Амальвия



Код АТХ:

- A10BG03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пиоглитазон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "PG" на одной стороне и "15" - на другой; допускается наличие мраморности.

	1 таб.
пиоглитазон (в форме гидрохлорида)	15 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, полисорбат 80, гипролоза, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, краситель железа оксид красный.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "PG" на одной стороне и "30" - на другой; допускается наличие мраморности.

	1 таб.
пиоглитазон (в форме гидрохлорида)	30 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, полисорбат 80, гипролоза, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, краситель железа оксид красный.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемический препарат тиазолидиндионового ряда для перорального применения. Пиоглитазон стимулирует специфические гамма-рецепторы ядра, активируемые пероксисомным пролифератором (PPARγ). Модулирует транскрипцию генов, чувствительных к инсулину и участвующих в контроле концентрации глюкозы в крови и

метаболизме липидов в жировой, мышечной тканях и печени.

В отличие от препаратов, производных сульфонилмочевины, пиоглитазон не стимулирует секрецию инсулина, однако проявляет активность только при сохраненной инсулин-синтетической функции поджелудочной железы.

Пиоглитазон снижает инсулинорезистентность периферических тканей и печени, увеличивает расход инсулинозависимой глюкозы и снижает выброс глюкозы из печени; снижает концентрацию глюкозы, инсулина и гликозилированного гемоглобина. На фоне терапии пиоглитазоном снижается уровень триглицеридов и свободных жирных кислот в плазме крови, а также повышается уровень липопротеинов высокой плотности. Для пациентов с сахарным диабетом 2 типа улучшается контроль концентрации глюкозы в крови как натощак, так и после приема пищи.

Фармакокинетика

Всасывание

Пиоглитазон быстро всасывается. C_{max} пиоглитазона в плазме крови достигается обычно через 2 ч после приема внутрь. В диапазоне терапевтических доз концентрации в плазме крови пропорционально увеличиваются с увеличением дозы.

Стабильная концентрация достигается через 4-7 дней после начала терапии. При многократном приеме кумуляции препарата и его метаболитов не происходит. Прием пищи не влияет на абсорбцию. Биодоступность составляет свыше 80%.

Распределение

V_d составляет в среднем 0.63 л/кг массы тела. Связывание с белками плазмы пиоглитазона составляет более 99%, его метаболитов - более 98%.

Метаболизм

Пиоглитазон подвергается метаболизму путем гидроксилирования и окисления. Преимущественно этот процесс происходит при участии изоферментов цитохрома P450 (CYP2C8 и CYP3A4), а также, в несколько меньшей степени, других изоферментов. 3 из 6 идентифицированных метаболитов проявляют фармакологическую активность (M-II, M-III, M-IV). С учетом фармакологической активности, концентрации и степени связывания с белками плазмы, пиоглитазон и метаболит M-III в равной степени обуславливают общую эффективность, вклад метаболита M-IV в общую эффективность препарата приблизительно в 3 раза превышает вклад пиоглитазона, а относительная эффективность метаболита M-II минимальна.

Результаты исследований in vitro показали, что пиоглитазон не ингибирует изоферменты CYP1A, CYP2C8/9, CYP3A4.

Выведение

Выводится преимущественно через кишечник, а также почками (15-30%) в виде метаболитов и их конъюгатов. $T_{1/2}$ неизмененного пиоглитазона из плазмы крови составляет в среднем 3-7 ч, а для всех активных метаболитов 16-24 ч.

Концентрация пиоглитазона и активных метаболитов в плазме крови остается на достаточно высоком уровне в течение 24 ч после однократного введения суточной дозы.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Пациентам пожилого возраста и/или при нарушении функции почек коррекции доз не требуется.

На фоне нарушения функции печени фракция свободного пиоглитазона выше.

Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа в монотерапии:

— у пациентов с избыточной массой тела при неэффективности диеты и физических упражнений, а также при непереносимости метформина или наличии противопоказаний к его применению;

Сахарный диабет 2 типа в составе комбинированной терапии:

— с метформином у пациентов с избыточной массой тела при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне монотерапии метформином;

— с производными сульфонилмочевины только для пациентов, которым противопоказан метформин, при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне монотерапии производными сульфонилмочевины;

— с метформином и производными сульфонилмочевины при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне комбинации пиоглитазона с одним из указанных выше гипогликемических средств.

Пиоглитазон показан в комбинации с инсулином для лечения сахарного диабета 2 типа у пациентов при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне терапии инсулином и для которых метформин противопоказан.

Относится к болезням:

- Инсулинома
- Инсульт

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа;

— диабетический кетоацидоз;

— тяжелая сердечная недостаточность, в т.ч. в анамнезе (III и IV класс по классификации NYHA);

— печеночная недостаточность (повышение активности трансаминаз в 2.5 раза выше ВГН);

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский возраст до 18 лет (клинические исследования безопасности и эффективности применения пиоглитазона у детей не проводились);

— повышенная чувствительность к пиоглитазону или к другим компонентам препарата;

В связи с отсутствием данных о применении пиоглитазона у пациентов с почечной недостаточностью, получающих лечение гемодиализом, его не следует применять у этой группы пациентов.

С *осторожностью* следует применять препарат при отечном синдроме, анемии, сердечной недостаточности (I и II класс по классификации NYHA), нарушении функции печени.

Способ применения и дозы:

Внутрь 1 раз/сут независимо от приема пищи.

Рекомендуемые начальные дозы составляют 15 или 30 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза при монотерапии - 45 мг, при комбинированной терапии - 30 мг.

При назначении пиоглитазона *в комбинации с метформином*, прием метформина можно продолжить в той же дозе. Риск развития гипогликемии при данной комбинации незначителен, поэтому маловероятна необходимость коррекции дозы метформина.

При назначении пиоглитазона *в комбинации с производными сульфонилмочевины* в начале лечения их прием может быть продолжен в той же дозе. В случае развития гипогликемии, дозу производного сульфонилмочевины рекомендуется уменьшить.

При назначении пиоглитазона *в комбинации с инсулином* начальная доза пиоглитазона - 15-30 мг/сут, доза инсулина остается прежней или снижается на 10-25% при возникновении гипогликемии.

Для **пожилых пациентов** коррекции дозы не требуется.

Для **пациентов с нарушением функции почек (КК более 4 мл/мин)** коррекции дозы не требуется.

Не следует применять пиоглитазон у **пациентов с тяжелым нарушением функции печени**.

Нет данных о применении пиоглитазона у **пациентов в возрасте до 18 лет**, поэтому применение пиоглитазона у указанной возрастной группы не рекомендуется.

Побочное действие:

Частота развития побочных эффектов классифицирована следующим образом: очень часто (≥10%); часто (≥1% и < 10%); иногда (≥0.1% и <1%); редко (≥0.01% и <0.1%); очень редко (<0.01%, включая единичные случаи).

Монотерапия пиоглитазоном

Со стороны нервной системы: часто - гипестезия; иногда - бессонница.

Со стороны организма в целом: часто - увличение массы тела.

Инфекции и инвазии: часто - инфекции верхних дыхательных путей; иногда - синусит.

Со стороны органа зрения: часто - нарушения зрения.

Пиоглитазон в комбинации с метформином

Со стороны системы кроветворения: часто - анемия.

Со стороны органа зрения: часто - нарушения зрения.

Со стороны пищеварительной системы: иногда - метеоризм.

Со стороны организма в целом: часто - повышение массы тела.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия, миалгия.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - гематурия.

Со стороны половой системы: часто - эректильная дисфункция.

Пиоглитазон в комбинации с производными сульфонилмочевины

Со стороны органов слуха и равновесия: иногда - головокружение.

Со стороны органа зрения: иногда - нарушения зрения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - метеоризм.

Со стороны организма в целом: часто - повышение массы тела; иногда - слабость.

Со стороны лабораторных показателей: повышение активности ЛДГ в плазме крови.

Со стороны обмена веществ: иногда - повышение аппетита, гипогликемия.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение; иногда - головная боль.

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - глюкозурия, протеинурия.

Со стороны кожного покрова: иногда - гипергидроз.

Пиоглитазон в комбинации с метформином и производными сульфонилмочевины

Со стороны лабораторных показателей: повышение активности АЛТ, КФК, снижение гематокрита и гемоглобина.

Со стороны обмена веществ: очень часто - гипогликемия.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия, миалгия.

Пиоглитазон в комбинации с инсулином

Со стороны обмена веществ: часто - гипогликемия.

Со стороны организма в целом: очень часто - отеки; часто - повышение массы тела.

Инфекции и инвазии: часто - бронхит.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - боль в спине, артралгия.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - сердечная недостаточность.

При длительном применении пиоглитазона свыше 1 года в 6-9% случаях у пациентов наблюдаются отеки, слабо или

умеренно выраженные и обычно не требующие отмены терапии.

Расстройства зрения проявляются преимущественно в начале терапии и связаны с изменением концентрации глюкозы в плазме крови, как и при приеме других гипогликемических средств.

Передозировка:

Передозировка пиоглитазоном при монотерапии не сопровождается возникновением специфических клинических симптомов. Возможна гипогликемия при приеме пиоглитазона в комбинации с производными сульфонилмочевины и инсулина.

Лечение: проводят симптоматическую терапию.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Эффективность и безопасность применения пиоглитазона при беременности не изучалась, поэтому применять препарат беременным женщинам противопоказано. Было доказано, что пиоглитазон замедляет рост плода.

Неизвестно, выводится ли пиоглитазон с грудным молоком, поэтому препарат не следует принимать женщинам в период грудного вскармливания. При необходимости назначения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При применении пиоглитазона в комбинации пероральными гипогликемическими препаратами возможно развитие гипогликемии. В этом случае может потребоваться снижение дозы сопутствующего препарата.

На фоне комбинированного применения пиоглитазона с инсулином возможно развитие сердечной недостаточности.

Пиоглитазон не влияет на фармакокинетику и фармакодинамику глипизида, дигоксина, варфарина, метформина.

Гемфиброзил повышает значение AUC пиоглитазона в 3 раза.

Рифампицин ускоряет метаболизм пиоглитазона на 54%.

In vitro кетоконазол ингибирует метаболизм пиоглитазона.

При совместном применении с пероральными контрацептивами, содержащими этинилэстрадиол и/или норэтистерон, возможно снижение эффективности последних.

Особые указания и меры предосторожности:

При проведении терапии сахарного диабета 2 типа помимо приема пиоглитазона рекомендуется придерживаться диеты и выполнять физические упражнения для поддержания эффективности лекарственной терапии, а также в связи с возможным повышением массы тела.

На фоне применения пиоглитазона возможна задержка жидкости и увеличение объема плазмы, что может вызвать развитие сердечной недостаточности, следовательно, при ухудшении состояния сердечно-сосудистой системы следует прекратить прием пиоглитазона.

Перед началом и во время терапии пиоглитазоном рекомендуется контролировать активность трансаминаз каждые 2 месяца в течение первых 12 месяцев приема, и далее периодически. При повышении активности АЛТ более чем в 2.5 раза выше ВГН, или наличии других показателей нарушений функции печени/заболеваний печени, не следует начинать терапию пиоглитазоном.

Если на фоне терапии пиоглитазоном активность АЛТ в сыворотке крови повышается более чем в 3 раза выше ВГН, следует провести повторный анализ активности трансаминаз в сыворотке крови в кратчайшие сроки и при подтверждении показателя отменить пиоглитазон. При развитии симптомов, предполагающих нарушение функции печени (необъяснимая тошнота, рвота, боль в абдоминальной области, утомляемость, анорексия, потемнение мочи), возможность продолжения терапии следует согласовать с врачом в зависимости от лабораторных показателей. При развитии желтухи следует прекратить терапию пиоглитазоном.

У пациентов с инсулинорезистентностью и ановуляторным циклом в пременопаузном периоде лечение тиазолидиндионами, включая пиоглитазон, может вызвать возникновение овуляции. Следствием улучшения чувствительности этих пациентов к инсулину является риск возникновения беременности, если не используются

адекватные средства контрацепции. При наступлении или планировании беременности следует прекратить терапию пиоглитазоном.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных о влиянии пиоглитазона на способности к управлению транспортом или другими механизмами.

При нарушениях функции почек

В связи с отсутствием данных о применении пиоглитазона у пациентов с почечной недостаточностью, получающих лечение гемодиализом, его не следует применять у этой группы пациентов.

При нарушениях функции печени

Противопоказано: печеночная недостаточность (повышение активности трансаминаз в 2.5 раза выше ВГН).

Применение в пожилом возрасте

Для **пожилых пациентов** коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский возраст до 18 лет (клинические исследования безопасности и эффективности применения пиоглитазона у детей не проводились).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Amalviya