraindications or intolerance.
- a peroxisome proliferator-activated receptor gamma))Thiazolidinediones((PPARγ) (agonist (i.e. a plus the PPARγ agonist alone do not provide adequate glycaemic control.
as triple oral therapy in combination with:
- a sulphonylurea and metformin when diet and exercise plus dual therapy with these medicinal products do not provide adequate glycaemic control.
- a PPARγ agonist and metformin when use of a PPARγ agonist is appropriate and when diet and exercise plus dual therapy with these medicinal products do not provide adequate glycaemic control.
- GLOKITA is also indicated as add-on to insulin (with or without metformin) when diet and exercise plus stable dose of insulin do not provide adequate glycaemic control.

Contraindications:
GLOKITA should not be used in case of hypersensitivity to the active ingredient (sitagliptin) or to any of the excipients used.

Side Effects:
Like all medicines, this one can cause side effects, although not everyone experiences them.
Common side effects include upper respiratory tract infection, nasopharyngitis, headache, stomach discomfort and diarrhea.
Inform your doctor or pharmacist if you experience any side effects not listed in this leaflet.

Warnings & Precautions:
GLOKITA should not be used in type 1 diabetes or for the treatment of diabetic ketoacidosis.
Acute pancreatitis
Use of DPP-4 inhibitors has been associated with a risk of developing acute pancreatitis. Patients should be informed of the characteristic symptom of acute pancreatitis: persistent, severe abdominal pain. If pancreatitis is suspected, GLOKITA should be discontinued. Caution should be exercised in patients with a history of pancreatitis.
Hypoglycaemia
a reduction in the dose of the sulphonylurea or insulin may be necessary.
Hypersensitivity reactions
These reactions include anaphylaxis, angioedema, and exfoliative skin conditions including Stevens-Johnson syndrome. If a hypersensitivity reaction is suspected, GLOKITA should be discontinued.

Drug and Food Interactions:
Tell your doctor or pharmacist if you are using, have recently used or might use any other drugs, and for how long you will be using the drug.
Potent CYP3A4 inhibitors (i.e., Ketoconazole, Itraconazole, Ritonavir, Clarithromycin) could alter the pharmacokinetics of GLOKITA in patients with severe renal impairment or ESRD.
Digoxin: patients at risk of Digoxin toxicity should be monitored for this when GLOKITA and Digoxin are administered concomitantly.
Metformin: Co-administration of multiple twice-daily doses of 1,000 mg metformin with 50 mg GLOKITA did not meaningfully alter the pharmacokinetics of GLOKITA in patients with type 2 diabetes.

Pregnancy & Lactation & Fertility:
Pregnancy: There are no adequate data from the use of GLOKITA in pregnant women. Studies in animals have shown reproductive toxicity at high doses. The potential risk for humans is unknown. Due to lack of human data, GLOKITA should not be used during pregnancy.
Lactation: It is unknown whether GLOKITA is excreted in human breast milk. Animal studies have shown excretion of GLOKITA in breast milk. GLOKITA should not be used during breast-feeding.
Fertility: Animal data do not suggest an effect of treatment with GLOKITA on male and female fertility.
Human data are lacking.

Effects on ability to drive and use machines:
Dizziness and vertigo should be considered when taking GLOKITA. Patients should be warned of the risk of hypoglycemia when the drug is used in combination with sulfonylureas or insulin.

Dosage and method of use:
- Use GLOKITA exactly as your doctor or pharmacist has prescribed it. Ask your doctor if you are not sure.
- The dose is 100 mg GLOKITA once daily. When used with metformin and/or a PPARγ agonist, the dose of metformin and/or a PPARγ agonist should be maintained, and GLOKITA given concomitantly.
- When GLOKITA is used with sulfonylureas or with insulin, a lower dose of sulfonylurea or insulin may be considered to reduce the risk of hypoglycemia.
- In case of a missed dose, it should be taken as soon as remembered. A double dose should not be taken on the same day.

Special categories of patients:
- Renal impairment: No dose adjustment is required in patients with mild or moderate renal impairment (GFR ≥ 45-60 ml\min). Patients with moderate renal impairment (GFR ≥ 30-45 ml\min), the dose of GLOKITA is 50 mg once daily. Patients with severe renal impairment, and patients on hemodialysis, the dose of GLOKITA is 25 mg once daily. The treatment can be given regardless of the timing of hemodialysis.
- Hepatic impairment: No dosage adjustment is necessary for patients with mild to moderate hepatic impairment and caution should be exercised in severe hepatic impairment. Since GLOKITA is excreted renally, hepatic effects are not expected.
- Elderly: No dosage adjustment is necessary based on age.
- Children: Sitagliptin should not be used in children and adolescents aged 10 to 17 years due to its ineffectiveness.
- GLOKITA can be taken with or without food.
- Inform your doctor or pharmacist if you forget take medicine and before stopping its use.

Overdoses\Toxicity\methods of treatment:
During controlled clinical trials in healthy subjects, single doses of up to 800 mg GLOKITA were administered. Minimal increases in QTc, not considered to be clinically relevant, were observed in one study at a dose of 800 mg GLOKITA.
In the event of an overdose, it is reasonable to employ the usual supportive measures, e.g., remove unabsorbed material from the gastrointestinal tract, employ clinical monitoring (including obtaining an electrocardiogram), and institute supportive therapy if required.

Physical Properties:
GLOKITA 50: Yellow, Round, Biconvex, Scored Film Coated Tablets.
GLOKITA 100: Yellow, Round, Biconvex Film Coated Tablets.

Storage Conditions:
Store at a temperature below 25° C.
Keep out of reach of children.

Packaging:
Each GLOKITA 50- 100 carton box contains 20 film-coated tablets in 2 blister strips.

-A medicament is a product which affects your health, and it's consumption contrary to instructions is dangerous for you.
- Follow strikly the doctors prescription, the method of use and the instructions of the pharmacist who sold the medicament.
-The doctor and the pharmacist experts in medicine, it's benefits and risks.
-Do not repeat the same prescription without consulting your doctor.
KEEP THE MEDICAMENTS OUT OF REACH OF CHILDREN
Council of Arab Health Ministers& Union of Arab Pharmacists

p01622 / R02

Reva Pharmaceutical Industry - Syria

غلوكيتا

مضغوطات ملبسة بالفلم

ريفا فارما

التركيب:
كل مضغوطة غلوكيتا ملبسة بالفيلم تحتوي على سيتاغلبتين فوسفات مونوهيدرات ما يعادل سيتاغلبتين ٥٠-١٠٠ ملغ.
الزمرة الدوائية:
مثبطات ديبيبتيديل ببتيداز ٤ (DPP-4) - خافضات سكر فموية.
غرض الاستخدام (الاستخدام الشائع للدواء):
خفض مستويات غلوكوز الدم للمرضى البالغين المصابين بداء السكري من النوع ٢.
آلية التأثير:
غلوكيتا مثبط فعال فموياً، قوي، عالي الانتقائية لأنزيم دي ببتيديل ببتيداز ٤ (DPP-4). يرفع مستويات الببتيد -١ الشبيه بالغلوكاغون (GLP-1) وعديد الببتيد الموجه للأنسولين المعتمد على الغلوكوز (GIP)، مما يزيد من اصطناع وتحرر الأنسولين. يخفض (GLP-1) أيضاً من إفراز الغلوكاغون، مما ينقص الإنتاج الكبدي للغلوكوز.
الحرائك الدوائية:
الامتصاص: بعد تناول غلوكيتا فموياً يمتص بسرعة ويصل لتراكيزه البلازمية الأعظمية بعد ١ -٤ ساعات من أخذ الجرعة، توافره الحيوي المطلق حوالي (٨٧ ٪).
التوزع: يبلغ حجم التوزع الوسطي حوالي ١٩٨ ليتر. يرتبط قسم ضئيل (٣٨ ٪) من غلوكيتا بشكل عكوس ببروتينات البلازما.
التحول الحيوي: يطرح غلوكيتا بشكل أساسي بشكل غير متغير في البول، وبعد الاستقلاب طريقاً ثانوياً.
الإطراح: تبلغ التصفية الكلوية لغلوكيتا حوالي ٣٥٠ مل/دقيقة. يحدث إطراح غلوكيتا بشكل رئيسي عبر الإطراح الكلوي ويتضمن الإفراز النبيبي.
الاستطبابات:
استخدم غلوكيتا تماماً كما تصف هذه النشرة، أو كما يخبرك الطبيب أو الصيدلاني، استشر طبيبك في حال كنت غير متأكد.
يستطب للمرضى البالغين المصابين بداء السكري من النوع ٢، يعطى غلوكيتا في الحالات التالية:
كعلاج وحيد:
- في المرضى غير المضبوطين بشكل كافٍ بالحمية وممارسة الرياضة والذين يعتبر الميتفورمين غير مناسب لهم بسبب وجود مضاد استطباب أو عدم تحمله.
كعلاج فموي ثنائي بالاشتراك مع:
- الميتفورمين عندما لا توفر الحمية وممارسة الرياضة بالإضافة إلى الميتفورمين وحدها السيطرة الكافية على نسبة السكر في الدم.
- السلفونيل يوريا عندما لا توفر الحمية وممارسة الرياضة بالإضافة إلى الجرعة القصوى المسموح بها من السلفونيل يوريا وحدها تحكماً كافياً في نسبة السكر في الدم وعندما يكون الميتفورمين غير مناسب بسبب وجود مضاد استطباب أو عدم تحمله.
- ناهض مستقبلات ((ثيازوليدين ديون) (PPARγ)) عندما لا يؤمن ناهض PPARγ وحده التحكم الكافي في نسبة السكر في الدم.
كعلاج ثلاثي عن طريق الفم بالاشتراك مع:
- السلفونيل يوريا والميتفورمين عندما لا توفر الحمية وممارسة الرياضة بالإضافة إلى العلاج المزدوج بهذه الأدوية التحكم الكافي في نسبة السكر في الدم.
- ناهض PPARγ والميتفورمين عندما يكون استخدام ناهض PPARγ مناسباً وعندما لا توفر الحمية وممارسة الرياضة بالإضافة إلى العلاج المزدوج بهذه المنتجات الطبية التحكم الكافي في نسبة السكر في الدم.
- يستطب أيضاً غلوكيتا كإضافة للأنسولين (مع أو بدون الميتفورمين) عندما لا يوفر النظام الغذائي وممارسة الرياضة بالإضافة إلى جرعة ثابتة من الأنسولين التحكم الكافي في نسبة السكر في الدم.

مضادات الاستطبابات:
يمنع استخدام غلوكيتا في حال فرط الحساسية للمادة الفعالة (سيتاغلبتين) أو لأي من السواغات المستخدمة.
التأثيرات الجانبية:
مثل جميع الأدوية، يمكن أن يسبب هذا الدواء أعراض جانبية على الرغم من عدم حدوثها لدى الجميع.
التأثيرات الجانبية الشائعة تشمل إنتانات الجهاز التنفسي العلوي، والتهاب البلعوم الأنفي، والصداع، وآلام في المعدة، والإسهال.
أخبر الطبيب أو الصيدلاني في حال ظهرت لديك أية تأثيرات جانبية غير مذكورة في هذه النشرة.
التحذيرات والاحتياطات:
يجب عدم استعمال غلوكيتا في السكري من النمط الأول أو لعلاج الحماض الكيتوني السكري.
التهاب البنكرياس الحاد
قد يترافق استعمال مثبطات (DPP-4) مع خطر الإصابة بالتهاب البنكرياس الحاد. يجب إخبار المرضى بالعرض المميز لالتهاب البنكرياس الحاد: ألم بطني شديد ومستمر. بحال الشك بحدوث التهاب البنكرياس الحاد، يجب إيقاف غلوكيتا. يجب توخي الحذر عند المرضى الذين لديهم سوابق لحدوث التهاب بالبنكرياس.
انخفاض سكر الدم
قد يكون من الضروري تخفيض جرعة السلفونيل يوريا أو الأنسولين.
تفاعلات فرط الحساسية
تشمل هذه التفاعلات تأق، وذمة وعائية، وآفات جلدية تقشرية بما فيها متلازمة ستيفن جونسون. بحال الشك بحدوث تفاعل فرط حساسية يجب إيقاف غلوكيتا.
التداخلات الدوائية والغذائية:
أخبر الطبيب أو الصيدلاني في حال كنت تستخدم أو استخدمت مؤخراً أو قد تستخدم أدوية أخرى، والمدة العلاجية لاستخدامك للدواء.
من الممكن أن تغير مثبطات السيتوكروم (CYP3A4) القوية (كالكيتوكونازول، إيتراكونازول، ريتونافير، كلاريثروميسين) من الحرائك الدوائية لـ غلوكيتا عند مرضى الاعتلال الكلوي الشديد أو الفشل الكلوي في مراحله النهائية.
الديجوكسين: يجب مراقبة سمية الديجوكسين عند المرضى الذين لديهم خطورة لحدوثها عند تناول غلوكيتا والديجوكسين معاً.
الميتفورمين: إن تناول جرعات متعددة مرتين يومياً من ١٠٠٠ ملغ من الميتفورمين مع ٥٠ ملغ من غلوكيتا لم يغير بشكل كبير الحرائك الدوائية لغلوكيتا في المرضى الذين يعانون من مرض السكري من النوع ٢.
الحمل والإرضاع والخصوبة:
الحمل: لا توجد بيانات كافية عن استخدام غلوكيتا في النساء الحوامل. أظهرت الدراسات التي أجريت على الحيوانات حدوث سمية إنجابية عند تناول جرعات عالية. المخاطر المحتملة للبشر غير معروفة. بسبب نقص البيانات البشرية، لا ينبغي استخدام غلوكيتا أثناء الحمل.
الإرضاع: من غير المعروف ما إذا كان غلوكيتا يفرز في حليب الأم. أظهرت الدراسات التي أجريت على الحيوانات إفراز غلوكيتا في حليب الثدي. لا ينبغي استخدام غلوكيتا أثناء الرضاعة الطبيعية.
الخصوبة: لا تشير البيانات الحيوانية إلى تأثير العلاج بغلوكيتا على خصوبة الذكور والإناث. ولا توجد بيانات بشرية.
التأثيرات على القدرة على القيادة واستعمال الآلات:
يجب الأخذ بعين الاعتبار حدوث الدوخة والدوار عند تناول غلوكيتا. يجب تنبيه المرضى إلى خطورة حدوث انخفاض سكر الدم عند استعمال الدواء بالمشاركة مع سلفونيل يوريا أو مع الأنسولين.

الجرعة وطريقة الاستعمال:
- استخدم غلوكيتا تماماً كما وصفه لك الطبيب أو الصيدلاني، استشر طبيبك في حال كنت غير متأكد.
- الجرعة هي ١٠٠ ملغ غلوكيتا مرة واحدة يومياً. عند استخدامه مع الميتفورمين و/أو منبه PPARγ، يجب الحفاظ على جرعة الميتفورمين و/أو منبه PPARγ، وإعطاء غلوكيتا بشكل متزامن.
- عند استخدام غلوكيتا مع السلفونيل يوريا أو مع الأنسولين، يمكن التفكير في جرعة أقل من السلفونيل يوريا أو الأنسولين لتقليل خطر هبوط سكر الدم.
- في حالة نسيان الجرعة يجب تناولها بمجرد تذكرها. لا ينبغي أن تؤخذ جرعة مضاعفة في نفس اليوم.
فئات خاصة من المرضى:
- القصور الكلوي: لا يلزم تعديل الجرعة لدى مرضى القصور الكلوي الخفيف أو المعتدل (GFR ≥ 45-60 ml\min). المرضى الذين يعانون من قصور كلوي معتدل (GFR ≥ 30-45 ml\min)، جرعة غلوكيتا هي ٥٠ ملغ مرة واحدة يومياً. المرضى الذين يعانون من قصور كلوي شديد، ومرضى غسيل الكلى، جرعة غلوكيتا ٢٥ ملغ مرة واحدة يومياً. يمكن إعطاء العلاج بغض النظر عن توقيت غسيل الكلى.
- القصور الكبدي: ليس من الضروري تعديل الجرعة للمرضى الذين يعانون من قصور كبدي خفيف إلى متوسط وينبغي الحذر في حال القصور الكبدي الشديد، وبما أن غلوكيتا يطرح كلوياً فمن غير المتوقع حدوث تأثيرات كبدية.
- المسنين: ليس هناك حاجة لتعديل الجرعة على أساس العمر.
- الأطفال: لا ينبغي استخدام سيتاغلبتين لدى الأطفال والمراهقين الذين تتراوح أعمارهم بين ١٠ إلى ١٧ عاماً بسبب عدم فعاليته.
- يمكن تناول غلوكيتا مع أو بدون الطعام.
- يجب إبلاغ الطبيب أو الصيدلاني في حال نسيان تناول الدواء وقبل التوقف عن استخدامه.
فرط الجرعة/السمية/طرق العلاج:
خلال التجارب السريرية الخاضعة للرقابة في الأشخاص الأصحاء، تم إعطاء جرعات مفردة تصل إلى ٨٠٠ ملغ من غلوكيتا. وقد لوحظت زيادات طفيفة في QTc، والتي لا تعتبر ذات صلة سريرياً، في إحدى الدراسات عند جرعة ٨٠٠ ملغ من غلوكيتا.
في حالة تناول جرعة زائدة، فمن المعقول استخدام التدابير الداعمة المعتادة، على سبيل المثال، إزالة المواد غير الممتصة من الجهاز الهضمي، واستخدام المراقبة السريرية (بما في ذلك الحصول على مخطط كهربية القلب)، وبدء العلاج الداعم إذا لزم الأمر.
الخصائص الفيزيائية:
غلوكيتا ٥٠: مضغوطات ملبسة بالفيلم صفراء، دائرية، محدبة الوجهين، لها خط كسر.
غلوكيتا ١٠٠: مضغوطات ملبسة بالفيلم صفراء، دائرية ، محدبة الوجهين.
شروط التخزين:
يحفظ في درجة حرارة أقل من ٢٥ درجة مئوية.
يحفظ بعيداً عن متناول أيدي الأطفال.
التعبئة:
كل عبوة كرتونية غلوكيتا ٥٠- ١٠٠ملغ تحتوي على ٢٠ مضغوطة ملبسة بالفيلم ضمن شريطي بليستر.

الدواء مستحضر يؤثر على صحتك واستعماله خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر
اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليهما وتعليمات الصيدلي
الذي صرفها لك ، فالطبيب والصيدلي هما الخبيران في الدواء وبنفعه وضرره.
لاتكرر صرف الدواء بدون وصفة طبية.
لاتترك الأدوية بمتناول أيدي الأطفال .
مجلس وزراء الصحة العرب واتحاد الصيادلة العرب.

p01622 / R02

إنتاج شركة ريفا للصناعات الدوائية - سوريا