

Lần đầu: 05/...7...2013





GETSITALIP TABLETS 50mg

Sitagliptin 50mg

Viên nén bao phim

THÀNH PHẦN:

Mỗi viên nén bao phim chứa

GETSITALIP TABLETS 50mg

Hoạt chất:

Sitagliptin phosphate monohydrate tương đương với Sitagliptin.....50mg

Tá dược:

Anhydrous Dibasic Calci Phosphate, Microcrystalline Cellulose (Avicel PH 102), Croscarmellose natri, Hypromellose (Pharmacoat 606), Colloidal Anhydrous Silica (Aerosil 200), Natri Stearyl Fumarate, Hypromellose (HPMC 5CPS), Magnesi Stearate, Macrogols (P.E.G. 6000), Instacoat Brown Color, Titan Dioxide, bột Talc tinh khiết.

DƯỢC LỰC HỌC:

Sitagliptin là chất có hoạt tính ức chế DPP-4 ở bệnh nhân đái tháo đường tuýp II bằng cách làm chậm sự bất hoạt các hormon incretin gồm có "peptid 1 tương tự Glucagon" [Glucagon-like peptid-1 (GLP-1)] và "polypeptide hướng insulin phụ thuộc glucose" [Glucose dependent insulintropic polypeptide - (GIP)]. Các incretin là một phần của hệ thống nội sinh, tham gia điều hòa sự ổn định nội mô glucose trong cơ thể. Khi nồng độ glucose trong máu bình thường hoặc tăng cao, GLP-1 và GIP gây tăng tổng hợp và giải phóng insulin từ các tế bào beta tuyến tụy bằng con đường dẫn truyền tín hiệu nội bào có liên quan đến AMP vòng. GLP-1 cũng làm giảm tiết glucagon từ các tế bào alpha tuyến tụy, dẫn đến giảm sản xuất glucose ở gan. Bằng cách gia tăng và kéo dài hoạt tính của incretin, Sitagliptin làm tăng tiết insulin và làm giảm nồng độ glucagon phụ thuộc glucose trong vòng tuần hoàn.

DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu:

Sau khi uống sitagliptin liều 100mg, thuốc được hấp thu nhanh với nồng độ đỉnh trong huyết tương (T_{max} trung bình) đạt được sau khi uống từ 1 đến 4 giờ, diện tích dưới đường cong (AUC) trong huyết tương trung bình là 8,52 $\mu\text{M}\cdot\text{giờ}$, C_{max} là 950nm. Sinh khả dụng tuyệt đối của Sitagliptin là khoảng 87%. Diện tích dưới đường cong AUC trong huyết tương của Sitagliptin tăng tỉ lệ thuận với liều.

Phân bố

Thể tích phân bố trung bình ở trạng thái ổn định sau khi tiêm tĩnh mạch liều duy nhất 100mg là khoảng 198 lit. Một phần nhỏ Sitagliptin kết hợp thuận nghịch với protein huyết tương (38%).

Chuyển hóa và thải trừ

Sitagliptin bị thải trừ chủ yếu dưới dạng không thay đổi vào nước tiểu (khoảng 79%), do đó chuyển hóa là con đường thải trừ thứ yếu. Sau khi uống [^{14}C] Sitagliptin, xấp xỉ 100% phóng xạ đã uống bị thải trừ vào phân (13%) hoặc nước tiểu (87%) trong một tuần dùng thuốc. Thời gian bán thải biểu kiến $t_{1/2}$ sau liều uống 100mg Sitagliptin là khoảng 12,4 giờ và độ thanh thải qua thận là khoảng 350mL/phút.

Các trường hợp đặc biệt

Suy thận

Bệnh nhân suy thận nhẹ không có sự gia tăng nồng độ Sitagliptin trong huyết tương có ý nghĩa về mặt lâm sàng. Diện tích dưới đường cong AUC trong huyết tương của Sitagliptin tăng khoảng 2 lần ở những bệnh nhân suy thận trung bình, 4 lần ở bệnh nhân suy thận nặng và bệnh nhân suy thận giai đoạn cuối phải thẩm tách máu.

Suy gan

Chưa có kinh nghiệm lâm sàng trên bệnh nhân suy gan nặng (Điểm số Child-Pugh > 9). Tuy nhiên, vì Sitagliptin chủ yếu được thải trừ qua thận, suy gan nặng dự kiến có thể không ảnh hưởng đến dược động học của Sitagliptin.

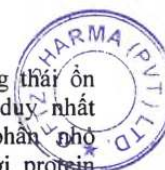
Người già:

Bệnh nhân cao tuổi (65-80 tuổi) có nồng độ Sitagliptin trong huyết tương cao hơn khoảng 19% so với các bệnh nhân trẻ hơn.

CHỈ ĐỊNH:

GETSITALIP (Sitagliptin) được chỉ định hỗ trợ chế độ ăn kiêng và tập thể dục ở bệnh nhân đái tháo đường tuýp 2 giúp kiểm soát đường huyết, dưới các dạng sau:

- Đơn trị liệu
- Phối hợp 2 thuốc:
Phối hợp với Metformin hoặc sulfonylurea hoặc thuốc đồng vận PPAR γ (Ví dụ: thiazolidinediones) khi mà điều trị bằng thuốc đơn trị liệu, chế độ ăn kiêng và tập thể dục không thể kiểm soát đường huyết thích hợp.
- Phối hợp 3 thuốc:
Phối hợp với Metformin và 1 sulfonylurea hoặc Metformin và 1 PPAR γ (Ví dụ: thiazolidinediones) khi mà phối hợp 2 trong các thuốc này, ăn kiêng và tập thể



đục không thể kiểm soát đường huyết thích hợp.

- Phối hợp với Insulin.

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH SỬ DỤNG:

Liều khuyến cáo của GETSITALIP (Sitagliptin) là 100mg mỗi ngày dạng đơn trị liệu hoặc phối hợp điều trị với Metformin, 1 sulfonyleurea, insulin (Có hoặc không có Metformin), 1 thuốc đồng vận PPAR γ (Ví dụ: Thiazolidonediones), metformin cộng với 1 sulfonyleurea, hoặc metformin cộng 1 thuốc đồng vận PPAR γ (Ví dụ: Thiazolidonediones). Khi Getsitalip (Sitagliptin) kết hợp với sulfonyleurea hoặc với insulin, có thể xem xét dùng sulfonyleurea hoặc insulin với liều thấp hơn để làm giảm nguy cơ hạ đường huyết do sulfonyleurea hoặc insulin.

Uống Getsitalip (Sitagliptin) trong bữa ăn nhiều chất béo không ảnh hưởng đến được động học, Getsitalip (sitagliptin) có thể được dùng cùng hoặc không cùng với thức ăn. Nếu quên uống một liều Getsitalip (sitagliptin) cần uống ngay khi nhớ ra. Không nên dùng liều gấp đôi trong cùng một ngày.

Các trường hợp đặc biệt

Suy thận

Đối với bệnh nhân suy thận nhẹ (độ thanh thải creatinin [Cl_{Cr}] ≥ 50 mL/ phút, tương đương với nồng độ creatinine huyết thanh $\leq 1,7$ mg/ dL ở nam và $\geq 1,5$ mg/ dL ở nữ), không cần điều chỉnh liều sitagliptin.

Đối với bệnh nhân suy thận trung bình ($Cl_{Cr} \geq 30$ đến < 50 mL/ phút, tương đương với nồng độ creatinine huyết thanh từ $> 1,7$ đến $3,0$ mg/ dL ở nam và $> 1,5$ đến $\leq 2,5$ mg/ dL ở nữ), liều sitagliptin là 50 mg uống mỗi ngày một lần.

Đối với bệnh nhân suy thận nặng ($Cl_{Cr} < 30$ mL/phút, tương đương với nồng độ creatinine huyết thanh $> 3,0$ mg/dL ở nam và $2,5$ mg/ dL ở nữ) hoặc bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD) đòi hỏi phải thẩm tách máu hoặc thẩm tách phúc mạc, liều sitagliptin là 25mg mỗi ngày một lần. Có thể uống Sitagliptin trong thời gian không thẩm tách máu.

Người già

Không cần điều chỉnh liều theo độ tuổi.

TÁC DỤNG PHỤ:

Đơn trị liệu

Nhiễm khuẩn đường hô hấp trên, đau đầu và viêm mũi họng.

Sitagliptin phối hợp với Metformin HCl:

Thường gặp: buồn nôn

Ít gặp: buồn ngủ, tiêu chảy, đau bụng trên và hạ đường huyết.

Sitagliptin với sulfonylurea

Thường gặp: hạ đường huyết

Sitagliptin với Pioglitazone:

Thường gặp: Hạ đường huyết, đầy hơi, phù ngoại biên.

Sitagliptin với sulfonylurea và Metformin

HCl

Rất thường gặp: hạ đường huyết.

Thường gặp: táo bón

Sitagliptin với Rosiglitazone và Metformin

HCl

Thường gặp: hạ đường huyết, nhức đầu, tiêu chảy, nôn mửa, phù ngoại biên.

Sitagliptin với insulin

Thường gặp: cúm, hạ đường huyết và đau đầu.

Ít gặp: khô miệng, táo bón.

Hiếm: Tắc nghẽn trực tràng, phân đóng khối, bí tiểu.

Thông báo bác sĩ những tác dụng phụ gặp phải khi dùng thuốc.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Sitagliptin chống chỉ định trong các trường hợp sau:

- Bệnh nhân có tiền sử mẫn cảm với Sitagliptin hoặc bất kỳ thành phần nào khác của thuốc.
- Bệnh nhân đái tháo đường tuýp 1 hoặc đang điều trị đái tháo đường nhiễm toan ceton.
- Trẻ em dưới 18 tuổi.

THẬN TRỌNG

Viêm tuyến tụy:

Sau khi khởi đầu điều trị bằng Sitagliptin, bệnh nhân nên được theo dõi cẩn thận các dấu hiệu và triệu chứng của bệnh viêm tuyến tụy. Nếu nghi ngờ viêm tuyến tụy, nên ngưng Sitagliptin ngay lập tức và bắt đầu có phương pháp điều trị thích hợp.

Hạ đường huyết:

Tỉ lệ hạ đường huyết tăng ở các bệnh nhân phối hợp Sitagliptin với sulfonyleurea hoặc với insulin, là những thuốc có thể gây hạ đường huyết. Do đó, có thể cần phải giảm liều sulfonyleurea hoặc insulin để làm giảm nguy cơ hạ huyết áp.

PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ:

Phụ nữ có thai

Sự an toàn của Sitagliptin ở phụ nữ có thai chưa được biết. Sitagliptin, tương tự các thuốc



chống tăng đường huyết khác, không được khuyến cáo sử dụng ở phụ nữ có thai.

Phụ nữ cho con bú

Chưa biết Sitagliptin có tiết vào sữa mẹ hay không. Vì có nhiều thuốc tiết vào sữa mẹ, không nên dùng Sitagliptin trong khi cho con bú.

SẢN XUẤT BỞI:



GETZ PHARMA (PVT) LTD.

29-30/27, Korangi Industrial Area
Karachi 74900, Pakistan.



TÁC DỤNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Getsitalip không ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc. Tuy nhiên, khi lái xe và vận hành máy móc, cần lưu ý đã có báo cáo về các trường hợp hoa mắt và buồn ngủ.

Ngoài ra, nên cảnh báo nguy cơ hạ đường huyết khi phối hợp GETSITALIP và thuốc nhóm sulphonylurea hoặc insulin cho bệnh nhân.

TƯƠNG TÁC THUỐC:

Digoxin:

Sitagliptin có ảnh hưởng rất nhỏ đến nồng độ digoxin trong huyết tương. Không khuyến cáo điều chỉnh liều digoxin. Tuy nhiên, bệnh nhân có nguy cơ ngộ độc digoxin nên được theo dõi khi dùng đồng thời Sitagliptin và digoxin.

QUÁ LIỀU:

Khi xảy ra quá liều, có thể sử dụng các phương pháp điều trị hỗ trợ thông thường như thải trừ các chất không được hấp thu qua đường tiêu hóa, theo dõi lâm sàng (bao gồm điện tâm đồ), và điều trị hỗ trợ tùy theo tình trạng lâm sàng của bệnh nhân. Sitagliptin chỉ được thải trừ bằng thẩm tách ở mức độ vừa phải. Thẩm tách máu kéo dài có thể được xem xét nếu phù hợp về lâm sàng. Chưa được biết Sitagliptin có thể bị thải trừ bằng thẩm tách màng bụng hay không.

BẢO QUẢN:

Bảo quản dưới 30°C. Tránh ánh sáng và tránh ẩm.

TIÊU CHUẨN: Nhà sản xuất

HẠN DÙNG: 2 năm kể từ ngày sản xuất

ĐÓNG GÓI: Hộp 2 vỉ x 7 viên

- *Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.*
- *Nếu cần thêm thông tin, xin hỏi ý kiến bác sĩ.*
- *Thuốc này chỉ được dùng theo sự kê toa của bác sĩ*
- *Đề xa tầm tay trẻ em.*



PHÓ CỤC TRƯỞNG

Nguyễn Văn Thanh