



Glucal

Teneligliptina

Vía oral
Comprimidos recubiertos

Fórmula

Cada comprimido recubierto contiene Teneligliptina (como Bromhidrato) 20 mg. Excipientes: Dióxido de silicio coloidal; Croscarmelosa sódica; Estearato de magnesio; Manitol; Hidroxipropilmetilcelulosa; Dióxido de titanio; Triacetina.

Acción terapéutica

La Teneligliptina es un hipoglucemiante oral, inhibidor de la dipeptidil peptidasa 4 (DPP-4). Clase ATC: A10BH

Indicaciones

Glucal está indicado para mejorar el control de la glucemia en los pacientes adultos con diabetes tipo 2, que no hayan respondido adecuadamente al tratamiento con dieta y ejercicio, ni al agregado de biguanidas, sulfonilureas, ni tiazolidinedionas.

Acción farmacológica

Mecanismo de acción: El péptido similar al glucagón tipo 1 (GLP-1) es secretado por el tracto gastrointestinal en respuesta a los alimentos, promueve la secreción de insulina desde el páncreas y, mediante la supresión de la secreción de glucagón, ajusta la glucemia postprandial. La Teneligliptina al inhibir la actividad de la dipeptidil peptidasa 4 (DPP-4), suprime la degradación del GLP-1, aumentando la concentración sanguínea de GLP-1 activado, mediante la cual despliega el efecto hipoglucémico. Se ha descrito que la administración de Teneligliptina una vez al día a pacientes con diabetes tipo 2 mejora la glucemia post desayuno, almuerzo y cena y también la glucemia en ayunas y la concentración de hemoglobina glicosilada (HbA1c).

Farmacocinética:

La Teneligliptina se absorbe bien en el tracto digestivo, alcanzando la concentración plasmática máxima a los 60 minutos de administrada. Los alimentos disminuyen un 20% la concentración plasmática máxima pero no modifican el AUC. Se ha informado que la unión a las proteínas del plasma es del orden del 78 al 82%. En la sangre se ha detectado Teneligliptina sin modificar y cinco metabolitos principales, siendo el M1 (71,1%) y el M2 (14,7%) los más preponderantes. No se ha descrito si estos presentan actividad biológica. El metabolismo de la Teneligliptina está relacionado principalmente con la isoenzima 3A4 del citocromo P450 (CYP3A4) y las flavinas monooxigenasas 1 y 3 (FMO-01 y FMO-03). Por otra parte la Teneligliptina mostró un efecto inhibidor débil sobre CYP2D6, CYP3A4 y FMO, pero no mostró efecto inhibitorio sobre CYP1A2, CYP2A6, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C8/9, CYP2C19, CYP2E1 y no produjo inducción del CYP1A2 ni del CYP3A4. Luego de la administración

oral alrededor del 21% de la dosis se eliminó sin cambios en la orina. Luego de la administración de Teneligliptina marcada con C14, 45,4% se eliminó en la orina y 46,5% se eliminó en las heces. La administración de Teneligliptina a pacientes con alteración de la función renal no produjo cambios significativos en la concentración plasmática máxima, en la vida media ni en el AUC. La administración a pacientes con disfunción hepática leve (Child-Pugh 5-6) a moderada (Child-Pugh 7-9) tampoco produjo cambios significativos en la C_{max} ni en el AUC. No se ha informado experiencia clínica en pacientes con disfunción hepática severa (Child-Pugh >9). Los parámetros farmacocinéticos en ancianos sanos fueron prácticamente similares a los observados en los individuos jóvenes. No se han informado variaciones farmacocinéticas de importancia clínica con la administración conjunta de Teneligliptina con glimepirida o pioglitazona. La administración conjunta con metformina produjo un aumento del AUC de alrededor de 21%. La administración conjunta con ketoconazol aumentó la C_{max} y el AUC en 37% y 49%.

Posología y forma de administración

Adultos:

Habitualmente se administra un comprimido de 20 mg una vez al día. Sin embargo, en casos de efecto insuficiente, se puede aumentar la dosis a dos comprimidos (40 mg) una vez al día, observando cuidadosamente la evolución.

Glucal puede administrarse en cualquier momento del día, con los alimentos o lejos de ellos.

Contraindicaciones

Glucal está contraindicado en pacientes con antecedentes de hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del medicamento. Pacientes con diabetes tipo 1. Cetocidosis. Pre coma o coma diabético. Infecciones graves. Pre y post quirúrgico. Traumatismos graves. Lactancia.

Advertencias

Por no estar determinada su seguridad debido a la falta de experiencia clínica se recomienda administrar con suma precaución a pacientes con alteración severa de la función hepática y a pacientes con insuficiencia cardíaca: (Clases III-IV NYHA).

Por aumentar el riesgo potencial de hipoglucemia se recomienda administrar con precaución a los pacientes que reciben drogas del grupo sulfonilureas; pacientes con insuficiencia hipofisaria o insuficiencia suprarrenal; pacientes en estado de debilitamiento, desnutrición, inanición, ingesta alimentaria irregular y/o insuficiente; pacientes en ejercicio muscular intenso; individuos con consumo excesivo de alcohol.

En los pacientes con antecedentes de cirugía abdominal u obstrucción intestinal puede estar aumentado el riesgo de obstrucción intestinal.

En los pacientes con arritmias o antecedentes previos de bradicardia severa, pacientes cardiopatas con insuficiencia cardíaca congestiva, o pacientes con hipokalemia puede estar aumentado el riesgo de prolongación del QT.

Farmacovigilancia:

Glucal se encuentra sujeto a un Plan de Gestión de Riesgo de acuerdo a la Guía de Buenas Prácticas de Farmacovigilancia propuestas por la Administración Nacional de Medicamentos, Alimentos y Tecnología Médica (ANMAT).

Precauciones

Explicar al paciente el cuadro de hipoglucemia y su tratamiento, especialmente en el caso de uso asociado con sulfonilureas. Para reducir el riesgo de hipoglucemia, considerar la disminución de la dosis de las sulfonilureas.

Glucal sólo debe indicarse a pacientes con un diagnóstico establecido de diabetes mellitus tipo 2. No debe emplearse en pacientes con cuadros similares como intolerancia a la glucosa, glucosuria renal o alteración de la función tiroidea.

La administración de **Glucal** sólo debe considerarse en los casos en que el tratamiento básico de la diabetes tipo 2, basado en la dieta y el ejercicio físico, haya resultado insuficiente.



Durante la administración de **Glucal**, se debe controlar periódicamente la glucemia y la hemoglobina glicosilada (HbA1c) para comprobar los efectos. En caso que el efecto sea insuficiente luego de la administración durante 3 meses, el médico debe considerar el cambio hacia otra modalidad terapéutica. Durante la administración continua, pueden haber casos que requieran la interrupción de la administración o la reducción de la dosis. Por el contrario, en otros casos su efecto puede disminuir o resultar insuficiente, ya sea por intemperancia del paciente o por complicaciones infecciosas. Se sugiere precaución en cuanto a su administración continua permanente, en la determinación de la dosis necesaria en cada caso o en la elección de las drogas que se administran concomitantemente, teniendo en cuenta además la magnitud de la ingesta dietética, la glucemia o la posible existencia de cuadros infecciosos.

Debido a que existe el riesgo de que se presenten efectos adversos tales como la prolongación del QT, es preferible evitar la administración en pacientes con QT prolongado o antecedentes del mismo (síndrome de QT prolongado congénito), en pacientes con antecedentes de torsades des pointes o en pacientes en tratamiento con otros medicamentos que prolongan el QT.

Durante el tratamiento con Teneligliptina pueden ocurrir alteración de las enzimas hepáticas (GOT, GPT, etc.), por lo que los pacientes deben ser monitorizados. Si se observara elevación de las enzimas y/o signos de disfunción, se deberán tomar las medidas pertinentes, inclusive la suspensión del tratamiento. Durante la administración puede ocurrir neumonía intersticial: Si se presentara tos, disnea, fiebre, crepitaciones, etc. se deberán realizar exámenes como radiografía de tórax, TAC y marcadores séricos. Si se sospechara de neumonía intersticial, se deberá suspender el tratamiento y aplicar las medidas necesarias para el tratamiento de la misma, incluyendo la administración de corticoides. Otro evento que puede ocurrir durante el tratamiento es la aparición de penfigoide en la piel. Si se presentaran ampollas, erosión u otras signos y síntomas, se deberá indicar concurrir al dermatólogo para una evaluación dermatológica y tomar medidas apropiadas, tales como la interrupción del tratamiento. Embarazo: Se ha informado que la Teneligliptina atraviesa la placenta en los animales de experimentación. No existe experiencia en mujeres embarazadas. En las mujeres embarazadas, o que pudieran estarlo, sólo se administrará **Glucal** si el médico considera que los beneficios del tratamiento superan los riesgos potenciales.

Lactancia: Se ha informado que la Teneligliptina pasa a la leche en los animales de experimentación. No debe administrarse **Glucal** a mujeres que se encuentran amamantando.

Uso pediátrico: No ha sido determinada la seguridad de la Teneligliptina en menores de 18 años. Uso en ancianos: No es necesario disminuir la dosis. Sin embargo, debido a que las funciones fisiológicas pueden estar disminuidas en los ancianos, se recomienda administrarlo con precaución.

Interacciones medicamentosas

Otros medicamentos anti diabéticos (sulfonilureas, secretagogos de la insulina de acción rápida, inhibidores de la alfa-glucosidasa, biguanidas, tiazolidinedionas, análogos del GLP-1, insulinas): Administrar con precaución por el riesgo de hipoglucemia, especialmente a los pacientes que reciben drogas del grupo sulfonilureas. Para reducir el riesgo de hipoglucemia considerar la disminución de la dosis de sulfonilureas.

Medicamentos que aumentan la acción hipoglucemiante (betabloqueantes, salicilatos, inhibidores de la monoaminoxidasa): Administrar con precaución por el riesgo de hipoglucemia.

Medicamentos inhibidores potentes del CYP3A4 (ketoconazol, itraconazol, claritromicina, inhibidores de la proteasa): Administrar con precaución por el riesgo de aumento de las concentraciones de Teneligliptina, hipoglucemia o aumento del QT.

Medicamentos que disminuyen la acción hipoglucemiante (adrenalina, hormonas córtico-suprarrenales, hormonas tiroideas): Administrar con precaución por el riesgo de hiperglucemia.

Medicamentos que prolongan el QT (antiarrítmicos de clase IA: Sulfato de quinidina, procainamida; antiarrítmicos de clase III: Amiodarona, sotalol): Administrar con precaución por el riesgo de prolongación del QT.

Reacciones adversas

Se ha informado que las reacciones adversas más frecuentes han sido la hipoglucemia y la constipación. La hipoglucemia puede aparecer con la asociación con otros medicamentos para la diabetes mellitus (al asociar glicemipirida 8,9%, pioglitazona 1,5%). En particular, se han informado síntomas graves

de hipoglucemia con otros inhibidores DPP-4 en asociación con sulfonilureas, incluyendo casos con pérdida de la conciencia. Debe considerarse la reducción de la dosis de las sulfonilureas. También se han informado cuadros de hipoglucemia sin utilizar otros medicamentos para la diabetes (1,0%). Si se observan síntomas de hipoglucemia, se deben adoptar las medidas adecuadas como la ingestión de alimentos o bebidas que contengan hidratos de carbono.

Si se presenta constipación puede aumentar el riesgo de obstrucción intestinal. Por tal motivo, se debe realizar una observación cuidadosa y, en caso de constatarse anomalías como estreñimiento severo, distensión abdominal, dolor abdominal persistente o vómitos, suspender la administración y llevar a cabo las medidas adecuadas.

Las siguientes reacciones adversas fueron informadas con una incidencia menor del 1%, sin haberse confirmado la relación con la droga en todos los casos:

Digestivas: Constipación, distensión abdominal, malestar abdominal, náuseas, dolor abdominal, flatulencia, estomatitis, pólipos gástricos, pólipos colónicos, úlcera duodenal, pancreatitis aguda. Hepáticas: Elevación de la AST (TGO), de la ALT (TGP) y de la gamma-GTP.

Renales: Proteinuria, cetonuria, sangre oculta en orina.

Pulmonares: Neumonía intersticial.

Dermatológicas: Eczema, erupción cutánea, prurito, dermatitis alérgica, penfigoide.

Otras: Elevación de la CPK, elevación del potasio sérico, astenia.

Sobredosisificación

Los síntomas de sobredosis pueden estar relacionados con hipoglucemia o aumento del QT. Se recomienda emplear las medidas habituales de soporte, como eliminar del tubo digestivo el medicamento no absorbido, monitoreo clínico y tratamiento clínico adecuado. Es probable que la hemodiálisis no resulte efectiva teniendo en cuenta la elevada unión proteica de la Teneligliptina. Ante la eventualidad de una sobredosisificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología: Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666 / 2247, Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777.

Presentación

Glucal Comprimidos recubiertos: Envase conteniendo 30 comprimidos recubiertos.



Comprimidos redondos, color blanco, codificados TN en una cara.

Venta bajo receta. *Industria Argentina.*

Medicamento autorizado por el Ministerio de Salud. Certificado N° 57.355.

Directora Técnica: Jorgelina D'Angelo, Farmacéutica.

Elaborado en José E. Rodó 6424, C1440AKJ Ciudad Autónoma de Buenos Aires.

Fecha de última actualización: Abril de 2018.

Producto medicinal. Mantener fuera del alcance de los niños.

Conservar en lugar seco a temperatura inferior a 30°C.

Información a profesionales y usuarios: ☎ 0-800-333-5658

Roemmers S.A.I.C.F.

Fray J. Sarmiento 2350, B1636AKJ Olivos, Pcia. de Buenos Aires.

www.roemmers.com.ar

B 1165901872
13847 0820
68



ROEMMERS
CONCIENCIA POR LA VIDA