Диаглитазон



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого с кремоватым или желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

	1 таб.
пиоглитазона гидрохлорид	16.53 мг,
что соответствует содержанию пиоглитазона	15 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза), кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Таблетки белого с кремоватым или желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

	1 таб.
пиоглитазона гидрохлорид	33.06 мг,
что соответствует содержанию пиоглитазона	30 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза (гидроксипропилцеллюлолоза), кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемический препарат для приема внутрь, производное тиазолидиндионового ряда. Селективно стимулирует γ-рецепторы, активируемые пероксисомным пролифератором (PPARγ). PPARγ-рецепторы обнаруживаются в тканях, играющих важную роль в механизме действия инсулина (жировой, скелетной мышечной ткани и в печени). Активация ядерных рецепторов PPARγ модулирует транскрипцию ряда генов, чувствительных к инсулину, участвующих в контроле концентрации глюкозы в крови и в метаболизме липидов. Снижая инсулинорезистентность, увеличивает расход инсулинозависимой глюкозы и снижает выброс глюкозы из печени. Снижает уровень триглицеридов, увеличивает концентрацию ЛПВП и холестерина. В отличие от производных сульфонилмочевины, не стимулирует секрецию инсулина.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь абсорбция высокая. Пиоглитазон обнаруживается в плазме крови через 30 мин. C_{max} в плазме крови достигается через 2 ч, после приема пищи - через 3-4 ч.

Распределение и метаболизм

V_d составляет 0.22-1.04 л/кг. Связывание с белками плазмы - 99%.

Концентрация в плазме общего пиоглитазона (пиоглитазон с активными метаболитами) достигается через 24 ч при ежедневном однократном применении. C_{ss} в плазме и пиоглитазона и общего пиоглитазона достигается через 7 дней.

Интенсивно метаболизируется путем гидроксилирования и окисления. Метаболиты также частично превращаются в глюкуронидные или сульфатные конъюгаты. Метаболиты M-II и M-IV (производные пиоглитазона гидроксида) и M-III (кетопроизводные пиоглитазона) проявляют фармакологическую активность. Основные изоферменты цитохрома P450, участвующие в печеночном метаболизме - CYP2C8 и CYP3A4. Метаболизм осуществляется и с участием множества других изоферментов, включая в основном внепеченочный изофермент CYP1A1.

Выведение

$T_{1/2}$ пиоглитазона и общего пиоглитазона составляет 3-7 ч и 16-24 ч соответственно.

Выводится преимущественно с желчью в неизмененном виде или в виде метаболитов и удаляется с калом: почками - 15-30% в виде метаболитов и их конъюгатов.

Показания к применению:

Сахарный диабет 2 типа (инсулиннезависимый):

— в качестве монотерапии;

— в комбинации с производными сульфонилмочевины, метформином или инсулином в тех случаях, когда диета, физические упражнения и назначение монотерапии одним из указанных выше гипогликемических средств не позволяют достичь адекватного гликемического контроля.

Относится к болезням:

- Гипогликемия
- Инсулинома
- Инсульт

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа (инсулинзависимый);

— диабетический кетоацидоз;

— сердечная недостаточность III-IV функционального класса (по классификации NYHA);

— тяжелая печеночная недостаточность (повышение активности ферментов печени 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 компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при отечном синдроме, анемии, сердечной недостаточности I-II функционального класса, нарушениях функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз в 1-2.5 раза выше ВГН).

Способ применения и дозы:

Диаглитазон назначают внутрь, 1 раз/сут (независимо от приема пищи).

При монотерапии доза составляет 15-30 мг; максимальная суточная доза - 45 мг.

При комбинированной терапии с производными сульфонилмочевины или с метформином лечение пиоглитазоном

начинают с приема 15 мг или 30 мг (при возникновении гипогликемии снижают дозу препаратов сульфонилмочевины или метформина).

При лечении в комбинации с инсулином начальная доза - 15-30 мг/сут. Дозу инсулина оставляют прежней или снижают на 10-25% (в случае, если пациент сообщает о гипогликемии, или концентрация глюкозы в плазме снижается до уровня менее 100 мг/дл).

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, гипестезия, бессонница.

Со стороны органов чувств: расстройства зрения, которые отмечаются преимущественно в начале терапии и связаны с изменением уровня глюкозы в плазме крови, как и при приеме других гипогликемических средств.

Со стороны дыхательной системы: фарингит, синусит.

Со стороны обмена веществ: увеличение массы тела, повышение активности КФК; при длительном применении более 1 года в 6-9% случаях наблюдаются отеки, слабо или умеренно выраженные и обычно не требующие отмены терапии.

Со стороны эндокринной системы: гипогликемия.

Со стороны системы кроветворения: клинически незначимое снижение гематокрита и гемоглобина, анемия.

Со стороны пищеварительной системы: метеоризм, повышение активности АЛТ.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия.

Прочие: редко - сердечная недостаточность.

Передозировка:

Симптомы: передозировка пиоглитазоном при монотерапии не сопровождается возникновением специфических клинических симптомов; передозировка пиоглитазоном в сочетании с препаратом сульфонилмочевины может сопровождаться развитием симптомов гипогликемии.

Лечение: специфического лечения передозировки не существует. При необходимости проводится симптоматическая терапия (например, лечение гипогликемии).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакокинетических исследований по совместному применению пиоглитазона и пероральных контрацептивов не проводилось.

Применение других тиазолидиндионов совместно с пероральнымим контрацептивами, содержащими этинилэстрадиол или норэтистерон, сопровождалось снижением на 30% концентрации обоих гормонов в плазме, что может приводить к значительному снижению контрацептивного эффекта.

Поэтому следует соблюдать осторожность при совместном применении пиоглитазона и пероральных контрацептивов.

Не отмечается изменений фармакокинетики при одновременном приеме с глипизидом, дигоксином, варфарином, метформином.

В исследованиях in vitro обнаружено, что кетоконазол значительно подавляет метаболизм пиоглитазона. Следует проводить более тщательный контроль уровня глюкозы крови у пациентов, получающих одновременно пиоглитазон и кетоконазол.

Нет данных о применении пиоглитазона в тройной комбинации с другими пероральными гипогликемическими препаратами.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов, получающих пиоглитазон в комбинации с инсулином или пероральными гипогликемическими средствами, имеется риск развития гипогликемических состояний. В этом случае может быть необходимо снижение дозы совместно применяемых гипогликемических препаратов.

У пациенток с инсулинорезистентностью и ановуляторным циклом в пременопаузном периоде лечение тиазолидиндионами, включая пиоглитазон, может вызвать возникновение овуляции. Следствием улучшения чувствительности этих больных к инсулину является риск возникновения беременности, если не используются адекватные средства контрацепции. При наступлении или планировании беременности следует прекратить терапию пиоглитазоном.

Применение пиоглитазона может вызвать снижение показателей гемоглобина и гематокрита. Эти изменения могут быть связаны с увеличением объема плазмы и не связаны с другими значительными гематологическими клиническими эффектами.

В доклинических исследованиях тиазолидиндионы, включая пиоглитазон, вызывали увеличение объема плазмы и развитие гипертрофии сердечной мышцы (вследствие преднагрузки). В клинических исследованиях, из которых были исключены пациенты с сердечной недостаточностью III и IV функционального класса (по классификации NYHA), не было выявлено увеличения частоты серьезных побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы, потенциально связанных с увеличением объема плазмы (например, хроническая сердечная недостаточность).

Рекомендуется во время терапии пиоглитазоном проводить регулярный контроль активности печеночных ферментов в крови. Содержание АЛТ необходимо определять у всех пациентов до начала терапии пиоглитазоном, каждые 2 месяца в течение первого года лечения и периодически в течение последующих лет приема препарата. Также следует проводить определение функции печени у пациентов при возникновении симптомов, подозрительных на симптомы печеночной недостаточности (тошнота, рвота, боль в животе, слабость, анорексия, темная моча). Решение о возможности дальнейшего применения пиоглитазона должно основываться на показателях лабораторных тестов. При развитии желтухи следует прекратить применение препарата.

Терапию пиоглитазоном не следует начинать у пациентов с активными заболеваниями печени, или при повышении показателей АЛТ более чем в 2.5 раза выше нормы. У пациентов с исходным незначительным повышением АЛТ (в 1-2.5 раз больше нормы) или в любое время при проведении терапии пиоглитазоном следует провести обследование с целью выявления причин повышения активности печеночных ферментов. Начало или продолжение терапии пиоглитазоном у пациентов с незначительным повышением активности печеночных ферментов может проводиться с осторожностью, при этом необходимо более часто проверять активность печеночных трансаминаз. Если произошло повышение активности печеночных трансаминаз (АЛТ > 2.5 раз выше нормы), следует проводить определение активности печеночных ферментов более часто до тех пор, пока показатели не снизятся до нормальных и исходных до терапии. Если уровень АЛТ более чем в 3 раза выше нормальных показателей, следует выполнить определение лабораторных тестов как можно скорее. Если показатели АЛТ остаются более чем в 3 раза выше нормальных или если у пациента возникла желтуха, следует прекратить применение пиоглитазона.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных о влиянии пиоглитазона на способность к управлению автотранспортом и другими механизмами.

При нарушениях функции печени

Противопоказание: тяжелая печеночная недостаточность (повышение активности ферментов печени в 2.5 раза выше ВГН).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: 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, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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