Глюкофаж Лонг



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 пролонгированного действия белого или почти белого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые, с гравировкой "500" на одной стороне.

	1 таб.
метформина гидрохлорид	500 мг

Вспомогательные вещества: кармеллоза натрия - 50 мг, гипромеллоза 2910 - 10 мг, гипромеллоза 2208 - 358 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 102 мг, магния стеарат - 3.5 мг.

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральный гипогликемический препарат из группы бигуанидов, снижающий как базальное, так и постпрандиальное содержание глюкозы в плазме крови. Не стимулирует секрецию инсулина и в связи с этим не вызывает гипогликемии. 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.

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

Метформин оказывает благоприятный эффект на метаболизм липидов: снижает содержание общего холестерина, ЛПНП и триглицеридов.

Фармакокинетика

Всасывание

После перорального приема препарата в форме таблетки пролонгированного действия всасывание метформина замедленно по сравнению с таблеткой с обычным высвобождением метформина. Время достижения C_{max} метформина при приеме таблеток Глюкофаж Лонг пролонгированного действия составляет 7 ч. В то же время T_{max} для таблетки с обычным высвобождением составляет 2.5 ч.

В равновесном состоянии, идентичном C_{ss} метформина в форме таблеток с обычным профилем высвобождения, C_{max} и AUC увеличиваются не пропорционально дозе. После однократного приема внутрь 2000 мг метформина в форме таблеток пролонгированного действия AUC аналогична наблюдаемой после приема 1000 мг метформина в форме таблеток с обычным высвобождением 2 раза/сут.

Колебания C_{max} и AUC у отдельных пациентов в случае приема метформина в форме таблеток пролонгированного действия аналогичны тем же показателями, как и в случае приема таблеток с обычным профилем высвобождения.

Всасывание метформина из таблеток пролонгированного действия не изменяется в зависимости от приема пищи.

Распределение

Связывание с белками плазмы незначительное. C_{max} в крови ниже C_{max} в плазме и достигается примерно через такое же время. Средний V_d колеблется в диапазоне 63-276 л.

Не наблюдается кумуляции при многократном приеме до 2000 мг метформина в форме таблеток пролонгированного действия.

Метаболизм

Метаболитов у человека не обнаружено.

Выведение

После перорального приема $T_{1/2}$ составляет около 6.5 ч. Метформин выводится в неизмененном виде почками. Почечный клиренс метформина составляет >400 мл/мин, что указывает на то, что метформин выводится за счет клубочковой фильтрации и канальцевой секреции.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При нарушенной функции почек клиренс метформина снижается пропорционально КК, увеличивается $T_{1/2}$, что может приводить к увеличению концентрации метформина в плазме.

Показания к применению:

Лечение сахарного диабета 2 типа у взрослых при неэффективности диетотерапии и физических нагрузок (особенно у пациентов с ожирением):

— в качестве монотерапии;

— в сочетании с другими пероральными гипогликемическими препаратами, или в сочетании с инсулином.

Относится к болезням:

- Гипогликемия
- Инсулинома

- Инсульт
- Ожирение

Противопоказания:

— диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома, кома;

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

— острые состояния, протекающие с риском развития нарушений функции почек, в т.ч. дегидратация (при хронической или тяжелой диарее, многократных приступах рвоты), тяжелые инфекционные заболевания (например, инфекции дыхательных и мочевыводящих путей), шок;

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

— обширные хирургические операции и травмы, когда показано проведение инсулинотерапии;

— печеночная недостаточность, нарушение функции печени;

— хронический алкоголизм, острое отравление алкоголем;

— лактацидоз (в т.ч. и в анамнезе);

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

— соблюдение гипокалорийной диеты (менее 1000 ккал/сут);

— беременность;

— детский и подростковый возраст до 18 лет в связи с отсутствием данных по применению;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

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 лактации (грудного вскармливания).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, во время ужина. Таблетки проглатывают целиком, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости.

Дозу препарата Глюкофаж Лонг следует подбирать индивидуально для каждого пациента на основании результатов измерения концентрации глюкозы в крови.

Глюкофаж Лонг следует принимать ежедневно, без перерыва. В случае прекращения лечения пациенту необходимо сообщить об этом врачу.

В случае пропуска очередной дозы следующую дозу следует принять в обычное время. Нельзя удваивать дозу препарата Глюкофаж Лонг.

Монотерапия и комбинированная терапия в сочетании с другими гипогликемическими средствами

Для пациентов, не принимающих метформин, рекомендуемая начальная доза препарата Глюкофаж Лонг составляет 500 мг (1 таб.) 1 раз/сут во время ужина.

В зависимости от содержания глюкозы в плазме крови, через каждые 10-15 дней дозу медленно увеличивают на 500 мг до максимальной суточной дозы. Медленное увеличение дозы способствует снижению побочных эффектов со стороны ЖКТ.

Максимальная суточная доза препарата Глюкофаж Лонг составляет 2000 мг (4 таб.). Если контроль содержания глюкозы не достигается при максимальной суточной дозе, принимаемой 1 раз/сут во время ужина, то можно рассмотреть возможность разделения этой дозы на несколько приемов в день по следующей схеме: 2 таб. во время завтрака и 2 таб. во время ужина.

Если адекватный контроль гликемии не достигается при применении препарата Глюкофаж Лонг в дозе 2000 мг, возможен переход на метформин в форме таблеток с обычным профилем высвобождения (например, Глюкофаж, таблетки, покрытые пленочной оболочкой) с максимальной суточной дозой 3000 мг.

Для пациентов, уже получающих лечение метформином, начальная доза препарата Глюкофаж Лонг должна быть равной суточной дозе препарата в форме таблеток с обычным профилем высвобождения.

Пациентам, принимающим метформин в форме таблеток с обычным профилем высвобождения в дозе, превышающей 2000 мг, не рекомендован переход на Глюкофаж Лонг.

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

Комбинация с инсулином

Для достижения лучшего контроля содержания глюкозы в крови метформин можно применять в комбинации с инсулином. Обычная начальная доза препарата Глюкофаж Лонг составляет 500 мг (1 таб.) 1 раз/сут во время ужина, а дозу инсулина подбирают, исходя из результатов измерения содержания глюкозы в плазме крови.

У пациентов пожилого возраста и пациентов со сниженной функцией почек дозу корректируют на основании оценки почечной функции, которую необходимо проводить регулярно, не менее 2 раз в год.

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), единичные - не могут оцениваться при имеющихся данных.

Со стороны нервной системы: часто - нарушение вкуса (металлический привкус во рту).

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

Со стороны гепатобилиарной системы: очень редко - нарушение показателей функции печени или гепатит; после отмены метформина нежелательные явления полностью исчезают.

Со стороны кожных покровов: очень редко - эритема, зуд, крапивница.

Со стороны обмена веществ: очень редко - лактацидоз. При длительном приеме метформина возможно снижение всасывания витамина B_{12}. При обнаружении мегалобластной анемии необходимо учитывать возможность такой этиологии.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или отмечаются другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, пациенту необходимо сообщить об этом врачу.

Передозировка:

Симптомы: при применении метформина в дозе 85 г (в 42.5 раз превышающей максимальную суточную дозу) развития гипогликемии не наблюдалось, однако в этом случае наблюдалось развитие лактацидоза. Значительная передозировка или сопряженные факторы риска могут привести к развитию лактацидоза.

Лечение: в случае появления признаков лактацидоза 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.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Декомпенсированый 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 применения метформина препарат следует отменить и назначить инсулинотерапию. Необходимо поддерживать концентрацию глюкозы в крови на уровне, наиболее близком к норме для снижения риска возникновения пороков развития плода.

Метформин выводится 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 кормления грудью не рекомендовано. Решение о прекращении кормления грудью следует принимать с учетом пользы грудного вскармливания и потенциального риска возникновения побочных эффектов у ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказанные комбинации

На фоне функциональной почечной недостаточности у больных сахарным диабетом радиологическое исследование с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств может вызывать развитие лактацидоза. Глюкофаж Лонг следует отменить за 48 ч до и не возобновлять ранее 48 ч после рентгенологического исследования с использованием йодсодержащих рентгеноконтрастных средств, при условии, что в ходе обследования почечная функция была признана нормальной.

Нерекомендуемые комбинации

Прием этанола повышает риск развития лактацидоза во время острой алкогольной интоксикации, особенно в случае недостаточного питания, соблюдения низкокалорийной диеты, а также печеночной недостаточности. Во время лечения не следует применять лекарственные средства, содержащие этанол.

Комбинации, требующие осторожности

Лекарственные средства с непрямым гипергликемическим действием (например, ГКС и тетракозактид для системного и местного применения), бета$_2$-адреномиметики, даназол, хлорпромазин при приеме в высоких дозах (100 мг/сут) и диуретики: может потребоваться более частый контроль концентрации глюкозы в крови, особенно в начале лечения. При необходимости доза препарата Глюкофаж Лонг может быть скорректирована в процессе лечения и после его прекращения, исходя из уровня гликемии.

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

Антигипертензивные лекарственные средства класса ингибиторов АПФ могут снижать концентрацию глюкозы в крови. При необходимости следует скорректировать дозу метформина.

При одновременном применении препарата Глюкофаж Лонг 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 крайне редким, но серьезным (высокая смертность при отсутствии неотложного лечения) осложнением, которое может возникнуть из-за кумуляции метформина. Случаи лактацидоза у пациентов, получавших метформин, возникали в основном у больных сахарным диабетом с выраженной почечной недостаточностью.

Следует учитывать и другие сопряженные факторы риска, такие как плохо контролируемый диабет, кетоз, продолжительное голодание, чрезмерное потребление алкоголя, 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 диспепсией, болью в животе, общей слабостью и сильным недомоганием.

Лактацидоз характеризуется ацидотической одышкой, рвотой, болью в животе, мышечными судорогами и гипотермией с последующей комой. Диагностическими лабораторными показателями являются снижение pH крови (<7.25), содержание лактата в плазме крови >5 ммоль/л, повышенные анионный промежуток и отношение лактат/пируват. При подозрении на лактацидоз 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 1 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 гипотензивных препаратов, диуретиков или НПВС.

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). Также пациентам следует регулярно выполнять физические упражнения.

Пациентам следует сообщать врачу о каком-либо проводимом лечении и любых инфекционных заболеваниях, таких как инфекции дыхательных и мочевыводящих путей.

Следует 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 пероральными гипогликемическими средствами (например, производными сульфонилмочевины или репаглинидом). Симптомами гипогликемии являются слабость, головная боль, головокружение, повышенное потоотделение, учащенное сердцебиение, нарушение зрения или нарушение концентрации внимания.

Необходимо предупредить пациента, что неактивные компоненты препарата Глюкофаж Лонг могут выделяться в неизмененном виде через кишечник, что не влияет на терапевтическую активность препарата.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Монотерапия препаратом Глюкофаж Лонг не вызывает гипогликемии, и поэтому не влияет на способность управлять автомобилем и работать с механизмами.

Тем не менее, следует предостеречь пациентов о риске гипогликемии при применении метформина в сочетании с другими гипогликемическими препаратами (производные сульфонилмочевины, инсулин, репаглинид).

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности или нарушении функции почек (КК менее 60 мл/мин), при острых состояниях, протекающих с риском развития нарушений функции почек, в т.ч. дегидратации (при хронической или тяжелой диарее, многократных приступах рвоты), тяжелых инфекционных заболеваниях (например, инфекции дыхательных и мочевыводящих путей), шоке.

При нарушениях функции печени

Противопоказание: печеночная недостаточность, нарушение функции печени.

Применение в пожилом возрасте

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

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет в связи с отсутствием данных по применению.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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