

ГЛЮКОФОРС

Пероральный препарат, применяется при диабете 2 типа

Растительные тиазолидиндионы (ТЗД)

Это новый класс антидиабетических средств, которые действуют как агонисты рецепторов активации пролиферации фероксисом гамма – подкласса (PPAR). PPAR-это лиганд активируемые факторы транскрипции, сходные с семейством тереоидных и стероидных рецепторов.

Основной механизм действия растительных ТЗД обусловлен активацией ядерных PPAR – гамма – рецепторов, т.е. рецепторов, активируемых пролифераторами пероксисом. PPAR относится к особому виду ядерных рецепторов, регулирующих экспрессию генов клетки в ответ на связывание со специфическим для данного рецептора веществом – лигандом.

Растительные ТЗД являются лигандами PPAR- гамма – рецепторов.

Под влиянием активации PPAR – гамма – рецепторов изменяется регуляция углеводного обмена, а также значительно повышается чувствительность к инсулину жировой, мышечной и печеночной тканей. Это характеризует растительные ТЗД как инсулиносенситайзеры и позволяет назначать их больным сахарным диабетом 2 типа. Ранее для подобных больных единственным препаратом снижающим инсулинорезистентность, был медформин.

Растительные ТЗД обладают следующими эффектами:

- снижают концентрацию глюкозы в крови;
- увеличивают экспрессию глюкозного транспортера (особенного Glut4) и нескольких промежуточных продуктов в инсулиносигнальном каскаде, уменьшают уровень триглицеридов и артериальной гипертонии;
- угнетают вольтажзависимый вход в кардиомиоцит ионакальция под влиянием норадреналина, препятствуя кальциевой перегрузке миокардиальной клетки и ее последующему повреждению;
- снижают частоту вазоспастической стенокардии у больных сахарным диабетом;

- уменьшают пролиферацию неоинтимы после коронарного стентирования больных сахарным диабетом 2 типа и улучшают кровоток в коронарных сосудах сердца;
- уменьшают риск развития сахарного диабета при применении у больных метаболическим синдромом;
- благоприятно влияют на факторы сердечно-сосудистого прогноза при сахарном диабете 2 типа;
- прием ТЗД во время стрессовых ситуаций больными сахарным диабетом 2 типа с нарушением перфузии миокарда достоверно улучшает тканевое миокардиальное кровоснабжение (улучшение кровоснабжения сердца у больных сахарным диабетом 2 типа).

При применении ГЛЮКОФОРСа достоверно снижается уровень систолического и диастолического артериального давления у больных сахарным диабетом 2 типа по сравнению с больными, получавшими препараты сульфонилмочевины.

ГЛЮКОФОРС не вызывает снижения уровня триглицеридемии у больных сахарным диабетом 2 типа, но сдвигает спектр холестерина липопротеинов низкой плотности, уменьшая его атерогенность. Антиатерогенное действие ГЛЮКОФОРСа проявляется в повышении уровня холестерина ЛПВП (полезного холестерина), в основном за счет нарастания фракции ЛПВП2.

Влияя на уровень E-селектина и концентрацию Ц-реактивного белка в крови, уменьшая поражение сосудистых стенок у больных сахарным диабетом 2 типа, растительные ТЗД способствуют увеличению кровотока в периферических сосудах.

Достоверно уменьшая уровень ММП9, отражающего уровень риска разрыва атеросклеротической бляшки у больных сахарным диабетом 2 типа, и достоверно снижая концентрацию ингибитора активатора тканевого плазминогена-1 (ИАП-1), уровень которого резко увеличен у больных сахарным диабетом 2 типа, ГЛЮКОФОРС снижает риск разрыва атеросклеротических бляшек и развития тромбоза коронарных (сердечных) сосудов. Растительные ТЗД достоверно снижают частоту рестенозов у стентированных пациентов с сахарным диабетом 2 типа. Следует отметить, что назначение растительных ТЗД больным сахарным диабетом 2

типа, которые готовятся к проведению аортокоронарного шунтирования, позволяет сделать это инвазивное вмешательство объективно оправданным, т.к. оно достоверно более эффективно, чем проведение неинвазивной интенсивной медикаментозной терапии.

Признаком гепатотоксичности у ГЛЮКОФОРСа не наблюдается.

ГЛЮКОФОРС является перспективным препаратом для снижения риска развития ишемической болезни сердца и ее осложнений у больных сахарным диабетом 2 типа.

Растительные ТЗД оказывают выраженное положительное влияние на чувствительность к инсулину, снижают инсулинорезистентность и улучшают контроль углеводного обмена у больных сахарным диабетом 2 типа.

Снижение количества висцерального жира под влиянием ГЛЮКОФОРСа также является фактором, уменьшающим риск возникновения атерогенных сдвигов метаболизма.

Данные об уменьшении соотношения толщин интимы/медии в сонных артериях больных сахарным диабетом 2 типа, находящихся на терапии ГЛЮКОФОРСом, являются доказательством выраженного антиатеросклеротического действия растительных ТЗД.

Еще одним важным свойством ГЛЮКОФОРСа является уменьшение размеров инфаркта миокарда в экспериментальных условиях острого коронарного синдрома.

Нет сомнений, что растительные ТЗД реально положительно воздействуют на показатели углеводного обмена, инсулинорезистентности и на многие традиционные факторы сердечно - сосудистого прогноза больных сахарным диабетом 2 типа.

Опубликованные в Великобритании данные исследования подчеркнули, что применение растительных ТЗД ведет к более низкой общей смертности по сравнению с метформинем и имеет значительно более благоприятный профиль риска по сравнению с синтетическими ТЗД.

Также при применении растительных ТЗД отсутствует поражение органов – мишеней и преобладают эффекты, связанные со снижением инсулинорезистентности. Подобной комбинацией свойств можно объяснить

снижение общей смертности у больных сахарным диабетом 2 типа, достоверно более выраженное по сравнению с другими сахароснижающими средствами.

Таким образом, клиническая картина, развивающаяся у больных сахарным диабетом 2 типа при применении растительных ТЗД, формируется под влиянием на организм двух основных механизмов: уменьшения инсулинорезистентности и связанного с ней риска прогрессирования сахарного диабета и сосудистых осложнений и увеличение активности обмена свободных радикалов под влиянием увеличивающегося количества специфических внутриклеточных органелл.

Наша цель – внедрение в широкую клиническую практику препарата ГЛЮКОФОРС, обладающего уникальными возможностями в отношении снижения смертности больных сахарным диабетом 2 типа.