



КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

SOPHAMET

СОФАМЕТ

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

SOPHAMET

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Metformin hydrochloride 500 mg в една филмирана таблетка.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирани таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Като монотерапия за лечение на пациенти с инсулин-независим диабет (стабилен диабет в зряла възраст, тип 2), без данни за кетоацидоза, в случаи, когато диетата не е достатъчна за регулиране нивото на глюкозата. Подходящ е за лечение на болни от този тип диабет, които са с наднормено тегло.

Метформин се употребява и в комбинация с други орални антидиабетични продукти или с инсулин в случаи на трудно контролиране на кръвната захар.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Метформин се прилага 2 до 3 пъти дневно по време на хранене. Дозата се назначава индивидуално от лекуващия лекар. Препоръчва се лечението да започва с постепенно повишаване на дозата.

Обикновено се започва с 1 таблетка 2 пъти дневно, сутрин и вечер. При недостатъчен ефект дозата се увеличава постепенно с по 1 таблетка седмично до достигане на 3 таблетки дневно. Препоръчителната максимална доза е 4 таблетки (2000 mg) дневно (възможен е прием сутрин и вечер по 2 таблетки). При необходимост максималната дневна доза може да достигне 6 таблетки (3 g).

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към метформин или някоя от помощните вещества; диабетна



кетацидоза и диабетна прекома; бъбречни увреждания или нарушения на бъбречната функция, бъбречна недостатъчност (креатининемия ≥ 135 ммол/л); остри състояния с опасност от увреждане на бъбречната функция като дехидратация, тежки инфекции, шок, венозно приложение на йодсъдържащи рентгеноконтрастни продукти; остри или хронични заболявания, които могат да предизвикат тъканна хипоксия като: сърдечна или респираторна недостатъчност, пресен инфаркт на миокарда, шок; чернодробна недостатъчност, остра алкохолна интоксикация, алкохолизъм.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Метформин се отделя предимно през бъбреците. При пациенти с данни за нарушена бъбречна функция и възраст над 70 години преди започване на лечение с метформин задължително трябва да се уточни състоянието на бъбречната функция.

Не се препоръчва употреба при деца.

При възрастни пациенти може да се наложи намаляване на дозата ако има повишен риск от нежелани лекарствени реакции.

При свръхдозирание и кумулиране на метформин в организма е възможна поява на лактатна ацидоза със сериозни метаболитни усложнения (с висока смъртност при липса на подходящо лечение). Лактатна ацидоза се наблюдава главно при пациенти със значителна бъбречна недостатъчност. Рискови фактори като лош контрол на диабета, кетацидоза, продължително гладуване, употреба на алкохол, чернодробна недостатъчност и хипоксия могат да доведат до тежка лактатна ацидоза. Ако има съмнение за метаболитна ацидоза метформин трябва да се спре и пациентът да се хоспитализира веднага.

Тъй като метформин се екскретира през бъбреците, серумните нива на креатинина трябва да се определят преди започване на лечението, както и периодично след това:

- най-малко веднъж годишно при пациенти с нормална бъбречна функция;
- най-малко 3-4 пъти годишно при пациенти със серумни креатининови нива на горната граница на нормата, както и при възрастни пациенти.

Намалената бъбречна функция при възрастни пациенти е честа и безсимптомна. Особено внимание е необходимо при случаите, при които бъбречната функция може да се наруши, например при започване на терапия с антихипертензивни, диуретични или нестероидни противовъзпалителни лекарства.

Тъй като венозното приложение на йодсъдържащи рентгеноконтрастни средства



може да доведе до бъбречни нарушения и натрупване на метформин, лечението с него трябва да се спре преди или по време на изследването и да се възстанови 48 часа след това при условие, че бъбречната функция е нормална.

Лечението с метформин трябва да се спре 48 часа преди операция с обща анестезия и може да се продължи не по-рано от 48 часа след това.

По време на лечението с метформин пациентите трябва да продължават диета с равномерно разпределение на въглехидратите през деня. Пациентите с наднормено тегло трябва да продължават приема на нискокалорична храна.

Метформин самостоятелно не причинява хипогликемия, но е нужно внимание, когато се използва в комбинация с инсулин или сулфанилурейни продукти.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Механизмът на действие на метформин е различен от този на сулфанилурейните продукти и комбинирано лечение с тях е възможно - необходимо е да се наблюдава нивото на кръвната захар (опасност от хипогликемия). Много лекарства намаляват ефектите на метформин. Такива са кортикостероиди, естрогени, диуретици, адреналин, инхалаторни β_2 -миметици, фенотиазини, хормони на щитовидната жлеза. Други лекарства като МАО-инхибиторите и бета-блокери повишават неговите ефекти. Едновременната употреба с циметидин може да доведе до необходимост от корекция на дозата на метформин. АСЕ-инхибиторите може да намалят нивата на кръвната глюкоза. Катионактивните лекарства (амилорид, дигоксин, морфин, прокаинамид, хинидин, ранитидин, триметоприм, ванкомицин), които се елиминират чрез тубуларна бъбречна секреция, е възможно да се конкурират с метформин за реналната тубуларна транспортна система.

Едновременната употреба на даназол и метформин не се препоръчва, тъй като даназол притежава диабетогенен ефект. Ако тази комбинация не може да бъде избегната, дозата на метформин трябва да бъде коригирана по време на лечението с даназол и след прекратяването му.

Повишен риск от лактатна ацидоза има при остра алкохолна интоксикация, особено при гладуване, лошо хранене или чернодробна недостатъчност. Да се избягва консумация на алкохол и алкохолсъдържащи медикаменти!

4.6. Употреба при бременност и кърмене

Въпреки, че изследванията при животни не са показали увреждания при



ембрионалното или феталното развитие, раждането и постнаталното развитие, не се препоръчва лечение с метформин по време на бременност. Нормални кръвни нива на глюкоза се поддържат с инсулин, за да се избягва риска от фетални малформации. Метформин се екскретира в майчиното мляко в нива, подобни на тези в плазмата. Лекарят трябва да прецени дали да спре кърменето или метформин, вземайки предвид съотношението полза/риск.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Самостоятелното лечение с метформин не предизвиква хипогликемия и поради това не оказва ефект върху способността за шофиране и работа с машини. Риск от хипогликемия обаче има когато метформин се използва в комбинация с други антидиабетични продукти. При наличие на признаци на хипогликемия трябва да се избягва извършването на тези дейности.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Обикновено се появяват през първите няколко седмици от лечението.

Стомашно-чревни реакции: загуба на апетит, метален вкус в устата, гадане, повръщане, подуване на корема, диария. Тези прояви се срещат рядко, ако таблетките се приемат по време на хранене или непосредствено след това. Симптомите са преходни и изчезват спонтанно през периода на лечението.

Кожни реакции като обрив или зачервяване на кожата са наблюдавани много рядко при някои свръхчувствителни индивиди.

При продължително лечение с метформин може да настъпи намаляване на резорбцията и недостиг на витамин В₁₂ в организма, което няма клинична значимост.

4.9. Предозиране

При свръхдозирание и кумулиране на метформин в организма е възможна поява на лактатна ацидоза. Тя се наблюдава главно при диабетици с изразена бъбречна недостатъчност. Проявява се с гадане, коремни болки, диария, бързо и повърхностно дишане, силни мускулни болки или крампи, необичайна умора, слабост или сънливост. При интоксикация метформин се диализира.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Софамет е антихипергликемичен продукт, който подобрява глюкозната толеранс



при пациенти с инсулин-независим диабет (тип 2), потискащ както базалната, така и постпрандиалната плазмена глюкоза. Механизмът на действие на метформин е различен от този на сулфанилурейните продукти. Метформин потиска чернодробната и бъбречна гликонеогенеза, намалява интестиналната абсорбция на глюкоза; подобрява чувствителността към инсулин (повишава приемането и усвояването на периферната глюкоза). Метформин стимулира анаеробната гликолиза. Метформин не предизвиква хипогликемия и не причинява хиперинсулинемия. При терапия с метформин секрецията на инсулин не се променя. Стабилизирането на инсулиновите нива и дневната продължителност на плазмено-инсулиновия отговор може да намалее. Повишава се чувствителността на периферните инсулинови рецептори. При терапия с метформин е възможно намаляване теглото на диабетичите. Метформин повлиява благоприятно липидния метаболизъм.

5.2. Фармакокинетични свойства

Метформин се резорбира бавно и непълно след орално приложение. Бионаличността при доза 500 mg перорално е 50-60%. Максималните плазмени концентрации (C_{max}) не надвишават 4 mcg/ml и се достигат след 2,5 часа (T_{max}). Стационарни (steady-state) плазмени концентрации се постигат след 24 до 48 часа и са около 1 mcg/ml. Храната намалява степента и забавя скоростта на резорбция.

Метформин се разпределя бързо в организма и не се свързва с плазмените протеини. Разпределя се в еритроцитите. Нивата на метформин в кръвта са по-ниски от тези в плазмата. Средният обем на разпределение варира между 63 и 276 L.

Метформин се екскретира непроменен с урината. Елиминира се чрез гломерулна филтрация и тубулна секреция. Терминалният полуживот на елиминиране е около 6,5 часа.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Остра (LD_{50}) орална токсичност

Острата орална токсичност на продукта е проведена върху мишки линия Н и плъхове Вистар при еднократно перорално приложение в дози 500, 1000, 1500 и 2000 mg/kg.

$LD_{50} > 2000$ на мишки

$LD_{50} > 2000$ на плъхове

Няма съществени промени в поведението и рефлексите на опитните животни в хода на наблюдението.



Получените данни от острата токсичност дават основание метформин да бъде причислен към слабо токсичните вещества при р. о. приложение върху плъхове според класификацията на Hodge и Sterner.

Остра (LD₅₀) интраперитонеална токсичност на мишки

Острата интраперитонеална токсичност на мишки е изследвана в дози 250, 500, 750 и 1000 mg/kg.

LD₅₀ = 583,4 mg/kg. Летален ефект в зависимост от приложената доза се отчита между 10 min и 4-ия час след третирането. След въвеждане на продукта се наблюдават също така клонично-тонични гърчове и тежки нарушения на дишането.

Остра (LD₅₀) интраперитонеална токсичност на плъхове

Интраперитонеалната токсичност на метформин е изпитана в дози 250, 500, 1000, 1500 и 2000 mg/kg. LD₅₀=750 mg/kg.

По време на експеримента са наблюдавани понижен мускулен тонус, клонични гърчове и смущения в дишането.

Субакутна (30-дневна) токсичност

Субакутната токсичност на метформин е изследвана върху бели плъхове Вистар по равен брой от двата пола в дози 150 и 300 mg/kg т. м, прилагани перорално в продължение на 30 дни. Получените резултати дават основание да се счита, че метформин не предизвиква токсични промени в изследваните клинично-лабораторни показатели и патологични отклонения в хистологичната структура на вътрешните органи на опитните животни в условията на проведения експеримент.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Povidone K 90 F, Cellulose microcrystalline, Sorbitol, Magnesium stearate, Opadry II 33628707 white.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са установени.

6.3. Срок на годност

3 (три) години

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява на сухо място при температура под 25 °C



6.5. Данни за опаковката

Първична опаковка

10 (десет) броя филмирани таблетки се опаковат в блистер от твърдо, прозрачно безцветно фолио и алуминиево фолио.

Вторична опаковка

5 (пет) броя блистери и листовка се поставят в единична сгъваема картонена кутия.

6.6. Препоръки при употреба

Да не се прилага след изтичане срока на годност, посочен върху опаковката! Да се съхранява на места, недостъпни за деца!

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРОИЗВОДИТЕЛЯ И ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД, България

1220 София, ул. "Илиенско шосе" N 16

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА - № 20020760/20.08.2002 г.

9. ДАТА НА ПЪРВОТО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ – 20.08.2002 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА – 12.05.2006 г.

