

吡格列酮 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022__E5_90_A1_E6_A0_BC_E5_88_97_E9_c22_314280.htm 药品名称吡格列酮药

物别名Actos 英文名称Pioglitazone 类别胰岛激素及其他影响血糖的药物制剂片剂，15、30mg/片分子式成分(±)-5[[4-[2-(5-乙基-2-吡啶基)二氧基]苄基]-2,4]噻唑烷二酮盐酸盐。

药理毒理本品为噻唑烷二酮类抗糖尿病药物，属胰岛素增敏剂，作用机制与胰岛素的存在有关，可减少外周组织和肝脏的胰岛素反抗，增加依靠胰岛素的葡萄糖的处理，并减少肝糖的输出。与磺酰脲类不同，本品不是一个胰岛素促分泌药。

其作用机制是高选择性的激动过氧化物酶小体生长因子活化受体- #093.#093.，PPAR- 的活化可调节许多控制葡萄糖及脂类代谢的胰岛素相关基因的转录。动物实验表明#093.，

本品可减少胰岛素反抗的高血糖、高胰岛素血症及高三酰甘油。本品引起的代谢变化导致了依靠胰岛素的组织应答的增加。由于本品提高了循环胰岛素的作用（即降低胰岛素反抗

），因此它不能降低缺乏内源性胰岛素的动物模型的血糖。

药动学本品天天给予家兔10次后，吡格列酮及其活性代谢物的血清浓度持续升高，7d内达到稳态浓度。在稳定状态下，

吡格列酮的2个活性代谢物（M- ）及（M- ）的血浆浓度 吡格列酮的血浆浓度，吡格列酮约占30%~50%，

其AUC占总AUC的20%~25%。适应症2型糖尿病（或非胰岛素依靠性糖尿病，NIDDM）。不良反应经3000多例（其中1100例疗程为半年，450例为1年）临床试验#093.显示，不良

反应主要有： 低血糖。 吡格列酮组贫血症发生率为1.0

%，安慰剂组为0。与胰岛素联合用药，吡格列酮组与安慰剂

组贫血症发生率均为1.6%。与磺酰脲类联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为0.3%，安慰剂组为1.6%。与二甲双胍联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为1.2%，安慰剂组为0。血红蛋白平均降低2%~4%。 浮肿。 可能引起血浆容积增加，终致前负荷诱导型心脏肥大。 ALT升高，吡格列酮组有0.26%（4/1526）的患者、安慰剂组有0.25（2/793）的患者ALT水平 正常上限的3倍。偶然出现肌酸激酶水平短暂升高。 未见致畸作用。 相互作用经3000多例（其中1100例疗程为半年，450例为1年）临床试验#093.显示，不良反应主要有： 低血糖。 吡格列酮组贫血症发生率为1.0%，安慰剂组为0。与胰岛素联合用药，吡格列酮组与安慰剂组贫血症发生率均为1.6%。与磺酰脲类联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为0.3%，安慰剂组为1.6%。与二甲双胍联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为1.2%，安慰剂组为0。血红蛋白平均降低2%~4%。 浮肿。 可能引起血浆容积增加，终致前负荷诱导型心脏肥大。 ALT升高，吡格列酮组有0.26%（4/1526）的患者、安慰剂组有0.25（2/793）的患者ALT水平 正常上限的3倍。偶然出现肌酸激酶水平短暂升高。 未见致畸作用。 说明临床研究#093.表明，吡格列酮可改善胰岛素反抗患者的胰岛素敏感性，提高胰岛素对细胞的反应性，并改善体内葡萄糖平衡障碍。作用至少可持续1年，在临床对照试验中，吡格列酮与磺酰脲、二甲双胍或胰岛素合用，能提高疗效。吡格列酮的临床试验还选择了脂类异常患者，患者经吡格列酮治疗，可降低三酰甘油水平，增加HDL-C，但LDL及TC则无一一致性的改变。用法用量起始剂量15或30mg，最大剂量为45mgd-1,qd。在早餐前服用，如漏服1次，d2不

可用双倍剂量。注重事项对本品或制剂成分过敏的患者禁用。本品只有在胰岛素存在情况下才发挥抗高血糖的作用，因此，不适用于1型糖尿病患者或糖尿病酮酸中毒的患者。对有胰岛素反抗的绝经前停止排卵的患者，用噻唑烷二酮类包括吡格列酮治疗，可导致重新排卵。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com