proLékaře.cz | 9.11.2026

História a výnimočnosť originálu metformín XR

History and uniqueness of the original metformin XR

Katarína Černá
Diabetologická ambulancia, Nemocnica akademika Ladislava Dérera, UN Bratislava

✉ **MUDr. Katarína Černá, PhD., MBA, MHA, MPH** | kce@centrum.sk | www.unb.sk
Doručené do redakcie | Received 25. 9. 2025

Metformín je podľa súčasných algoritmov liečby pacientov s diabetes mellitus 2. typu (EASD, ADA, SDS) indikovaný ako liek prvej voľby. Metformín má potenciálny kardioprotektívny a nefroprotektívny benefit. Metformín sa ako antidiabetický liek používa viac ako 100 rokov a možno ho označiť akýmsi „aspirínom" diabetológie.

História metformínu v Európe siaha až do stredoveku a týka sa používania rastliny *Galega officinalis* (jastrabina lekárska), známej ako francúzsky orgován alebo kozinec. Táto liečivá rastlina sa okrem iného používala na liečbu príznakov cukrovky u ľudí a na zvýšenie produkcie mlieka u dobytka. Antihyperglykemický účinok tejto rastliny je spôsobený účinnými látkami guanidín a galegín. Metformín bol prvýkrát vyrobený v roku 1922 v Dubline írskymi vedcami Wernerom a Bellom. Tieto objavy však zatienil objav inzulínu v roku 1921 a až v 50. rokoch 20. storočia bol znovuobjavený klinický potenciál biguanidov. V roku 1957 francúzsky lekár Jean Sterne vykonal prvé klinické skúšky s metformínom ako perorálnym antidiabetikom u ľudí. Preukázal, že zo všetkých testovaných biguanidov mal najlepší pomer rizika a prínosu. Po tomto výskume bol metformín v roku 1959 prvýkrát predaný vo Francúzsku spoločnosťou Aron Laboratories pod evokatívnou značkou „Glucophage" („pojedač glukózy"). V roku 1958 fenformín a buformín boli preferovanými antidiabetikami v Nemecku a v Spojených štátoch, avšak pre svoju toxicitu a po niekoľkých prípadoch laktátovej acidózy v roku 1976 boli stiahnuté z trhu. Incidenty s fenformínom však poškodili reputáciu metformínu, čo zabránilo rozsiahlemu používaniu v Spojených štátoch.

Multicentrická britská štúdia UKPDS (UK Prospective Diabetes Study) v roku 1977 potvrdila dôležité postavenie metformínu ako lieku voľby pre diabetes mellitus 2. typu (DM2T). Je jednou z najväčších a najvplyvnejších prelomových štúdií o DM2T. Samotná UKPDS trvala 20 rokov a následne pokračovali ďalšie analýzy ako UKPDS 80, UKPDS 81 zamerané aj na kardiovaskulárne výstupy.

Jedným z posledných sledovaní bola nedávno publikovaná štúdia UKPDS 91. Výsledky tejto analýzy potvrdzujú, že aj po 44 rokoch je postavenie metformínu nielen v liečbe DM2T, ale aj v redukcii mortality a morbidity kardiovaskulárnych ochorení nezameniteľné.

O dva roky neskôr bolo lieku Glucophage udelené francúzske ocenenie „Légion d'honneur" známka kvality a emblém bezpečnosti.

V roku 1989 sa začala štúdia BigPro, ktorá bola jednou z prvých štúdií, ktoré preukázali výhody metformínu v liečbe inzulínovej rezistencie. V roku 1995 bol Glucophage uvedený na trh v USA a následne sa stal najpoužívanejším liekom spomedzi perorálnych antidiabetík a bol vybraný do štúdie Diabetes Prevention Program (DPP).

V roku 2000 začína nové milénium a znamená uvedenie metformínu s predĺženým uvoľňovaním XR na trh. Originálny metformín s predĺženým uvoľňovaním v XR forme má tabletu vyrobenú špecifickým a patentovaným difúznym systémom **GelShield**, ktorý poskytuje pozvoľné uvoľňovanie metformínu z polymérovej matrice, a tým zabezpečuje výrazné zníženie gastrointestinálnych nežiaducich účinkov.

Jedná sa o systém na báze hydrogélu, kedy tabletka začne v žalúdku vytvárať gélovú vrstvu, ktorá má dve funkcie. **Prvou funkciou** je zväčšenie tabletky do takých rozmerov, že neprejde pylorom a tabletka zostane dlhšie v žalúdku. **Druhou funkciou** je riadené uvoľňovanie liečiva difúziou cez túto vzniknutú gélovú vrstvu, čo zaisťuje predĺžené uvoľňovanie metformínu, ktorý sa následne vstrebáva až v tenkom čreve.

Metformín patrí medzi liečivá s úzkym absorpčným oknom (duodenum a jejunum) a jeho výnimočnosť patrí práve tejto originálnej špecifickej XR liekovej forme a gastroretencii.

V poslednom období sa na našom trhu objavujú generické prípravky metformínu s predĺženým uvoľňovaním, pri ktorých môže absentovať gastroretencia, ktorá môže negatívne ovplyvniť liečbu.

proLékaře.cz | 9.11.2026

V roku 2024 Zeman a spol. publikovali komparatívnu analýzu gastroretenčných a disolučných profilov originálnych a generických tabliet s predĺženým uvoľňovaním metformínu a dospeli k záveru, že pri porovnaných generických tabletkách metformínu s predĺženým uvoľňovaním chýba buď gastroretencia alebo sa generické prípravky uvoľňujú veľmi rýchlo. To znamená, že generiká buď nemajú gastroretenčné vlastnosti, a teda nemôžeme hovoriť o predĺženom efekte, alebo ak je zabezpečená gastroretencia, metformín sa z tabletky uvoľní príliš rýchlo a v duodene a jejune sa vstrebe len obmedzené množstvo metformínu.

Originálny metformín XR s predlženým uvoľňovaním na rozdiel od niektorých generických foriem metformínu s predĺženým uvoľňovaním **poskytuje účinnú a bezpečnú liečbu**. Od roku 2010 je metformín odporúčanou prvolíniovou liečbou DM2T a v rokoch 2015–2016 boli v EÚ **zrušené kontraindikácie**, čo umožnilo ďalšej veľkej skupine pacientov so **stabilným chronickým srdcovým zlyhávaním a poruchou funkcie obličiek** profitovať z tejto liečby. V roku 2015 bola v Mexiku schválená indikácia pre metformín s pomalým uvoľňovaním pre prediabetes, v roku 2017 v Spojenom kráľovstve (referenčná krajina) a v súčasnosti je už vo viac ako v 60 krajinách sveta. Na Slovensku nie je indikácia prediabetes súčasťou platného SPC.

Ďalším významným míľnikom je rok 2021, kedy bol metformín zaradený do zoznamu esenciálnych liekov WHO.

V roku 2022 európske liekové autority schválili rozšírenie použitia metformínu aj v perikoncepčnej fáze a počas gravidity.

Relevantné medzinárodné štandardy (EASD, ADA) posúvajú metformín z prioritného postavenia lieku 1. voľby u všetkých pacientov s DM2T do pozície 1. voľby u pacientov s nízkym kardiovaskulárnym rizikom, nielen s potrebou dosiahnutia a udržania optimálnych glykemických a hmotnostných cieľov, ale aj pre priaznivý pleiotropný extraglykemický efekt spojený s priaznivou remodeláciou tukového tkaniva, s protizápalovým a antiaterotrombotickým účinkom.

Originálna lieková forma metformínu XR s predĺženým uvoľňovaním má sľubnú budúcnosť pre klinickú prax oproti konvenčným liekovým formám z hľadiska lepšej tolerability, adherencie ku liečbe a dosiahnutia lepšej glykemickej kontroly.