ЛП-№(004050)-(РГ-RU) от 19.12.2023

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 500 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 850 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: метформин.

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 500 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 500 мг метформина (в виде гидрохлорида).

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 850 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 850 мг метформина (в виде гидрохлорида).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 500 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

На поперечном разрезе – ядро белого или почти белого цвета.

МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ, 850 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

На поперечном разрезе – ядро белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ показан к применению у взрослых, подростков и детей в возрасте от 10 лет.

- 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 средствами или с инсулином;
  - у детей с 10 лет в качестве монотерапии или в сочетании с инсулином.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

- Профилактика сахарного диабета 2 типа у пациентов с предиабетом с дополнительными факторами риска развития сахарного диабета 2 типа, у которых изменение образа жизни не позволило достичь адекватного гликемического контроля.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

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

Обычная начальная доза составляет 500 мг или 850 мг 2–3 раза в сутки.

Через каждые 10–15 дней рекомендуется корректировать дозу на основании результатов определения концентрации глюкозы в плазме крови. Медленное увеличение дозы способствует снижению нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта.

Поддерживающая доза препарата обычно составляет 1500–2000 мг/сут. Для уменьшения нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта суточную дозу следует разделить на 2–3 приема. Максимальная доза составляет 3000 мг/сут, разделенная на 3 приема.

Пациенты, принимающие метформин в дозах 2000–3000 мг/сут, могут быть переведены на прием препарата метформина в дозировке 1000 мг другого производителя. Максимальная рекомендованная доза составляет 3000 мг, разделенная на 3 приема.

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

Комбинация с инсулином

Для достижения лучшего контроля концентрации глюкозы в крови метформин и инсулин у пациентов с сахарным диабетом 2 типа можно применять в виде комбинированной терапии. Обычная начальная доза метформина составляет 500 мг или 850 мг 2-3 раза в сутки, в то время как дозу инсулина подбирают на основании концентрации глюкозы в крови.

Монотерапия при предиабете

Обычная доза составляет 1000–1700 мг в сутки, разделенная на 2 приема.

Рекомендуется регулярно проводить определение концентрации глюкозы в крови для оценки необходимости дальнейшего применения препарата.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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

Пациенты с нарушением функции почек

Метформин может применяться у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (клиренс креатинина (КК) 30–59 мл/мин) только в случае отсутствия состояний/факторов риска, которые могут увеличивать риск развития лактоацидоза. Функция почек должна оцениваться до начала терапии метформином, а затем не реже 1 раза в год. У пациентов с повышенным риском прогрессирования почечной недостаточности и у пожилых людей функцию почек следует контролировать чаще (каждые 3–6 месяцев).

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

Клиренс креатинина (мл/мин)	**Максимальная суточная доза (делится на 2-3 приема в сутки)**	**Дополнительные сведения**
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 изучить факторы, повышающие риск развития лактоацидоза (см. раздел 4.4). Начальная доза составляет половину максимальной суточной дозы.
30–44	1000 мг	
<30	–	Прием метформина противопоказан.

Дети

У детей с 10-летнего возраста препарат может применяться как в монотерапии, так и в сочетании с инсулином. Обычная начальная доза составляет 500 мг или 850 мг 1 раз в сутки. Через 10–15 дней дозу необходимо скорректировать на основании концентрации глюкозы в крови. Максимальная суточная доза составляет 2000 мг, разделенная на 2-3 приема.

Безопасность и эффективность препарата МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ у детей в возрасте от 0 до

10 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

Внутрь.

Препарат следует принимать ежедневно, без перерыва, после или во время приема пищи.

В случае прекращения лечения пациент должен сообщить об этом врачу.

4.3. Противопоказания

– Гиперчувствительность к метформину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.

– Диабетический кетоацидоз, диабетическая прекома.

– Почечная недостаточность или нарушение функции почек тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин).

– Острые состояния, протекающие с риском развития нарушения функции почек (при хронической или тяжелой диарее, многократных приступах рвоты), инфекционные заболевания тяжелой степени (например, дыхательных или мочевыводящих путей), 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, острая алкогольная интоксикация.

– Беременность.

– 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).

– Возраст до 10 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности применения в данной возрастной группе пациентов).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

– У пациентов в возрасте старше 60 лет, выполняющих тяжелую физическую работу, что связано с повышенным риском развития у них лактоацидоза.

– У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК 30–59 мл/мин).

– Период грудного вскармливания.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

– Детский возраст от 10 до 12 лет.

Особые указания

Лактоацидоз

Лактоацидоз является 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.

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.

Хирургические операции

Применение метформина должно быть прекращено 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 раз в год у пациентов с КК 45–59 мл/мин;
– каждые 3 месяца у пациентов с КК 30–44 мл/мин.

При КК менее 30 мл/мин применение препарата противопоказано.

Следует проявлять особую осторожность при возможном нарушении функций почек у пожилых пациентов, при дегидратации (хроническая или тяжелая диарея, многократные

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

приступы рвоты), при одновременном применении гипотензивных лекарственных средств, 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 при острой сердечной недостаточности с нестабильными показателями гемодинамики противопоказан.

Применение йодсодержащих рентгеноконтрастных средств

Внутрисосудистое введение йодсодержащих рентгеноконтрастных средств может привести к развитию почечной недостаточности и кумуляции метформина, что повышает риск развития лактоацидоза. Метформин необходимо отменить, в зависимости от функции почек, за 48 ч до или во время рентгенологического исследования с применением йодсодержащих рентгеноконтрастных средств, и не возобновлять прием ранее 48 ч после него, при условии, что в ходе обследования функция почек была признана нормальной.

Другие меры предосторожности

Пациентам рекомендуется продолжать соблюдать диету с равномерным употреблением 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.

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

Применение препарата рекомендовано 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/м^2;
– гестационный сахарный диабет в анамнезе;
– семейный анамнез сахарного диабета у родственников первой степени;
– повышенная концентрация триглицеридов;
– сниженная концентрация холестерина липопротеинов высокой плотности (ЛПВП);

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

– артериальная гипертензия.

Дети

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.

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. Прием метформина необходимо прекратить 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 функция почек была признана нормальной.

Нерекомендуемые комбинации

Алкоголь

При острой алкогольной интоксикации увеличивается риск развития лактоацидоза, особенно в случае:

– недостаточного питания, соблюдения низкокалорийной диеты;
– печеночной недостаточности.

Во время приема препарата следует избегать приема алкоголя и лекарственных средств, 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 метформина под контролем концентрации глюкозы в крови.

Хлорпромазин

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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 метформина 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 метформина 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 метформин, если КК ниже 60 мл/мин.

Назначаемые в виде инъекций бета$_2$-адреномиметики

Препараты данной группы повышают концентрацию глюкозы в крови вследствие стимуляции бета$_2$-адренорецепторов. В этом случае необходим контроль концентрации глюкозы в крови. При необходимости рекомендуется назначение инсулина.

При одновременном применении вышеперечисленных лекарственных средств 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 средства, (*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 применении метформина с данными препаратами возможно развитие гипогликемии.

Нифедипин

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

Катионные лекарственные средства

Амилорид, дигоксин, морфин, прокаинамид, хинидин, хинин, ранитидин, триамтерен, триметоприм и ванкомицин, секретирующиеся в почечных канальцах, конкурируют с

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

метформином за канальцевые транспортные системы и могут приводить к увеличению его C_{max}.

Субстраты транспортера органических катионов 1 и 2 (OCT1 и OCT2)

Метформин является субстратом органических транспортеров OCT1 и OCT2.

Одновременное применении метформина с:

– ингибиторами OCT1 (верапамил) может снижать эффективность гипогликемического действия метформина;

– индукторами OCT1 (рифампицин) может увеличивать абсорбцию метформина в желудочно-кишечном тракте и его эффективность;

– ингибиторами OCT2 (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 с метформином, так как возможно повышение плазменной концентрации метформина. При необходимости может быть рассмотрен вопрос о коррекции дозы метформина, так как ингибиторы/индукторы OCT могут изменять эффективность метформина.

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Декомпенсированный сахарный диабет во время беременности связан с повышенным риском возникновения врожденных пороков и перинатальной смертности. Ограниченное количество данных свидетельствует о том, что прием 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 при предиабете и сахарном диабете 2 типа, препарат должен быть отменен, и в случае сахарного диабета 2 типа назначена инсулинотерапия. Необходимо

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

поддерживать концентрацию глюкозы в плазме крови на уровне, наиболее близком к норме, для снижения риска возникновения пороков развития плода.

Лактация

Метформин проникает в грудное молоко. 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 должно быть принято с учетом пользы от грудного вскармливания и потенциального риска возникновения побочных эффектов у ребенка.

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

Монотерапия метформином 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 (производные сульфонилмочевины, инсулин, репаглинид и др.).

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота побочных эффектов оценивалась следующим образом: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10000, <1/1000); очень редко (<1/10000), частота неизвестна (частоту возникновения невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Нарушения метаболизма и питания: очень редко – лактоацидоз (см. раздел 4.4).

При длительном приеме метформина может наблюдаться снижение всасывания витамина B_{12}. При обнаружении мегалобластной анемии необходимо учитывать возможность такой этиологии.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – нарушение вкуса.

Желудочно-кишечные нарушения: очень часто – тошнота, рвота, диарея, боли в животе и отсутствие аппетита. Наиболее часто они возникают в начальный период лечения и в большинстве случаев спонтанно проходят. Для предотвращения симптомов рекомендуется принимать метформин 2 или 3 раза в день во время или после приема пищи. Медленное увеличение дозы может улучшить желудочно-кишечную переносимость.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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

Опубликованные данные, постмаркетинговые данные, а также контролируемые клинические исследования в ограниченной детской популяции в возрастной группе 10–16 лет показывают, что побочные эффекты у детей по характеру и тяжести схожи с таковыми у взрослых пациентов.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Тел.: +7 (800) 550-99-03

e-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Интернет-сайт: https://roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

При применении метформина в дозе 85 г (в 42,5 раза превышающей максимальную суточную дозу) развития гипогликемии не наблюдалось, однако в этом случае отмечалось развитие лактоацидоза (см. раздел 4.4). Симптомами лактоацидоза являются: выраженная слабость, миалгия, боль в животе, респираторные нарушения, повышенная сонливость. При тяжелом лактоацидозе отмечалось развитие артериальной гипотензии и резистентной брадиаритмии.

Лечение

В случае появления признаков лактоацидоза лечение препаратом необходимо немедленно прекратить, пациента срочно госпитализировать и, определив концентрацию лактата,

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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 снижает гипергликемию, не приводя к развитию гипогликемии. В отличие от производных сульфонилмочевины не стимулирует секрецию инсулина и не оказывает гипогликемического эффекта 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 гликогенсинтазу. Увеличивает транспортную емкость всех типов мембранных переносчиков глюкозы.

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.

Клиническая эффективность и безопасность

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 изменение образа жизни не позволило достичь адекватного гликемического контроля.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После приема внутрь метформин абсорбируется из желудочно-кишечного тракта достаточно полно. Доля не всосавшегося метформина, обнаруженного в кале, составляет 20–30 %. Процесс всасывания метформина характеризуется насыщаемостью. Предполагается, что фармакокинетика его всасывания нелинейна. C_{max} (примерно 2 мкг/мл или 15 мкмоль) в плазме крови достигается через 2,5 ч. При применении в рекомендуемых дозах равновесная концентрация метформина в плазме крови достигается в течение 24–48 ч и, как правило, не превышает 1 мкг/мл. Абсолютная биодоступность у

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

здоровых добровольцев составляет 50–60 %. При одновременном приеме пищи абсорбция метформина снижается и задерживается.

Распределение

Метформин быстро распределяется в ткани, практически не связывается с белками плазмы крови. C_{max} в крови ниже C_{max} в плазме крови и достигается примерно за то же время. Метформин проникает в эритроциты. Вероятно, эритроциты представляют собой вторичный компартмент распределения метформина. Средний объем распределения составляет 63–276 л.

Биотрансформация

Подвергается метаболизму в очень слабой степени, метаболитов в организме не обнаружено.

Элиминация

Выводится преимущественно почками в неизмененном виде. Клиренс метформина у здоровых добровольцев составляет более 400 мл/мин (в 4 раза больше, чем КК), что свидетельствует о наличии активной канальциевой секреции. Период полувыведения составляет приблизительно 6,5 часов.

Почечная недостаточность

При нарушении функции почек клиренс метформина уменьшается пропорционально КК, соответственно, период полувыведения увеличивается, концентрация метформина в плазме крови повышается, повышается риск его кумуляции.

Дети

При однократном применении в дозе 500 мг у детей фармакокинетические параметры метформина были сходны с таковыми у здоровых взрослых.

При многократном применении в дозе 500 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней у детей C_{max} и площадь под кривой «концентрация-время» (AUC_{0-t}) метформина были снижены примерно на 33 % и 40 %, соответственно, по сравнению со взрослыми пациентами с сахарным диабетом, которые получали метформин в дозе 500 мг 2 раза в сутки в течение 14 дней. Поскольку доза метформина подбирается индивидуально на основании показателей гликемического контроля, полученные данные имеют ограниченную клиническую значимость.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Ядро таблетки

Повидон К30

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

Магния стеарат

Пленочная оболочка таблетки

Гипромеллоза (оксипропилметилцеллюлоза)

Титана диоксид

Макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000, полиэтиленоксид 6000)

Или сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, титана диоксид, макрогол.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 ºС.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

10, 20, 30, 40, 50, 60 таблеток в банку полимерную из полипропилена или полиэтилена, укупоренную натягиваемой или навинчиваемой крышкой полимерной для лекарственных средств из полипропилена или полиэтилена с контролем первого вскрытия или без контроля, с уплотняющим элементом или без него.

При отсутствии уплотнителя пробки свободное пространство в банке заполняют ватой медицинской гигроскопической или амортизатором.

На банку наклеивают этикетку самоклеящуюся.

Каждую банку, 1, 2, 3, 4, 5, 6 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.12.2023 № 26177
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

Тел.: +7 (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: +7 (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата МЕТФОРМИН ВЕЛФАРМ доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» http://eec.eaeunion.org/.