

## Авандия



### Код АТХ:

- [A10BG](#)

### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Росиглитазон](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Фармакотерапевтическая группа:

- [Метаболики](#)

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Пероральное гипогликемическое средство из группы тиазолидиндионов. Является селективным агонистом ядерных рецепторов PPAR $\gamma$  (peroxisomal proliferator activated gamma). Росиглитазон снижает содержание глюкозы в крови, повышая чувствительность к инсулину жировой ткани, скелетных мышц и ткани печени, улучшает течение метаболических процессов, снижает уровень глюкозы, инсулина и свободных жирных кислот в крови.

Способствует сохранению функции  $\beta$ -клеток, о чем свидетельствует увеличение массы островков Лангерганса в поджелудочной железе и содержания инсулина, предупреждает развитие выраженной гипергликемии. Установлено также, что росиглитазон значительно замедляет развитие почечной дисфункции и систолической артериальной гипертензии. Не стимулирует секрецию инсулина поджелудочной железой и не вызывает гипогликемию.

В соответствии с механизмом действия росиглитазона улучшение гликемического контроля сопровождается клинически значимым снижением уровня инсулина в сыворотке крови. Уменьшается также продукция предшественников инсулина, которые считаются факторами риска развития заболеваний сердечно-сосудистой системы.

На фоне применения росиглитазона наблюдается снижение содержания свободных жирных кислот в крови.

#### Фармакокинетика

После приема внутрь в дозах 4 мг или 8 мг абсолютная биодоступность росиглитазона составляет около 99%.  $C_{max}$  росиглитазона в плазме крови достигается в течение 1 ч. В пределах диапазона терапевтических доз плазменные концентрации приблизительно пропорциональны дозе. Прием с пищей не вызывает изменений значений AUC, хотя наблюдается небольшое снижение  $C_{max}$  (приблизительно на 20-28%) и увеличение времени ее достижения до 1.75 ч, по сравнению с приемом натощак. Эти небольшие изменения не являются клинически значимыми. Абсорбция росиглитазона не нарушается при повышении pH желудочного секрета.

Связывание с белками крови высокое (около 99.8%) и не зависит от концентрации росиглитазона в плазме крови или возраста пациента.

$V_d$  росиглитазона у здоровых добровольцев составляет приблизительно 14 л. При кратности приема 1-2 раза/сут росиглитазон не кумулирует.

Кумуляция метаболитов в сыворотке крови ожидается при повторных приемах препарата, в большей степени накапливается основной метаболит (пара-гидрокисульфат), для которого можно ожидать 5-кратное увеличение концентрации.

Росиглитазон подвергается интенсивному метаболизму преимущественно путем N-деметилирования и гидроксилирования с последующей конъюгацией с сульфатом и глюкуроновой кислотой. Метаболиты росиглитазона не обладают клинически значимой активностью.

Росиглитазон метаболизируется главным образом при участии изофермента CYP2C8 и, в небольшой степени, при участии CYP2C9.

В исследовании *in vivo* с варфарином было показано, что росиглитазон не взаимодействует с субстратами CYP2C9.

Конечный  $T_{1/2}$  составляет около 3-4 ч. Общий плазменный клиренс - около 3 л/ч.

Выводится в виде метаболитов, главным образом почками - приблизительно 2/3 принятой дозы, с калом - около 25%.

$T_{1/2}$  меченого росиглитазона составляет около 130 ч, что свидетельствует об очень медленном выведении метаболитов.

У пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции печени  $C_{max}$  препарата в плазме крови и AUC повышались в 2-3 раза, что соответственно было обусловлено снижением степени связывания с белками плазмы крови и уменьшением клиренса росиглитазона.

Клинически значимые различия фармакокинетики препарата у пациентов с заболеваниями почек или при почечной недостаточности в терминальной стадии, находящихся на гемодиализе, отсутствуют.

## Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа: в качестве монотерапии при недостаточной эффективности диетотерапии и физических нагрузок; в комбинации с производными сульфонилмочевины, метформином или инсулином с целью улучшения контроля гликемии; в комбинации с производными сульфонилмочевины и метформином (тройная комбинированная терапия) с целью улучшения контроля гликемии.

## Относится к болезням:

- [Инсулинома](#)
- [Инсульт](#)

## Противопоказания:

Сахарный диабет 1 типа (в отсутствии инсулина росиглитазон неэффективен); умеренные или тяжелые нарушения функции печени; беременность; период лактации; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к росиглитазону.

## Способ применения и дозы:

Дозу препарата и схему лечения устанавливают индивидуально. Суточную дозу принимают в 1-2 приема, независимо от приема пищи.

Для взрослых рекомендуемая начальная доза составляет 4 мг/сут. При необходимости, в соответствии со схемой лечения, дозу можно увеличить до 8 мг/сут.

## Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: возможны незначительная гиперхолестеринемия, отеки.

*Со стороны системы кроветворения:* редко - анемия.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* возможны периферические отеки, сердечная недостаточность (особенно у пациентов более старшего возраста с длительным течением сахарного диабета и получавших росиглитазон в дозе 8 мг/сут); редко - застойная сердечная недостаточность и отек легких.

*Со стороны пищеварительной системы:* редко - повышение активности печеночных ферментов (причинная связь не доказана).

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Противопоказан при беременности, в период лактации.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

При одновременном применении росиглитазона с производными сульфонилмочевины вследствие различных дополняющих друг друга механизмов действия наблюдается синергизм гипогликемического действия у пациентов с сахарным диабетом 2 типа.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

С осторожностью следует применять росиглитазон при тяжелой сердечной недостаточности, тяжелой почечной недостаточности.

Тиазолидиндионы могут вызывать задержку жидкости, что может привести к развитию хронической сердечной недостаточности, поэтому в случае риска развития сердечной недостаточности пациентам требуется соответствующее наблюдение.

Росиглитазон можно применять у пациентов с тяжелой сердечной недостаточностью (III и IV функциональные классы по классификации NYHA) в случаях, когда потенциальная польза терапии превосходит возможный риск.

В связи с немногочисленными данными по применению у пациентов с умеренными или тяжелыми нарушениями функции печени и выявленными изменениями фармакокинетического профиля, росиглитазон противопоказан у данной категории пациентов (класс В и С - более 6 баллов по шкале Чайлд-Пью).

### ***При нарушениях функции почек***

С осторожностью следует применять росиглитазон при тяжелой почечной недостаточности.

### ***При нарушениях функции печени***

Противопоказан при умеренных или тяжелых нарушениях функции печени.

### ***Применение в детском возрасте***

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Avandiya>