

ПИОГЛИТАЗОН

1. Пиоглитазон.

2. Актос.

3. Гормоны и средства, влияющие на эндокринную систему (Инсулин и средства для лечения сахарного диабета).

4. Гипогликемическое пероральное средство.

5. Уровень убедительности доказательств А.

6. Цена за 1 таблетку (15 мг) – 39,31 руб.[3].

7. Селективно стимулирует ядерные γ -рецепторы, активируемые пролифератором пероксисом (γ -PPAR). Модулирует транскрипцию генов, чувствительных к инсулину и участвующих в контроле уровня глюкозы и метаболизме липидов в жировой, мышечной тканях и в печени. Не стимулирует секрецию инсулина, однако проявляет активность только при сохраненной инсулин-синтетической функции поджелудочной железы. Понижает инсулинрезистентность периферических тканей и печени, увеличивает расход инсулинзависимой глюкозы, уменьшает выход глюкозы из печени. У больных с нарушением липидного обмена уменьшает уровень триглицеридов и увеличивает – липопротеиды высокой плотности без изменения липопротеидов низкой плотности и общего холестерина.

Обнаруживается в крови через 30 минут после перорального приема, C_{max} достигается спустя 2 часа. Прием пищи замедляет всасывание (C_{max} регистрируется через 3 – 4 часа), но не влияет на его полноту. Связывается с белками плазмы крови, в основном с альбумином, более чем на 99%. Средний объем распределения – 0,63 л/кг. Высокая концентрация в крови сохраняется в течение 24 часов после однократного приема. Период полувыведения составляет 3 – 7 часов (пиоглитазон) и 16 – 24 (метаболиты). Метаболизируется в печени при участии цитохрома P_{450} с образованием двух активных метаболитов, частично конъюгирующих с глюкуроновой и серной кислотами. Выводится с желчью в неизменном виде и в виде метаболитов, экскретируется из организма с калом и с мочой (15 – 30%). Клиренс равен 5 – 7 л/ч.

8. Сахарный диабет типа 2, в качестве монотерапии или в комбинации с производными сульфонамидов, метформин или инсулином при отсутствии эффекта от диетотерапии, физических упражнений и монотерапии одним из вышеперечисленных средств.

9. Гиперчувствительность, сахарный диабет типа 1, диабетический кетоацидоз, заболевания печени в стадии обострения, уровень аланинаминотрансферазы, превышающий норму в 2,5 раза, беременность, грудное вскармливание.

10. Снижение сахара крови.

11. Внутрь 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Дозу подбирают индивидуально. Начальная доза 30 мг, максимальная суточная – 45 мг/сут, при комбинированной терапии – 30 мг/сут. DDD=30 мг (перорально).

12. Гипогликемия (чувство голода, ощущение усталости и слабости, головная боль, повышенная возбудимость, тревога, сонливость, беспокойный сон, кошмарные сновидения, изменения поведения, подобные наблюдаемым при алкогольном опьянении, ослабление концентрации внимания, нарушение речи и зрения, спутанность сознания, бледность, тошнота, учащенное сердцебиение, судороги, холодный пот, кома и другие). Лечение: симптоматическая терапия.

13. Развитие гипогликемии при комбинированной терапии обуславливает необходимость уменьшения дозы сопутствующих сульфонамидов или инсулина. У пациенток с ановуляторным циклом в пременопаузном периоде прием может вызвать овуляцию и увеличить риск возникновения беременности (необходимы адекватные методы контрацепции).

14. Применение при беременности и лактации противопоказано. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание. Ограничения к применению: возраст до 18 лет, поскольку безопасность и эффективность применения в этой возрастной группе больных не определены. С осторожностью назначают больным с отеками и умеренным повышением уровня ферментов печени. На фоне почечной недостаточности не требуется коррекции дозы. При возникновении желтухи лечение прекращают.

15. Гипогликемия, отек (в 4,8% случаев при монотерапии и в 15,3% - при комбинации с инсулином), анемия (в 1 – 1,6% случаев), понижение уровня билирубина, аспартатаминотрансферазы, аланинаминотрансферазы, щелочной фосфатазы и γ -глутамилтрансферазы.

16. Производные сульфонамидов, метформин и инсулин потенцируют (взаимно) гипогликемию. Возможно ослабление эффективности пероральной контрацепции.

17. Не применяется.

18. Своевременное информирование лечащего врача об изменениях самочувствия. Больной должен быть предупрежден о возможных осложнениях.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Таблетки 15, 30, 45 мг.

Фирмы: Eli Lilly and Company США.

21. В сухом месте, при комнатной температуре.