Метформин Лонг Канон



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки с пролонгированным высвобождением белого или почти белого цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
метформина гидрохлорид	1000 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза 2208 (гидроксипропилметилцеллюлоза 2208) - 310 мг, гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 2910 - 8.6 мг, кремния диоксид коллоидный - 15.2 мг, магния стеарат - 14 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 52.2 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
30 шт. - банки (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Пероральное гипогликемическое средство из группы бигуанидов (диметилбигуанид). Механизм действия метформина связан с его способностью подавлять глюконеогенез, а также образование свободных жирных кислот и окисление жиров. Повышает чувствительность периферических рецепторов к инсулину и утилизацию глюкозы клетками. Метформин не влияет на количество инсулина в крови, но изменяет его фармакодинамику за счет снижения соотношения связанного инсулина к свободному и повышения соотношения инсулина к проинсулину.

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

Снижает уровень триглицеридов, ЛПНП, ЛПОНП. Метформин улучшает фибринолитические свойства крови за счет подавления ингибитора активатора плазминогена тканевого типа.

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

Фармакокинетика

После приема внутрь метформин медленно и неполностью абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается примерно через 2.5 ч. При однократной дозе 500 мг абсолютная биодоступность составляет 50-60%. При одновременном приеме пищи абсорбция метформина снижается и задерживается.

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

Накапливается в слюнных железах, печени и почках.

Выводится почками в неизмененном виде. $T_{1/2}$ из плазмы составляет 2-6 ч.

При нарушениях функции почек возможна кумуляция метформина.

Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа (инсулиннезависимый) при неэффективности диетотерапии и физической нагрузки, у пациентов с ожирением: у взрослых - в качестве монотерапии или в комбинации с другими пероральными гипогликемическими средствами или с инсулином; у детей в возрасте 10 лет и старше - в качестве монотерапии или в комбинации с инсулином.

Относится к болезням:

- Гипогликемия
- Инсулинома
- Инсульт
- Ожирение

Противопоказания:

Острый или хронический метаболический ацидоз, диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома и кома; почечная недостаточность, нарушение функции почек (КК<60 мл/мин); обезвоживание организма, тяжелая инфекция, гипогликемический шок, которые могут привести к нарушению функции почек; клинически выраженные симптомы острых и хронических заболеваний, которые могут привести к развитию тканевой гипоксии (в т.ч. сердечная недостаточность, острый инфаркт миокарда, дыхательная недостаточность); применение контрастных йодсодержащих веществ для внутрисосудистого введения (в т.ч. при проведении в/в урографии, в/в холангиографии, ангиографии, КТ); острая алкогольная интоксикация, хронический алкоголизм; повышенная чувствительность к метформину.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, во время или после приема пищи.

Доза и кратность приема зависит от применяемой лекарственной формы.

При монотерапии начальная разовая доза для взрослых - 500 мг, в зависимости от применяемой лекарственной формы кратность приема - 1-3 раза/сут. Возможно применение по 850 мг 1-2 раза/сут. При необходимости дозу постепенно повышают с интервалом 1 нед. до 2-3 г/сут.

При монотерапии для детей в возрасте 10 лет и старше начальная доза составляет 500 мг или 850 1 раз/сут или 500 мг 2 раза/сут. При необходимости, с интервалом не менее 1 нед., доза может быть увеличена максимум до 2 г/сут в 2-3 приема.

Через 10-15 дней дозу необходимо скорректировать на основании результатов определения глюкозы в крови.

При комбинированной терапии с инсулином начальная доза метформина составляет 500-850 мг 2-3 раза/сут. Дозу инсулина подбирают на основании результатов определения глюкозы в крови.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: возможны (обычно в начале лечения) тошнота, рвота, диарея, метеоризм, чувство дискомфорта в животе; в единичных случаях - нарушение показателей функции печени, гепатит (исчезают после прекращения лечения).

Со стороны обмена веществ: очень редко - лактат-ацидоз (требуется прекращение лечения).

Со стороны системы кроветворения: очень редко - нарушение всасывания витамина B_{12}.

Профиль побочных реакций у детей в возрасте 10 лет и старше такой же, как у взрослых.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения метформина при беременности не проводилось. Применение при беременности возможно в случаях крайней необходимости, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает возможный риск для плода. Метформин проникает через плацентарный барьер.

Метформин в небольших количествах выделяется с грудным молоком, при этом концентрация метформина в грудном молоке может составлять 1/3 от концентрации в плазме матери. Побочные эффекты у новорожденных при грудном вскармливании на фоне приема метформина не наблюдались. Однако в связи с ограниченным количеством данных, применение 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.

В доклинических исследованиях показано, что метформин не оказывает тератогенного действия в дозах, которые в 2-3 раза превышают терапевтические дозы, применяющиеся у человека. Метформин не обладает мутагенным потенциалом, не оказывает влияния на фертильность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с производными сульфонилмочевины, акарбозой, инсулином, салицилатами, ингибиторами МАО, окситетрациклином, ингибиторами АПФ, с клофибратом, циклофосфамидом возможно усиление гипогликемического действия метформина.

При одновременном применении с ГКС, гормональными контрацептивами для приема внутрь, даназолом, эпинефрином, глюкагоном, гормонами щитовидной железы, производными фенотиазина, тиазидными диуретиками, производными никотиновой кислоты возможно уменьшение гипогликемического действия метформина.

У пациентов, получающих метформин, применение йодсодержащих контрастных веществ с целью проведения диагностических исследований (в т.ч. в/в урографии, в/в холангиографии, ангиографии, КТ) повышает риск развития острого нарушения функции почек и лактат-ацидоза. Данные комбинации противопоказаны.

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.

Одновременный прием циметидина может усилить риск развития лактат-ацидоза.

Одновременный прием "петлевых" диуретиков может привести к развитию лактат-ацидоза из-за возможной функциональной почечной недостаточности.

Про одновременном приеме с этанолом повышается риск развития лактат-ацидоза.

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:

Не рекомендуется применение при острых инфекциях, обострении хронических инфекционно-воспалительных заболеваний, травмах, острых хирургических заболеваниях, опасности дегидратации.

Не применяют перед хирургическими операциями и в течение 2 дней после их проведения.

С осторожностью следует применять метформин у пациентов пожилого возраста и лиц, выполняющих тяжелую физическую работу, что связано с повышенным риском развития молочнокислого ацидоза. У пациентов старческого возраста часто наблюдается бессимптомное нарушение функции почек. Особая осторожность требуется, если нарушение функции почек спровоцировано приемом антигипертензивных препаратов или диуретиков, а также НПВС.

Если во время лечения у пациента появились мышечные судороги, нарушение пищеварения (боли в животе) и выраженная астения, то следует иметь в виду, что эти симптомы могут свидетельствовать о начале развития лактацидоза.

В период лечения необходимо контролировать функцию почек; определение содержания лактата в плазме следует проводить не реже 2 раз в год, а также при появлении миалгии.

При применении метформина в виде монотерапии в соответствии с режимом дозирования гипогликемия, как правило, не возникает. Однако при комбинации с инсулином или с производными сульфонилмочевины имеется риск

развития гипогликемии. В таких случаях необходим особо тщательный контроль концентрации глюкозы в крови.

В период лечения пациентам следует избегать употребления алкоголя из-за риска развития лактат-ацидоза.

В доклинических исследованиях показано, что метформин не обладает канцерогенным потенциалом.

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