Глюкофаж



Код АТХ:

- A10BA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Метформин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - однородная белая масса.

	1 таб.
метформина гидрохлорид	500 мг

Вспомогательные вещества: повидон - 20 мг, магния стеарат - 5.0 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 4.0 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
20 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
20 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - однородная белая масса.

	1 таб.
метформина гидрохлорид	850 мг

Вспомогательные вещества: повидон - 34 мг, магния стеарат - 8.5 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 6.8 мг.

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
20 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
20 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской с обеих сторон и гравировкой "1000" на одной стороне; на поперечном разрезе - однородная белая масса.

	1 таб.
метформина гидрохлорид	1000 мг

Вспомогательные вещества: повидон - 40 мг, магния стеарат - 10.0 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай чистый - 21 мг (гипромеллоза - 90.90%, макрогол 400 - 4.550%, макрогол 8000 - 4.550%).

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральный гипогликемический препарат из группы бигуанидов.

Глюкофаж снижает гипергликемию, не приводя к развитию гипогликемии. В отличие от производных сульфонилмочевины, не стимулирует секрецию инсулина и не оказывает гипогликемического действия у здоровых лиц.

Повышает чувствительность периферических рецепторов к инсулину и утилизацию глюкозы клетками. Снижает выработку глюкозы печенью за счет ингибирования глюконеогенеза и гликогенолиза. Задерживает всасывание глюкозы в кишечнике.

Метформин стимулирует синтез гликогена, воздействуя на гликогенсинтетазу. Увеличивает транспортную емкость всех типов мембранных переносчиков глюкозы.

Кроме того, оказывает благоприятный эффект на метаболизм липидов: снижает содержание общего холестерина, ЛПНП и ТГ.

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

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь метформин достаточно полно абсорбируется из ЖКТ. При одновременном приеме пищи абсорбция метформина снижается и задерживается. Абсолютная биодоступность составляет 50-60%. C_{max} в плазме составляет приблизительно 2 мкг/мл или 15 мкмоль и достигается через 2.5 ч.

Распределение

Метформин быстро распределяется в ткани организма. Практически не связывается с белками плазмы.

Метаболизм

В очень незначительной степени подвергается метаболизму и выводится почками.

Выведение

Клиренс метформина у здоровых лиц составляет 400 мл/мин (в 4 раза больше, чем КК), что свидетельствует об активной канальцевой секреции.

$T_{1/2}$ составляет приблизительно 6.5 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с почечной недостаточностью $T_{1/2}$ возрастает, появляется риск кумуляции метформина в организме.

Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа, особенно у пациентов с ожирением, при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок:

— у взрослых в качестве монотерапии или в сочетании с другими пероральными гипогликемическими препаратами, или с инсулином;

— у детей в возрасте 10 лет и старше в качестве монотерапии или в сочетании с инсулином.

Относится к болезням:

- Гипогликемия
- Инсулинома
- Инсульт
- Ожирение

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, диабетическая кома;

— почечная недостаточность или нарушение функции почек (КК <60 мл/мин);

— острые состояния, при которых имеется риск развития нарушения функции почек: дегидратация (при диарее, рвоте), тяжелые инфекционные заболевания, шок;

— клинические выраженные проявления острых или хронических заболеваний, которые могут привести к развитию тканевой гипоксии (в т.ч. дыхательная недостаточность, сердечная недостаточность, острый инфаркт миокарда);

— обширные хирургические операции и травмы (когда показано проведение инсулинотерапии);

— печеночная недостаточность, нарушения функции печени;

— хронический алкоголизм, острое отравление этанолом;

— беременность;

— лактацидоз (в т.ч. в анамнезе);

— период не менее 48 ч до и в течение 48 ч после проведения радиоизотопных или рентгенологических исследований с введением йодсодержащего контрастного средства;

— соблюдение гипокалорийной диеты (<1000 ккал/сут).

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов в возрасте старше 60 лет, выполняющих тяжелую физическую работу (что связано с повышенным риском развития у них лактацидоза); в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь.

Взрослые

Монотерапия и комбинированная терапия с другими пероральными гипогликемическими средствами

Обычная начальная доза составляет 500 мг или 850 мг 2-3 раза/сут после или во время приема пищи. Возможно дальнейшее постепенное увеличение дозы в зависимости от концентрации глюкозы в крови.

Поддерживающая доза препарата обычно составляет 1500-2000 мг/сут. Для уменьшения побочных явлений со стороны ЖКТ суточную дозу следует разделить на 2-3 приема. Максимальная доза составляет 3000 мг/сут, разделенная на 3 приема.

Медленное увеличение дозы может способствовать улучшению желудочно-кишечной переносимости.

Пациенты, получающие метформин в дозах 2000-3000 мг/сут, могут быть переведены на прием препарата Глюкофаж 1000 мг. Максимальная рекомендованная доза составляет 3000 мг/сут, разделенная на 3 приема.

В случае планирования перехода с приема другого гипогликемического препарата необходимо прекратить прием другого препарата и начать прием препарата Глюкофаж в дозе, указанной выше.

Комбинация с инсулином

Для достижения лучшего контроля глюкозы в крови метформин и инсулин можно применять в виде комбинированной терапии. Обычная начальная доза препарата Глюкофаж составляет 500 мг или 850 мг 2-3 раза/сут, в то время как дозу инсулина подбирают на основании концентрации глюкозы в крови.

Дети и подростки

У **детей в возрасте 10 лет и старше** Глюкофаж можно применять как в виде монотерапии, так и в сочетании с инсулином. Обычная начальная доза составляет 500 мг или 850 мг 1 раз/сут после или во время приема пищи. Через 10-15 дней дозу необходимо скорректировать на основании концентрации глюкозы крови. Максимальная суточная доза составляет 2000 мг, разделенная на 2-3 приема.

Пациенты пожилого возраста

Из-за возможного снижения функции почек дозу метформина необходимо подбирать под регулярным контролем показателей функции почек (определять содержание креатинина в сыворотке крови не менее 2-4 раз в год).

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

Побочное действие:

Определение частоты побочных эффектов: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000). Побочное действие представлено в порядке снижения значимости.

Со стороны обмена веществ: очень редко - лактацидоз; при длительном применении возможно снижение всасывания витамина B_{12}. Снижение уровня витамина B_{12} необходимо принимать во внимание у пациентов с мегалобластной анемией.

Со стороны нервной системы: часто - нарушение вкуса.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота, рвота, диарея, боли в животе, отсутствие аппетита. Наиболее часто эти симптомы возникают в начальный период лечения и в большинстве случаев спонтанно проходят. Для предотвращения симптомов рекомендуется принимать метформин 2 или 3 раза/сут во время или после приема пищи. Медленное увеличение дозы может улучшить желудочно-кишечную переносимость.

Со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко - эритема, зуд, сыпь.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко - нарушение показателей функции печени, гепатит. После отмены метформина побочные реакции полностью исчезают.

Опубликованные данные, постмаркетинговые данные, а также данные контролируемых клинических исследований в ограниченной детской популяции в возрастной группе от 10 до 16 лет показывают, что побочные эффекты у детей по характеру и тяжести схожи с таковыми у взрослых пациентов.

Передозировка:

Симптомы: при применении метформина в дозе 85 г (в 42.5 раз превышающей максимальную суточную дозу) не наблюдалось гипогликемии, однако отмечалось развитие лактацидоза.

Значительная передозировка или сопряженные факторы риска могут привести к развитию лактацидоза.

Лечение: немедленная отмена препарата Глюкофаж, срочная госпитализация, определение концентрации лактата в крови; при необходимости проводят симптоматическую терапию. Для выведения из организма лактата и метформина

наиболее эффективен гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности.

Декомпенсированный сахарный диабет при беременности связан с повышенным риском возникновения врожденных пороков и перинатальной смертности. Ограниченное количество данных свидетельствует о том, что применение метформина у беременных женщин не увеличивает риск развития врожденных пороков у детей.

При планировании беременности, а также в случае наступления беременности на фоне приема метформина, препарат должен быть отменен, и назначена инсулинотерапия. Необходимо поддерживать содержание глюкозы в плазме крови на уровне, наиболее близком к норме для снижения риска возникновения пороков развития плода.

Метформин выделяется с грудным молоком. Побочные эффекты у новорожденных 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 грудного вскармливания и потенциального риска возникновения побочных эффектов у ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказанные комбинации

Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства: на фоне функциональной почечной недостаточности у больных сахарным диабетом радиологическое исследование с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств может вызывать развитие лактацидоза. Лечение препаратом Глюкофаж необходимо отменить в зависимости от функции почек за 48 ч до или на время рентгенологического исследования с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств и не возобновлять ранее 48 ч после, при условии, что в ходе обследования почечная функция была признана нормальной.

Нерекомендуемые комбинации

Этанол - при острой алкогольной интоксикации увеличивается риск развития лактацидоза, особенно в случае:

- недостаточного питания, соблюдения низкокалорийной диеты;

- печеночной недостаточности.

Во время применения препарата следует избегать приема алкоголя и лекарственных средств, содержащих этанол.

Комбинации, требующие осторожности

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

Хлорпромазин при применении в высоких дозах (100 мг/сут) повышает концентрацию глюкозы в крови, снижая высвобождение инсулина. При лечении нейролептиками и после прекращения приема последних требуется коррекция дозы препарата под контролем концентрации глюкозы в крови.

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

Одновременный прием "петлевых" диуретиков может привести к развитию лактацидоза из-за возможной функциональной почечной недостаточности. Не следует назначать Глюкофаж, если КК менее 60 мл/мин.

Бета$_2$-адреномиметики в виде инъекций повышают концентрацию глюкозы в крови вследствие стимуляции β_2-адренорецепторов. В этом случае необходим контроль концентрации глюкозы в крови. При необходимости рекомендуется назначить инсулин.

При одновременном применении вышеперечисленных лекарственных средств может потребоваться более частый контроль содержания глюкозы в крови, особенно в начале лечения. При необходимости доза метформина может быть скорректирована в процессе лечения и после его прекращения.

Ингибиторы АПФ и другие антигипертензивные лекарственные средства могут снижать концентрацию глюкозы в крови. При необходимости следует скорректировать дозу метформина.

При одновременном применении препарата Глюкофаж с производными сульфонилмочевины, инсулином, акарбозой, салицилатами возможно развитие гипогликемии.

Нифедипин повышает абсорбцию и C_{max} метформина.

Катионные лекарственные средства (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}.

Особые указания и меры предосторожности:

Лактацидоз

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

Следует учитывать и другие сопряженные факторы риска, такие как декомпенсированный сахарный диабет, кетоз, продолжительное голодание, алкоголизм, печеночная недостаточность и любое состояние, связанное с выраженной гипоксией. Это может помочь снизить частоту случаев возникновения лактацидоза.

Следует учитывать риск развития лактацидоза при появлении неспецифических признаков, таких как мышечные судороги, сопровождающиеся диспепсическими симптомами, болью в животе и выраженной астенией. Лактацидоз характеризуется ацидотической одышкой, болью в животе и гипотермией с последующей комой.

Диагностическими лабораторными показателями являются снижение pH крови (<7.25), 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.

Хирургические операции

Применение метформина должно быть прекращено за 48 ч до проведения плановых хирургических операций и может быть продолжено не ранее чем через 48 ч после, при условии, что в ходе обследования почечная функция была признана нормальной.

Функция почек

Поскольку метформин выводится почками, перед началом лечения и регулярно в последующем, необходимо определять КК: не реже одного раза в год у пациентов с нормальной функцией почек, и 2-4 раза в год у пациентов пожилого возраста, а также у пациентов с КК на нижней границе нормы.

Следует проявлять особую осторожность при возможном нарушении функций почек у пациентов пожилого возраста, при одновременном применении антигипертензивных препаратов, диуретиков или НПВС.

Использование в педиатрии

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

В ходе клинических исследований продолжительностью 1 год было показано, что метформин не влияет на рост и половое созревание. Однако в виду 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**.

Другие меры предосторожности

Пациентам рекомендуется продолжать соблюдать диету с равномерным потреблением углеводов в течение дня. Пациентам с избыточной массой тела рекомендуется продолжать соблюдать гипокалорийную диету (но не менее 1000 ккал/сут).

Рекомендуется регулярно проводить стандартные лабораторные анализы для контроля сахарного диабета.

Метформин при монотерапии не вызывает гипогликемию, однако рекомендуется проявлять осторожность при его применении в комбинации с инсулином или другими гипогликемическими средствами (в т.ч. производными сульфонилмочевины, репаглинидом).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Монотерапия препаратом Глюкофаж не вызывает гипогликемии, поэтому не влияет на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Тем не менее, следует предостеречь пациентов о риске гипогликемии при применении метформина в сочетании с другими гипогликемическими препаратами (в т.ч. с производными сульфонилмочевины, инсулином, репаглинидом).

При нарушениях функции почек

Противопоказан при нарушениях функции почек или почечной недостаточности (КК <60 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при нарушениях функции печени, почечной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Из-за возможного снижения функции почек у пожилых пациентов дозу метформина необходимо подбирать под регулярным контролем показателей функции почек (определять содержание креатинина в сыворотке не менее 2-4 раз в год).

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов в возрасте старше 60 лет, выполняющих тяжелую физическую работу (что связано с повышенным риском развития у них лактацидоза).

Применение в детском возрасте

У детей в возрасте 10 лет и старше Глюкофаж можно применять как в виде монотерапии, так и в сочетании с инсулином. Обычная начальная доза составляет 500 мг или 850 мг 1 раз/сут после или во время приема пищи. Через 10-15 дней дозу необходимо скорректировать на основании концентрации глюкозы крови. Максимальная суточная доза составляет 2000 мг, разделенная на 2-3 приема.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Срок годности для таблеток 500 мг и 850 мг - 5 лет. Срок годности для таблеток 1000 мг - 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Glyukofazh