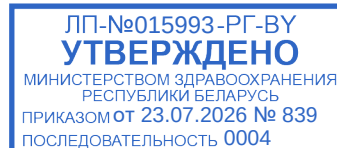


ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Метформин, 500 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой



2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: метформина гидрохлорид.

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 500 мг метформина гидрохлорида.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые. На поперечном разрезе видно ядро белого или почти белого цвета.

На поверхности таблеток допускается неровность пленочного покрытия.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Метформин показан к применению у взрослых:

- при сахарном диабете 2 типа, особенно у пациентов с ожирением, при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок в качестве монотерапии или в сочетании с другими пероральными гипогликемическими средствами, или с инсулином;
- для профилактики сахарного диабета 2 типа у пациентов с предиабетом с дополнительными факторами риска развития сахарного диабета 2 типа, у которых изменения образа жизни не позволили достичь адекватного гликемического контроля.

Лекарственный препарат Метформин показан к применению у детей в возрасте от 10 лет:

- при сахарном диабете 2 типа, особенно у пациентов с ожирением, при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок в качестве монотерапии или в сочетании с инсулином.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

Монотерапия и комбинированная терапия в сочетании с другими пероральными гипогликемическими средствами при сахарном диабете 2 типа

Обычная начальная доза составляет 500 мг метформина гидрохлорида 2 или 3 раза в сутки во время или после приема пищи.

Через каждые 10–15 дней рекомендуется корректировать дозу на основании результатов измерения уровня глюкозы в крови. Медленное увеличение дозы способствует снижению нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта (ЖКТ).

Поддерживающая доза препарата обычно составляет 1500-2000 мг в сутки. Для уменьшения нежелательных реакций со стороны ЖКТ суточную дозу следует разделить на 2-3 приема.

Максимальная доза метформина составляет 3000 мг в сутки, разделенная на 3 приема.

При переходе с другого перорального гипогликемического препарата следует прекратить прием другого препарата и начать принимать лекарственный препарат Метформин в дозе, указанной выше.

Комбинация с инсулином

Для достижения лучшей коррекции уровня глюкозы в крови метформин и инсулин у пациентов с сахарным диабетом 2 типа можно применять в виде комбинированной терапии.

Обычная начальная доза препарата Метформин составляет 500 мг 2 или 3 раза в сутки, в то время как дозу инсулина подбирают на основании концентрации глюкозы в крови.

Монотерапия при предиабете

Обычная доза составляет 1000-1500 мг в сутки во время или после приема пищи, разделенная на 2 приема.

Рекомендуется регулярно проводить гликемический контроль для оценки необходимости дальнейшего применения препарата.

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

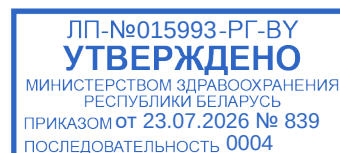
Из-за возможного снижения функции почек у пациентов пожилого возраста дозу препарата Метформин следует корректировать в зависимости от функции почек. Необходима регулярная оценка функции почек (определение концентрации креатинина в сыворотке крови не менее 2-4 раз в год).

Пациенты с нарушением функции почек

Метформин может применяться у пациентов с почечной недостаточностью с клиренсом креатинина (КК) 30-59 мл/мин только в случае отсутствия состояний/факторов риска, которые могут увеличивать риск развития лактоацидоза.

Необходимо определить скорость клубочковой фильтрации (КК) перед началом лечения препаратами, содержащими метформин, а затем не реже одного раза в год после начала лечения. У пациентов с повышенным риском прогрессирования почечной недостаточности, а также у пациентов пожилого возраста, функцию почек следует контролировать чаще (каждые 3-6 месяцев).

Если КК ниже 30 мл/мин, прием препарата должен быть немедленно прекращен.



КК, мл/мин	Максимальная суточная доза, разделенная на 2-3 приема	Дополнительный комментарий
60-89	3000 мг	В связи со снижением функции почек следует рассмотреть возможность уменьшения дозы метформина.
45-59	2000 мг	Перед началом терапии метформином следует учесть факторы, которые могут увеличить риск лактоацидоза (см. раздел 4.4).
30-44	1000 мг	

		Начальная доза составляет половину максимальной суточной дозы.
<30	—	Прием метформина противопоказан.

Дети

Препарат Метформин можно принимать детям старше 10 лет и подросткам в качестве монотерапии или в комбинации с инсулином.

Обычная начальная доза составляет 500 мг препарата Метформин один раз в сутки во время или после еды.

Через 10-15 дней дозу следует скорректировать на основании результатов измерения уровня глюкозы в крови.

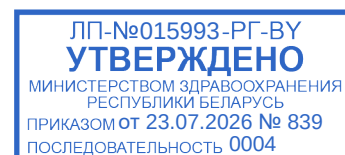
Максимальная суточная доза составляет 2000 мг, разделенная на 2- 3 приема.

Продолжительность лечения

Препарат Метформин следует принимать ежедневно, без перерыва. В случае прекращения лечения пациент должен сообщить об этом врачу.

Способ применения

Таблетки принимают внутрь, во время или после еды.



4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к метформину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, кома;
- почечная недостаточность или нарушение функции почек (КК <30 мл/мин);
- острые состояния, протекающие с риском развития нарушения функции почек: дегидратация (при диарее, рвоте), тяжелые инфекционные заболевания, шок;
- клинически выраженные проявления острых или хронических заболеваний, которые могут приводить к развитию тканевой гипоксии (в том числе острая сердечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность с нестабильными показателями гемодинамики, дыхательная недостаточность, острый инфаркт миокарда);
- обширные хирургические операции и травмы, когда показано проведение инсулинотерапии (см. раздел 4.4);
- печеночная недостаточность, нарушение функции печени;
- хронический алкоголизм, острое отравление алкоголем;
- лактоацидоз (в том числе и в анамнезе);
- применение в течение менее 48 ч до и в течение 48 ч после проведения радиоизотопных или рентгенологических исследований с введением йодсодержащего контрастного вещества (см. раздел 4.5);
- соблюдение гипокалорийной диеты (менее 1 000 ккал/сут);
- детский возраст до 10 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Следует соблюдать осторожность при следующих ситуациях:

- лицам старше 60 лет, выполняющих тяжелую физическую работу, что связано с

повышенным риском развития у них лактоацидоза;

- пациентам с почечной недостаточностью (КК 30– 59 мл/мин);
- во время беременности и в период грудного вскармливания;
- детям в возрасте от 10 до 12 лет.

Лактоацидоз

Лактоацидоз является очень редким, но серьезным (высокая смертность при отсутствии неотложного лечения) осложнением, которое может возникнуть из-за кумуляции метформина. Случаи лактоацидоза при приеме метформина возникали в основном у пациентов с сахарным диабетом с выраженной почечной недостаточностью.

При обезвоживании (тяжелой диарее или рвоте, лихорадке или снижении потребления жидкости) применение метформина следует временно прекратить.

Следует учитывать и другие сопряженные факторы риска, такие как декомпенсированный сахарный диабет, кетоз, продолжительное голодание, алкоголизм, тяжелое инфекционное заболевание, печеночная недостаточность, любое состояние, связанное с выраженной гипоксией и одновременный прием препаратов, которые могут вызывать развитие лактоацидоза (см. раздел 4.5). Это может помочь снизить частоту случаев возникновения лактоацидоза.

Следует учитывать риск развития лактоацидоза при появлении неспецифических признаков, таких как мышечные судороги, сопровождающиеся диспепсическими расстройствами, болью в животе и выраженной астенией. Лактоацидоз характеризуется ацидотической одышкой, болью в животе и гипотермией с последующей комой. Диагностическими лабораторными показателями являются снижение pH крови (менее 7,35), содержание лактата в плазме крови свыше 5 ммоль/л, повышенные анионный промежуток и отношение лактат/пируват. При подозрении на метаболический ацидоз необходимо прекратить прием препарата и немедленно обратиться к врачу.

Пациенты с установленными или предполагаемыми митохондриальными заболеваниями:

Пациентам с установленными митохондриальными заболеваниями, такими как митохондриальная энцефалопатия с лактоацидозом и инсультоподобными эпизодами (MELAS-синдром), а также наследственный диабет и глухота по материнской линии (MIDD), прием метформина не рекомендуется из-за риска обострения лактоацидоза и неврологических осложнений, которые могут привести к ухудшению течения заболевания.

В случае появления признаков и симптомов, указывающих на MELAS-синдром или MIDD после приема метформина, лечение метформином следует немедленно прекратить и как можно скорее провести диагностическое обследование.

Хирургические вмешательства

Необходимо прекратить применение метформина во время проведения хирургических операций под общей, спинальной или эпидуральной анестезией. Терапия метформином может быть продолжена не ранее, чем через 48 часов после хирургической операции или возобновления приема пищи при условии, что функция почек была обследована и признана нормальной.

Функция почек

Поскольку метформин выводится почками, перед началом лечения и регулярно в последующем, необходимо определять КК:

- не реже 1 раза в год у пациентов с нормальной функцией почек;
- каждые 3–6 месяцев у пациентов с КК 45–59 мл/мин;

- каждые 3 месяца у пациентов с КК 30–44 мл/мин.

Следует проявлять особую осторожность при возможном нарушении функций почек у пожилых пациентов, при дегидратации (хроническая или тяжелая диарея, многократные приступы рвоты), при одновременном применении гипотензивных лекарственных препаратов, диуретиков или нестероидных противовоспалительных препаратов.

Сердечная недостаточность

Пациенты с сердечной недостаточностью имеют более высокий риск развития гипоксии и почечной недостаточности. Пациентам с хронической сердечной недостаточностью следует регулярно проводить мониторинг сердечной функции и функции почек во время приема метформина.

Прием метформина противопоказан при острой сердечной недостаточности с нестабильными показателями гемодинамики.

Дети и подростки

Диагноз сахарного диабета 2 типа должен быть подтвержден до начала лечения метформином.

В ходе клинических исследований продолжительностью один год было показано, что метформин не влияет на рост и половое созревание. Однако ввиду отсутствия долгосрочных данных, рекомендован тщательный контроль последующего влияния метформина на эти параметры у детей, особенно в период полового созревания. Наиболее тщательный контроль необходим детям в возрасте 10-12 лет.

Применение йодсодержащих рентгеноконтрастных средств

Внутрисосудистое введение йодсодержащих рентгеноконтрастных средств может привести к развитию почечной недостаточности и кумуляции метформина, что повышает риск развития лактоацидоза. Прием препарата Метформин следует прекратить до или во время проведения рентгенологического исследования с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств, и не возобновлять прием ранее, чем через 48 часов после исследования, при условии, что функция почек была обследована и признана нормальной.

Применение во время беременности

Применение препарата во время беременности возможно только по рекомендациям лечащего врача с учетом отношения ожидаемой пользы для матери к возможному риску для плода и ребенка. Имеются ограниченные и неубедительные данные о влиянии метформина на долгосрочные результаты массы тела детей, подвергшихся воздействию метформина внутриутробно. Метформин не влияет на двигательное и социальное развитие у детей в возрасте до 4 лет, подвергшихся воздействию препарата во время беременности, хотя данные о долгосрочных результатах ограничены.

Другие меры предосторожности

Пациентам рекомендуется соблюдать диету с равномерным потреблением углеводов в течение дня. Пациентам с избыточной массой тела рекомендуется продолжать соблюдать гипокалорийную диету (но не менее 1 000 ккал/сут).

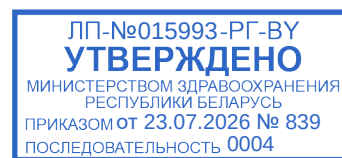
Рекомендуется регулярно проводить стандартные лабораторные анализы для контроля сахарного диабета.

Рекомендуется ежегодно контролировать уровень витамина В₁₂ в сыворотке крови. Риск снижения уровня витамина В₁₂ возрастает по мере увеличения дозы метформина, продолжительности терапии и/или у пациентов с наличием факторов риска, вызывающих дефицит витамина В₁₂ (см. раздел 4.8).

Метформин при монотерапии не вызывает гипогликемию, однако в случае применения препарата в комбинации с инсулином или другими гипогликемическими средствами (например, производными сульфонилмочевины, репаглинидом и др.) рекомендуется соблюдать осторожность.

Прием препарата рекомендован для профилактики сахарного диабета 2 типа лицам с предиабетом и дополнительными факторами риска развития явного сахарного диабета 2 типа, такими как:

- возраст менее 60 лет;
- индекс массы тела (ИМТ) ≥ 30 кг/м²;
- гестационный сахарный диабет в анамнезе;
- семейный анамнез сахарного диабета у родственников первой степени;
- повышенная концентрация триглицеридов;
- сниженная концентрация холестерина липопротеинов высокой плотности (ЛПВП);
- артериальная гипертензия.



4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Противопоказанные комбинации

Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства

На фоне функциональной почечной недостаточности у пациентов с сахарным диабетом радиологическое исследование с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств может вызывать развитие лактоацидоза. Лечение препаратом Метформин необходимо отменить в зависимости от функции почек за 48 часов до или на время рентгенологического исследования с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств и не возобновлять ранее 48 часов после при условии, что в ходе обследования функция почек была признана нормальной.

Нерекомендуемые комбинации

Алкоголь

Риск развития лактоацидоза увеличивается при острой алкогольной интоксикации, особенно в случае недостаточного питания, соблюдения низкокалорийной диеты или печеночной недостаточности. Во время приема препарата Метформин следует избегать приема алкоголя и лекарственных препаратов, содержащих этанол.

Комбинации, требующие осторожности

Даназол

Не рекомендуется одновременный прием даназола во избежание гипергликемического действия последнего. При необходимости лечения даназолом и после прекращения приема последнего требуется коррекция дозы препарата Метформин под контролем концентрации глюкозы в крови.

Хлорпромазин

При приеме в больших дозах (100 мг в день) повышает концентрацию глюкозы в крови, снижая высвобождение инсулина. При лечении нейролептиками и после прекращения приема последних требуется коррекция дозы препарата Метформин под контролем концентрации глюкозы в крови.

Глюкокортикостероиды (ГКС)

Глюкокортикостероиды системного и местного действия снижают толерантность к глюкозе, повышают концентрацию глюкозы в крови, иногда вызывая кетоз. При лечении ГКС и после прекращения приема последних требуется коррекция дозы препарата Метформин под контролем концентрации глюкозы в крови.

Диуретики

Одновременный прием «петлевых» диуретиков может привести к развитию лактоацидоза из-за возможной функциональной почечной недостаточности. Не следует назначать препарат Метформин, если КК ниже 60 мл/мин.

Назначаемые в виде инъекций бета₂-адреномиметики

Препараты данной группы повышают концентрацию глюкозы в крови вследствие стимуляции бета₂-адренорецепторов. В этом случае необходим контроль концентрации глюкозы в крови. При необходимости рекомендуется назначение инсулина. При одновременном применении вышеперечисленных лекарственных препаратов может потребоваться более частый контроль концентрации глюкозы в крови, особенно в начале лечения. При необходимости доза метформина может быть скорректирована в процессе лечения и после его прекращения.

Гипотензивные лекарственные препараты, (за исключением ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента)

Препараты данной группы могут снижать концентрацию глюкозы в крови. При необходимости следует скорректировать дозу метформина.

Производные сульфонилмочевины, инсулин, акарбоза, салицилаты

При одновременном приеме препарата Метформин с данными препаратами возможно развитие гипогликемии.

Нифедипин

Нифедипин повышает абсорбцию и максимальную концентрацию в плазме крови ($C_{\max}$) метформина.

Катионные лекарственные препараты

Катионные лекарственные препараты (амилорид, дигоксин, морфин, прокаинамид, хинидин, хинин, ранитидин, триамтерен, триметоприм и ванкомицин), секретирующиеся в почечных канальцах, конкурируют с метформином за канальцевые транспортные системы и могут приводить к увеличению его $C_{\max}$.

Транспортеры органических катионов (ОСТ)

Метформин является субстратом органических транспортеров ОСТ1 и ОСТ2.

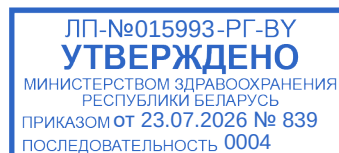
Одновременный прием метформина с:

- ингибиторами ОСТ1 (верапамил) может снижать эффективность гипогликемического действия метформина;
- индукторами ОСТ1 (рифампицин) может увеличивать абсорбцию метформина в желудочно-кишечном тракте и его эффективность;
- ингибиторами ОСТ2 (циметидин, долутегравир, ранолазин, триметоприм, кризотиниб, олапариб, вандетаниб, даклатасвир) может уменьшать почечную элиминацию метформина и таким образом приводить к увеличению плазменной концентрации метформина.

В связи с этим рекомендуется соблюдать осторожность, особенно у пациентов с почечной недостаточностью, когда эти лекарственные препараты принимаются одновременно

метформин, так как возможно повышение плазменной концентрации метформина. При необходимости может быть рассмотрен вопрос о коррекции дозы препарата Метформин, так как ингибиторы/индукторы ОСТ могут изменять эффективность метформина.

Некоторые лекарственные препараты способны оказывать гипергликемическое действие и приводить к ухудшению гликемического контроля. К таким лекарственным препаратам относятся фенотиазиды, глюкагон, эстрогены, пероральные контрацептивы, фенитоин, симпатомиметики, никотиновая кислота, изониазид, блокаторы «медленных» кальциевых каналов, гормоны щитовидной железы. При одновременном применении вышеперечисленных лекарственных препаратов у пациентов, получающих метформин, возможно снижение гипогликемического действия.



4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Неконтролируемая гипергликемия в периконцепционный период и во время беременности связана с повышенным риском врожденных пороков, невынашивания беременности, артериальной гипертензии, вызванной беременностью, преэклампсии и перинатальной смертности. Необходимо поддерживать концентрацию глюкозы в крови как можно ближе к нормальным значениям на протяжении всей беременности, для снижения риска неблагоприятных исходов, связанных с гипергликемией, для матери и плода.

Метформин проникает через плаценту в концентрациях, которые могут достигать концентраций в организме матери.

Большое количество данных о беременных женщинах (> 1000 случаев), полученных в рамках когортного исследования на основе регистров, опубликованных в реестр (метаанализы, клинические исследования и реестры) указывают на отсутствие повышенного риска врожденных пороков развития или фето-/неонатальной токсичности при приеме метформина в периконцепционный период и/или во время беременности.

Имеются ограниченные и неубедительные данные о влиянии метформина на долгосрочные результаты массы тела детей, подвергшихся воздействию метформина внутриутробно. Метформин не влияет на двигательное и социальное развитие у детей в возрасте до 4 лет, подвергшихся воздействию препарата во время беременности, хотя данные о долгосрочных результатах ограничены.

В случае клинической необходимости применение метформина может быть рассмотрено во время беременности и в периконцепционный период в качестве дополнения или альтернативы инсулину.

Лактация

Метформин проникает в грудное молоко. Нежелательные реакции у новорожденных/младенцев при грудном вскармливании на фоне приема метформина не наблюдались.

Однако в связи с ограниченным количеством данных, применение препарата в период грудного вскармливания не рекомендовано. Решение о прекращении грудного вскармливания следует принимать с учетом пользы от грудного вскармливания и потенциального риска возникновения нежелательных реакций у ребенка.

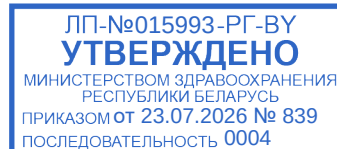
Фертильность

Метформин не влиял на фертильность самцов и самок крыс при введении в дозах до 600 мг/кг/день, что примерно в три раза превышает максимальную рекомендуемую суточную дозу для человека.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Монотерапия препаратом Метформин не вызывает гипогликемию и, следовательно, не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Тем не менее, следует предостеречь пациентов о риске гипогликемии при приеме препарата в комбинации с другими гипогликемическими препаратами (производные сульфонилмочевины, инсулин, репаглинид и др.).



4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Ниже представлены нежелательные реакции, о которых сообщалось при терапии метформином. Нежелательные реакции сгруппированы в соответствии с системно-органной классификацией и частотой встречаемости. Частота указана в соответствии со следующей классификацией: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($1/10\,000$, но $< 1/1\,000$); очень редко ($< 1/10\,000$); частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

В каждой частотной группе нежелательные реакции представлены в порядке убывания серьезности.

Нарушения метаболизма и питания

Часто: снижение уровня / дефицит витамина В₁₂. При обнаружении мегалобластной анемии необходимо учитывать возможность такой этиологии (см. раздел 4.4).

Очень редко: лактоацидоз (см. раздел 4.4).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: нарушение вкуса.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Очень часто: тошнота, рвота, диарея, боль в животе, отсутствие аппетита. Чаще всего эти нежелательные реакции возникают в начале лечения и в большинстве случаев спонтанно проходят. Для профилактики развития указанных симптомов рекомендуется принимать препарат Метформин 2 или 3 раза в день во время или после приема пищи. Медленное увеличение дозы также может улучшить желудочно-кишечную переносимость.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Очень редко: нарушение показателей функции печени и гепатит; после отмены метформина эти нежелательные явления полностью исчезают.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Очень редко: кожные реакции, такие как эритема, зуд, сыпь.

Дети

Согласно опубликованным данным, опыту постмаркетингового применения, а также результатам контролируемых клинических исследований с участием ограниченной группы детей и подростков в возрасте 10-16 лет, нежелательные реакции у детей по характеру и степени тяжести схожи с нежелательными реакциями, которые наблюдались у взрослых пациентов.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза-риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

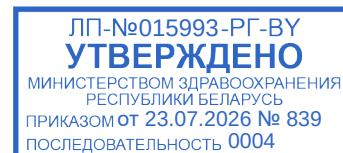
Адрес: 220037, г. Минск, пер. Товарищеский, 2а

Телефон: +375 (17) 242-00-29

Факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

Сайт: <https://www.rceth.by>



Кыргызская Республика

Департамент лекарственных средств и медицинских изделий Министерства здравоохранения

Кыргызской Республики

Адрес: 720044, г. Бишкек, ул. 3-я линия, 25

Телефон: 0800-800-26-26

Электронная почта: dlomt@pharm.kg

4.9. Передозировка

Симптомы

При приеме метформина в дозе 85 г (в 42,5 раза превышающей максимальную суточную дозу) развития гипогликемии не наблюдалось. Однако в этом случае наблюдалось развитие лактоацидоза. Значительная передозировка или сопряженные факторы риска могут привести к развитию лактоацидоза (см. раздел 4.4).

Лечение

В случае появления признаков лактоацидоза лечение препаратом необходимо немедленно прекратить, пациента срочно госпитализировать и, определив концентрацию лактата, уточнить диагноз. Наиболее эффективным мероприятием по выведению из организма лактата и метформина является гемодиализ. Проводят также симптоматическое лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Препараты для лечения сахарного диабета. Гипогликемические препараты, кроме инсулинов. Бигуаниды.

Код АТХ: A10BA02.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Метформин – бигуанид с антигипергликемическим эффектом, снижающий как базальную, так и постпрандиальную гипергликемию. Не стимулирует секрецию инсулина и, в связи с этим не вызывает гипогликемию. Метформин снижает базальную гиперинсулинемию, а в сочетании с инсулином снижает потребность в инсулине.

Метформин оказывает антигипергликемическое действие посредством нескольких механизмов:

– Метформин снижает выработку глюкозы в печени.

– Метформин способствует периферическому потреблению и утилизации глюкозы, частично за счет усиления действия инсулина.

– Метформин изменяет обмен глюкозы в кишечнике: потребление из кровотока увеличивается, а всасывание из пищи снижается. Дополнительные механизмы, связанные с кишечником, включают увеличение высвобождения глюкагон-подобного пептида 1 (ГПП-1) и снижение резорбции желчных кислот. Метформин изменяет кишечный микробиом.

Метформин может улучшить липидный профиль у лиц с гиперлипидемией. Кроме того, оказывает благоприятный эффект на метаболизм липидов: снижает содержание общего холестерина, липопротеинов низкой плотности и триглицеридов.

На фоне приема метформина масса тела пациента либо остается стабильной, либо умеренно снижается.

Некоторые эффекты, но не все, обусловлены активацией пути аденозинмонофосфат-протеинкиназы (АМФК) и оси кишечник-мозг-печень.

Клинические исследования показали также эффективность метформина для профилактики сахарного диабета у пациентов с предиабетом с дополнительными факторами риска развития явного сахарного диабета 2 типа, у которых изменения образа жизни не позволили достичь адекватного гликемического контроля.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После приема внутрь метформин абсорбируется из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) достаточно полно. Абсолютная биодоступность составляет 50-60 %. $C_{\max}$ (примерно 2 мкг/мл или 15 мкмоль) в плазме достигается через 2,5 часа. При одновременном приеме пищи абсорбция метформина снижается и задерживается.

Распределение

Метформин быстро распределяется в ткани, практически не связывается с белками плазмы.

Биотрансформация и элиминация

Подвергается метаболизму в очень слабой степени и выводится почками. Клиренс метформина у здоровых субъектов составляет 400 мл/мин (в 4 раза больше, чем КК), что свидетельствует о наличии активной канальцевой секреции. Период полувыведения составляет приблизительно 6,5 часов.

Особые группы пациентов

Почечная недостаточность

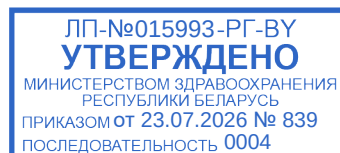
При почечной недостаточности период полувыведения возрастает, появляется риск кумуляции препарата.

5.3. Данные доклинической безопасности

Доклинические данные, основанные на стандартных фармакологических исследованиях безопасности, токсичности многократных доз, генотоксичности, канцерогенного потенциала, репродуктивной токсичности, не выявили особую опасность метформина для человека.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ



Повидон К-25;
кальция стеарат;
гипромеллоза 2208;
опадрай II белый (85F48105).

Состав опадрай II белый (85F48105):

поливиниловый спирт, частично гидролизированный,
макрогол/полиэтиленгликоль,
тальк (E553),
титана диоксид (E171).

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (блистере) для защиты от влаги при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку (блистер) из пленки поливинилхлоридной и гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги.

1 или 3 блистера вместе с листком-вкладышем помещают в пачку картонную.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить (утилизировать) в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Республика Беларусь
РУП «Белмедпрепараты»
220007, г. Минск, ул. Фабрициуса, 30,
тел./факс: (+375 17) 220 37 16,
e-mail: medic@belmedpreparaty.com

Претензии потребителей направлять по адресу держателя регистрационного удостоверения.



8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННЫХ УДОСТОВЕРЕНИЙ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Метформин доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте экспертной организации <https://www.rceth.by>.