

盐酸二甲双胍缓释片说明书卜可®

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

服用本品时应尽量避免饮酒，本品禁止嚼碎口服，应整片吞服。

【药品名称】

通用名称：盐酸二甲双胍缓释片

商品名称：卜可

英文名称：Metformin Hydrochloride Sustained-release Tablets

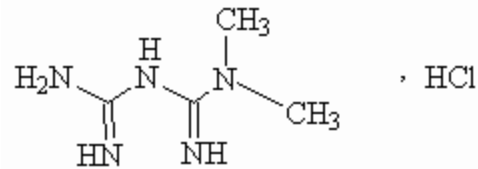
汉语拼音：Yansuan Erjiashuanggua Huanshipian

【成份】

本品主要成份为盐酸二甲双胍

化学名称：1,1-二甲基双胍盐酸盐。

化学结构式：



分子式：C₄H₁₁N₅·HCl

分子量：165.63

【性状】

本品为白色至类白色片。

【适应症】

- 1、用于单纯饮食控制不满意的 2 型糖尿病患者，尤其是肥胖者，还可能有减轻体重的作用。
- 2、对某些磺酰脲类疗效差的患者可奏效。

3、可与磺酰脲类或胰岛素合用以改善血糖控制。

【规格】

0.5g

【用法用量】

盐酸二甲双胍缓释片没有固定的剂量规定，其有效用量必须由医生根据患者个体的病情、血糖和尿糖的检查结果来决定。

盐酸二甲双胍缓释片的常用初始剂量为 0.5g/次，每日一次，晚饭时与食物同服。在病情不能得到控制时可根据病情逐渐加量，以 0.5g/周的方式增加，但每日不能超过最大剂量 2.0g。如果盐酸二甲双胍缓释片 2.0g/次，每日一次，对血糖的控制仍不满意，可考虑试用盐酸二甲双胍缓释片 1.0g/次，每日二次。

【不良反应】

本品常见的不良反应有恶心、呕吐、腹泻、口中有金属味；有时有乏力、疲倦、体重减轻、头晕、皮疹；乳酸性酸中毒虽然发生率很低，但应予以注意，其主要临床表现为呕吐、腹痛、过度换气、

神志障碍；本品还可减少肠道对维生素 B12 的吸收，使血红蛋白减少，产生巨幼红细胞性贫血。

【禁忌】

下列情况禁用：

1、2 型糖尿病伴有酮症酸中毒、肝及肾功能不全（血清肌酐超过 1.5mg/dl）、肺功能不全、心力衰竭、急性心肌梗死、严重感染和外伤、重大手术以及临床有低血压和缺氧情况。

2、糖尿病合并严重的慢性并发症（如糖尿病肾病、糖尿病眼底病变）。

- 3、进行放射性造影检查时。
- 4、酗酒者。
- 5、严重心、肺疾病患者。
- 6、维生素 B12、叶酸和铁缺乏的患者。
- 7、全身情况较差的患者（如营养不良、脱水）。

【注意事项】

1、在使用二甲双胍的病人中，二甲双胍的累积有可能导致发生乳酸性中毒。由于这是一种罕见而严重的代谢性并发症，一旦发生，会导致生命危险，因此对服用本品的患者，应进行肾功能监测同时给药应以最低有效用量为标准，从而显著降低乳酸性酸中毒的发生风险。在没有明确是否为乳酸性酸中毒之前，应暂停服用本品。乳酸性酸中毒为临床急症，应立即住院治疗。

- 2、本品禁止嚼碎口服，应整片吞服，并在进食时或餐后服用。
- 3、1 型糖尿病不应单独应用本品（可与胰岛素合用）。
- 4、用药期间须经常检查空腹血糖、尿糖及尿酮体，定期测血肌酐、血乳酸浓度。
- 5、本品与胰岛素合用会增强降血糖作用，故应调整剂量。
- 6、本品与磺酰脲类药物合用时，可引起低血糖，应监测患者血糖情况。
- 7、本品与乙醇同服时会增强盐酸二甲双胍对乳酸代谢的影响，易导致乳酸性酸中毒发生，因此，服用本品时应尽量避免饮酒。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠及哺乳期妇女不宜使用。

【儿童用药】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【老年用药】

老年患者（>65岁）慎用，因肾功能减弱，用药量宜酌减。

【药物相互作用】

- 1、与胰岛素合用，降血糖作用加强，应调整剂量。
- 2、本品可加强抗凝药（如华法林等）的抗凝血作用，可致出血倾向。
- 3、西米替丁可增加本品的生物利用度，减少肾脏清除率，故应减少本品剂量。
- 4、呋塞米增加二甲双胍血清和全血药物浓度，不改变二甲双胍肾清除率。
- 5、硝苯地平可以增加二甲双胍吸收，并使尿中排泄量增加，但不影响 T_{max} 和半衰期。

【药物过量】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药理毒理】

本品为降血糖药，可降低 2 型糖尿病患者空腹及餐后高血糖，可使 HbA_{1c} 下降 1%~2%。其降血糖的机制是：

- 1、增加周围组织对胰岛素的敏感性，增加胰岛素介导的葡萄糖利用。
- 2、增加非胰岛素依赖的组织对葡萄糖的利用，如脑、血细胞、肾髓质、肠道、皮肤等。
- 3、抑制肝糖原异生作用，降低肝糖输出。
- 4、抑制肠壁细胞摄取葡萄糖。

与胰岛素作用不同，本品无促进脂肪合成作用，对正常人无明显降血糖作用，对 2 型糖尿病单独应用时一般不引起低血糖。

文献报道，盐酸二甲双胍大鼠口服 LD₅₀ 为 1.0g/kg，皮下注射 LD₅₀ 为 0.3g/kg。

【药代动力学】

吸收 文献报道，空腹给予盐酸二甲双胍 0.5g，其绝对生物利用度约为 50%~60%，单剂量口服盐酸二甲双胍 0.5~1.5g 和 0.85~2.55g 的药代动力学研究结果表明，吸收的药量并不随剂量的增加而成比例增加。食物可减少盐酸二甲双胍吸收的程度，轻度延缓其吸收。

单剂量口服本品 1.0g，到达血药浓度峰值的时间约为 4.8 小时，血药浓度的峰值约为 1.18mg/L，比同剂量的盐酸二甲双胍片约低 0.6mg/L，但吸收程度（按 AUC 计算）与盐酸二甲双胍片相近。

20 名健康志愿者每日一次给予本品 1.0g，连续服用 7 天，均在三天内达到稳态血药浓度，平均稳态血药浓度为 0.39mg/L，谷浓度为 0.07mg/L，与每日服用两次 0.5g 的盐酸二甲双胍片相比波

动系数偏大，但盐酸二甲双胍的治疗窗较宽，不会影响本品的疗效。

分布 二甲双胍几乎不与血浆蛋白结合，可部分进入红细胞。胃肠道壁内聚集较高水平的二甲双胍，为血浆浓度的 10~100 倍；肝、肾和唾液内含量约为血浆浓度的 2 倍多。

代谢和清除 二甲双胍以原形由肾脏排泄，单次口服本品 1.0g 后， $t_{1/2}$ 约为 4.31 小时。本品重复给药后，药物在血浆中不蓄积。

【贮藏】

密封，干燥处保存。

【包装】

铝塑泡罩包装，10 片/板，1 板/盒；10 片/板，2 板/盒；10 片/板，3 板/盒；塑料瓶包装，30 片/瓶。

【有效期】

36 个月

【执行标准】

国家食品药品监督管理局标准 WS1-(X-035)-2010Z

【批准文号】

国药准字 H20041986

【生产企业】

企业名称：北京万辉双鹤药业有限责任公司

生产地址：北京市门头沟区石龙开发区上园路 1 号

邮政编码：102308

电话号码：(010) 60803846

传真号码：(010) 60803846