Пиоуно



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки	**1 таб.**
пиоглитазон	15 мг

15 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Таблетки	**1 таб.**
пиоглитазон	30 мг

15 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Таблетки	**1 таб.**
пиоглитазон	15 мг

15 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гипогликемическое средство 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 концентрация триглицеридов и свободных жирных кислот в плазме крови, а также повышается концентрация 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. При многократном приеме кумуляции пиоглитазона и его метаболитов не происходит. Прием пищи не влияет на абсорбцию. Биодоступность составляет свыше 80%.

Распределение

V_d составляет 0.25 л/кг массы тела и достигается через 4-7 дней после начала терапии. 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 (M) 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 обусловливают общую активность, вклад метаболита M-IVв общую активность препарата приблизительно в 3 раза превышает вклад пиоглитазона, а относительная активность 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 при непереносимости метформина или наличии противопоказаний к его применению;

— в составе комбинированной терапии:

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

2. с производными сульфонилмочевины только у пациентов, которым противопоказан метформин, при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне монотерапии производными сульфонилмочевины.

3. с инсулином при отсутствии адекватного гликемического контроля на фоне терапии инсулином у пациентов, которым метформин противопоказан.

Относится к болезням:

- Инсулинома
- Инсульт

Противопоказания:

— сахарный диабет 1 типа;

— диабетический кетоацидоз;

— сердечная недостаточность, в т.ч. в анамнезе (I-IVкласса по классификации NYHA);

— печеночная недостаточность (повышение активности печеночных ферментов в 2.5 раза выше верхней границы нормы);

— хроническая почечная недостаточность (КК менее 4 мл/мин);

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к пноглитазону или к другим компонентам препарата.

С **осторожностью** - отечный синдром, анемия.

Применение при беременности и в период лактации. Эффективность и безопасность пиоглитазона у беременных женщин не изучалась, поэтому применять препарат при беременности противопоказано. Было доказано, что пиоглитазон замедляет рост плода. Неизвестно, выводится ли пиоглитазон с грудным молоком, поэтому препарат не следует принимать женщинам в период лактации. При необходимости назначения препарата в период лактации, грудное вскармливание следует прекратить.

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.

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.

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 (клиренс креатинина более 4 мл/мин)** коррекции дозы не требуется. О применении пиоглитазона у **пациентов, получающих лечение гемодиализом**, данных нет. Поэтому, не следует применять пиоглитазон у этой группы пациентов.

Не следует применять пиоглитазон у **пациентов с 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: очень часто - более 1/10, часто - более 1/100 и менее 1/10, нечасто - более 1/1000 и менее 1/100, редко - более 1/10 000 и менее 1/1000, очень редко - менее 1/10 000, включая отдельные сообщения.

Монотерапия пиоглитазоном

Со стороны органов чувств: часто - нарушение зрения.

Со стороны дыхательной системы: часто - инфекции верхних дыхательных путей; нечасто - синусит.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение массы тела.

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

Комбинация пиоглитазона с метформином

Со стороны органов кроветворения: часто - анемия.

Со стороны органов чувств: часто - нарушение зрения.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - метеоризм.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение массы тела.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль.

Со стороны мочеполовой системы: часто - гематурия, эректильная дисфункция.

Комбинация пиоглитазона с производными сульфонилмочевины

Со стороны органов чувств: нечасто - вертиго, нарушение зрения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - метеоризм.

Прочие: нечасто - усталость.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение массы тела; нечасто - повышение активности лактатдегидрогеназы, повышение аппетита, гипогликемия.

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

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - глюкозурия, протеинурия.

Со стороны кожных покровов: нечасто - повышенное потоотделение.

Комбинация пиоглнтазона с метформином и производными сульфонилмочевины

Со стороны обмена веществ: очень часто - гипогликемия; часто - повышение массы тела, повышение активности креатинфосфокиназы (КФК).

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия.

Комбинация пиоглитазона с инсулином

Со стороны обмена веществ: часто - гипогликемия.

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

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка, бронхит.

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

Прочие: очень часто - отеки.

Постмаркетинговый опыт

Со стороны органов чувств: частота неизвестна - отек макулы, перелом костей.

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:

Симптомы: возможна гипогликемия при приеме пиоглитазона в комбинации с производными сульфонилмочевины и инсулина.

Лечение: симптоматическая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При применении пиоглитазона в комбинации с другими пероральными гипогликемическимн препаратами возможно развитие гипогликемии. В этом случае может потребоваться снижение дозы другого перорального гипогликемического препарата.

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

Пиоглитазон не влияет на фармакокинетнку и фармакодинамнку глипизида, дигоксина, варфарина, метформина.

Гемфиброзил повышает значение AUC пиоглитазона в 3 раза.

Рифампицин ускоряет метаболизм пиоглитазона на 54%.

In vitro кетоконазол ингибирует метаболизм пиоглитазона.

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 привести к развитию или усугублению течения сердечной недостаточности, следовательно, при ухудшении состояния сердечнососудистой системы следует прекратить прием пиоглитазона.

Пациентам, у которых имеется хотя бы один фактор риска развития хронической сердечной недостаточности (ХСН), лечение следует начинать с минимальной дозы и постепенно ее повышать. Необходимо своевременно выявлять начальные симптомы ХСН, повышение массы тела (может свидетельствовать о развитии ХСН) или развитие отеков, особенно у пациентов со сниженным сердечным выбросом. В случае развития ХСН препарат немедленно отменяют.

Пиоглитазон может вызывать нарушение функции печени. До начала лечения и периодически во время терапии следует исследовать активность печеночных ферментов. Если активность АЛТ превышает в 2.5 раза верхнюю границу нормы, или при наличии других симптомов печеночной недостаточности, применение пиоглитазона противопоказано. Если при 2-х последовательных исследованиях активность АЛТ превышает верхнюю границу нормы в 3 раза или у пациента развивается желтуха, лечение пиоглитазоном немедленно прекращают. Если у пациента возникают симптомы, предполагающие нарушение функции печени (необъяснимая тошнота, рвота, абдоминальная боль, слабость, анорексия, потемнение мочи) следует немедленно исследовать активность печеночных ферментов.

Пиоглитазон может вызывать снижение гемоглобина или гематокрита на 4% и 4.1% соответственно, что может быть следствием гемодилюции (из-за задержки жидкости).

Пиоглитазон повышает чувствительность тканей к инсулину, что повышает риск развития гипогликемии у пациентов, получающих комбинированную терапию, содержащую производные сульфонилмочевины или инсулин. Может потребовать снижение дозы последних.

Пиоглитазон может вызывать или усугублять отек макулы, что может привести к снижению остроты зрения.

Пиоглитазон может повышать частоту переломов у женщин.

У пациенток с синдромом поликистозных яичников повышение чувствительности к инсулину может привести к возобновлению овуляции и возможной беременности. Пациенткам с синдромом поликистозных яичников, не желающим забеременеть, следует использовать надежные методы контрацепции. При возникновении беременности лечение следует немедленно прекратить.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Учитывая побочные действия препарата необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и работе с механизмами, требующими концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

Для **пациентов с нарушением функции почек (клиренс креатинина более 4 мл/мин)** коррекции дозы не требуется. О применении пиоглитазона у пациентов, получающих лечение гемодиализом, данных нет. Поэтому, не следует применять пиоглитазон у этой группы пациентов.

Противопоказан:

— хроническая почечная недостаточность (КК менее 4 мл/мин).

При нарушениях функции печени

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

Противопоказан:

— печеночная недостаточность (повышение активности печеночных ферментов в 2.5 раза выше верхней границы нормы).

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Не использовать после истечения срока годности.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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