

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ГЛІКОМЕТ SR

(GLYCOMET SR)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: Metformin

основні фізико-хімічні властивості: таблетки з пролонгованою дією, по 500 мг – білі, овальної форми, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, гладенькі з обох боків;

таблетки з пролонгованою дією, по 1000 мг – білі, овальної форми, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з розподільчою рискою з одного боку таблетки;

склад: 1 таблетка містить метформіну гідрохлориду, еквівалентно метформіну 500 мг або 1000 мг;

допоміжні речовини:

стеаринова кислота, рафінований знебарвлений шелак, колідон 30 (повідон), аеросил 200 (колоїдний кремнію діоксид) магнію стеарат, ізопропіловий спирт, гідроксипропілметил целюлоза, гідроксипропілцелюлоза (Klucel LF), титану діоксид, пропіленгліколь, макрогол 6000, тальк очищений (Extra White), вода очищена.

Форма випуску. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою, пролонгованої дії.

Фармакотерапевтична група. Пероральні гіпоглікемізуючі засоби. Бігуаніди. Код АТС А 10В А02.

Фармакологічні властивості. Фармакодинаміка. Препарат містить метформін – гіпоглікемізуючий засіб для перорального прийому з групи бігуанідів. Знижує рівень глюкози у хворих на цукровий діабет. Механізм дії зумовлений гальмуванням всмоктування глюкози в шлунково-кишковому тракті, потенціюванням периферичної дії інсуліну внаслідок стимуляції його зв'язування з інсуліновими рецепторами, пригніченням синтезу глюкози в печінці, а також посилення анаеробного гліколізу в периферичних тканинах. Метформін, підвищуючи чутливість до ендogenousного інсуліну, зменшує гіперінсулінемію при ожирінні. Препарат знижує рівень загального холестерину і рівень тригліцеридів у плазмі крові, збільшує концентрацію вільних жирних кислот і гліцерину (посилення ліполізу). Активує процеси фібринолізу і гальмує агрегацію тромбоцитів.

Фармакокінетика. Метформін повільно вивільняється із таблеток з пролонгованою дією і повільно всмоктується в травному тракті. Біодоступність становить 50–60 %. Прийом їжі знижує ступінь всмоктування метформіну і дещо його затримує. Після одноразового прийому препарату внутрішньо в дозі 500 мг у 12 здорових добровольців максимальна концентрація метформіну в плазмі крові (C_{max}) натщесерце досягалась через 4,79±0,21 години (T_{max}) і складала 591,98 нг/мл, а площа під кривою (AUC) складала 4731,75 ± 534,22 нг/мл*год. Після їди максимальна концентрація в плазмі крові досягалась дещо пізніше - через 7,08±0,47 години і підвищувалась до 845,74±63,77 нг/мл; AUC зростала до 8699,43±686,04 нг/мл*год. Після прийому таблеток препарату у дозі 1000 мг, максимальна концентрація метформіну в плазмі крові натщесерце досягалась через 3,63±0,12 години і становила 1,25 ± 0,06 мг/мл, площа під кривою була 9,86±0,59 мг/мл*год. Після прийому після їжі T_{max} фіксувалось через 5,71±0,38 години, при цьому C_{max} визначалась на рівні 1,49±0,06 мг/мл; AUC становила 14,06±0,81 мг/мл*год.

Метформін майже не метаболізується в організмі, лише в незначній мірі зв'язується з білками плазми крові і має великий об'єм розподілу в тканинах організму. Після прийому внутрішньо біля 90 % кількості препарату, що всмоктався в шлунково-кишковому тракті, виділяється нирками протягом перших 24 годин. Кліренс метформіну у здорових осіб складає 440 мл/хв, що свідчить про його активну канальцеву секрецію; період напіввиведення (T_{1/2}) з плазми крові складає близько 9 – 12 годин.

У пацієнтів з нирковою недостатністю T_{1/2} подовжується. У таких осіб зниження ниркового кліренсу

метформіну пропорційно зменшенню кліренсу креатиніну. Тому враховуючи, що метформін виводиться в основному із сечею, при нирковій недостатності з'являється ризик кумуляції метформіну в організмі.

Показання для застосування. Цукровий діабет II типу (інсулінонезалежний), особливо при порушеннях жирового обміну, ожирінні з первинною і вторинною гіперліпопротеїнемією, коли компенсація діабету не досягається за допомогою дієти і фізичних навантажень; як монотерапія або в поєднанні з похідними сульфонілсечовини, тіазолідиндіонами.

Спосіб застосування та дози. Глікомет SR приймають внутрішньо під час або безпосередньо після їжі. Початкова доза становить 500 – 1000 мг на добу за один або два прийоми. Дозу поступово збільшують до отримання оптимального ефекту. Максимальна добова доза становить 2500 мг, яку приймають за два прийоми. При необхідності таблетки Глікомет SR у дозі 1000 мг можна ділити навпіл по розподільчій рисці, що не впливає негативно на фармакокінетику препарату. Максимальний терапевтичний ефект може досягатись через 1-2 тижні лікування, у зв'язку з чим не слід швидко збільшувати дозу препарату.

Побічна дія. Можуть спостерігатися нудота, блювання, діарея, зниження апетиту. Іноді можливі біль в епігастральній ділянці, металевий присмак у роті. У поодиноких випадках, при тривалому лікуванні, може розвинути мегалобластна анемія через порушення всмоктування вітаміну В₁₂ і фолієвої кислоти. При прийомі препарату можливий розвиток лактатацидозу, виникненню якого сприяє тканинна гіпоксія, ниркова, печінкова або серцева недостатність.

Протипоказання. Підвищена чутливість до препарату, декомпенсований цукровий діабет (кетозидоз, гіперглікемічна кома), метаболічний ацидоз, лактатацидоз, гостра та хронічна ниркова недостатність, печінкова недостатність, цироз печінки, сепсис, алкоголізм або гостре отруєння алкоголем, серцева та дихальна недостатність, гостра фаза інфаркту міокарда; тяжкі травми та хірургічні втручання (коли показана інсулінотерапія); періоди вагітності та лактації.

Передозування. При передозуванні препарату можливий розвиток лактатацидозу. При цьому відмінюють прийом препарату, за необхідності проводять симптоматичну терапію (інфузійно вводять розчин 7,5 % натрію бікарбонату), в тяжких випадках – гемодіаліз.

Особливості застосування. Під час лікування препаратом необхідно періодично контролювати рівень глюкози в крові та сечі. В період застосування препарату рекомендується періодичний контроль функції нирок та печінки. За необхідності проведення оперативного втручання, введення діагностичних контрастних засобів, прийом препарату відмінюють за 48 годин до їх проведення і відновлюють через 48 годин. При комбінованому застосуванні препарату з похідними сульфонілсечовини та інсуліном, при недостатньому харчуванні, після значного фізичного навантаження або у випадку гострої алкогольної інтоксикації можуть розвинути гіпоглікемічні стани. Гіпоглікемічні стани можуть негативно позначитись на здатності керувати транспортними засобами та працювати з потенційно небезпечними механізмами.

Безпечність та ефективність метформіну при прийомі дітьми не доведена.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При одночасному прийомі з похідними сульфонілсечовини, акарбозою, інсуліном, саліцилатами, інгібіторами MAO, окситетрацикліном, інгібіторами АПФ, з клофібратом, циклофосфамідом можливе посилення дії метформіну.

При одночасному прийомі з глюкокортикостероїдами, гормональними контрацептивами для прийому всередину, адреналіном, глюкагоном, гормонами щитовидної залози, похідними фенотіазину, тіазидними діуретиками, похідними ніотинової кислоти можливе зменшення гіпоглікемічної дії метформіну.

Одночасний прийом з циметидином може посилити ризик розвитку лактоацидозу.

Умови та термін зберігання. Зберігати у сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі 10–25°C. Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. 10 таблеток у блістері, по 3 або по 10 блістерів у картонній упаковці.

Виробник. “ЮСВ ЛІМІТЕД”, Індія.

Адреса. Б.С.Д. Марг, Гованді, Мумбаї, Індія.