

Rx

Justeez 50

(Viên nén không bao Vildagliptin 50 mg)



Các dấu hiệu lưu ý và khuyến cáo:

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Để xa tầm tay trẻ em.

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

1. Thành phần công thức thuốc:

Mỗi viên nén không bao chứa:

Thành phần hoạt chất: Vildagliptin 50 mg.

Thành phần tá dược: Microcrystalline cellulose (PH 112), anhydrous lactose, sodium starch glycolate, magnesium stearate.

2. Dạng bào chế:

Dạng bào chế: Viên nén không bao.

Mô tả đặc điểm thuốc: Viên nén không bao màu trắng đến trắng ngà, hình tròn, vát cạnh và phẳng 2 mặt.

3. Chỉ định:

Vildagliptin được chỉ định như một thuốc hỗ trợ cho chế độ ăn và luyện tập để cải thiện sự kiểm soát đường huyết ở bệnh nhân đái tháo đường type 2 (T2DM).

- Đơn trị liệu cho bệnh nhân không kiểm soát đầy đủ bằng chế độ ăn và tập luyện đơn thuần và không thể sử dụng metformin do có những chống chỉ định hoặc không dung nạp.
- Trong phối hợp hai loại thuốc
 - Với metformin ở bệnh nhân không kiểm soát đường huyết đầy đủ khi dùng metformin đơn trị liệu ở liều tối đa dung nạp.
 - Với một sulphonylurea (SU) khi chế độ ăn, luyện tập và sulphonylurea đơn độc không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.
 - Với một thiazolidinedion (TZD) khi chế độ ăn, luyện tập và thiazolidinedion không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.
- Trong phối hợp ba loại thuốc
 - Với một sulphonylurea và metformin khi chế độ ăn, luyện tập và điều trị kép bằng những thuốc này không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.

Vildagliptin cũng được chỉ định phối hợp với insulin (có hoặc không có dùng metformin) khi chế độ ăn, tập luyện và liều insulin ổn định không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.

4. Liều dùng, cách dùng:

Nhóm bệnh nhân mục tiêu:

Người lớn từ 18 tuổi trở lên.

LIỀU DÙNG

Kiểm soát việc điều trị đái tháo đường nên tùy theo từng bệnh nhân.

Liều được khuyến cáo của vildagliptin là 50 mg một hoặc hai lần mỗi ngày.

Trong đơn trị liệu, và trong điều trị phối hợp với metformin, với một TZD hoặc với insulin (có hoặc không có metformin), liều được khuyến cáo của vildagliptin là 50mg hoặc 100mg mỗi



ngày.

Khi điều trị phối hợp hai loại thuốc với một sulfonylurea, liều được khuyến cáo của vildagliptin là 50mg một lần một ngày. Ở nhóm bệnh nhân này, vildagliptin 100mg/ngày không hiệu quả hơn vildagliptin 50mg, 1 lần/ngày. Khi sử dụng kết hợp với một sulphonylurea, liều thấp hơn của sulphonylurea có thể được xem xét để giảm nguy cơ hạ đường huyết.

Trong điều trị phối hợp 3 loại thuốc với metformin và một SU, liều được khuyến cáo của vildagliptin là 100mg mỗi ngày.

Nếu sự kiểm soát đường huyết chặt chẽ hơn cần đến liều dùng trên liều vildagliptin tối đa hàng ngày được khuyến cáo, có thể xem xét bổ sung các thuốc điều trị đái tháo đường khác như metformin, một sulphonylurea, một thiazolidinedion hoặc insulin.

Liều lớn hơn 100mg không được khuyến cáo.

Độ an toàn và hiệu quả của vildagliptin trong phác đồ hợp ba thuốc đường uống với metformin và một dẫn chất thiazolidinedion chưa được thiết lập.

Đối tượng đặc biệt

Suy thận

Không cần điều chỉnh liều vildagliptin ở bệnh nhân suy thận nhẹ. Ở bệnh nhân suy thận trung bình hoặc nặng hoặc bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD), liều vildagliptin được khuyến cáo là 50 mg, 1 lần/ngày.

Suy gan

Không khuyến cáo dùng vildagliptin cho bệnh nhân suy gan, kể cả bệnh nhân có ALT hoặc AST trước điều trị > 2,5 lần giới hạn trên của mức bình thường (ULN).

Bệnh nhân trẻ em (dưới 18 tuổi)

Vildagliptin chưa được nghiên cứu ở bệnh nhân dưới 18 tuổi, do đó không khuyến cáo dùng vildagliptin cho bệnh nhân trẻ em.

Bệnh nhân cao tuổi (trên 65 tuổi)

Ở những bệnh nhân > 65 tuổi và > 75 tuổi được điều trị bằng vildagliptin, không quan sát thấy sự khác biệt về độ an toàn tổng thể, sự dung nạp hoặc hiệu quả giữa nhóm bệnh nhân cao tuổi này với những bệnh nhân trẻ tuổi hơn. Do đó không cần điều chỉnh liều trên bệnh nhân cao tuổi.

Cách dùng:

Dùng đường uống.

Vildagliptin có thể dùng cùng hoặc không cùng thức ăn.

Liều 50 mg nên được uống một lần một ngày vào buổi sáng. Liều 100mg nên được chia thành 2 liều 50mg, uống vào buổi sáng và buổi tối.

Nếu bỏ lỡ một liều vildagliptin, cần uống ngay khi bệnh nhân nhớ ra. Không nên uống một liều gấp đôi trong cùng một ngày.

5. Chống chỉ định:

Quá mẫn với hoạt chất hoặc với bất kỳ thành phần tá dược nào của thuốc.

6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:

Chung

Vildagliptin không thể thay thế insulin ở những bệnh nhân cần dùng insulin. Vildagliptin không nên được sử dụng cho bệnh nhân đái tháo đường type 1 hoặc để điều trị nhiễm toan ceton do đái tháo đường.

Suy thận

Có ít kinh nghiệm ở bệnh nhân ESRD đang chạy thận nhân tạo. Vì vậy nên thận trọng khi dùng vildagliptin cho những bệnh nhân này.

Suy gan

Không nên dùng vildagliptin cho bệnh nhân suy gan, kể cả bệnh nhân có ALT hoặc AST trước



điều trị > 3x ULN.

Theo dõi enzym gan

Các trường hợp hiếm gặp về rối loạn chức năng gan (bao gồm cả viêm gan) đã được báo cáo. Trong những trường hợp này, bệnh nhân nhìn chung không có triệu chứng, không có dị chứng lâm sàng và kết quả xét nghiệm chức năng gan trở lại bình thường sau khi ngừng điều trị. Các xét nghiệm chức năng gan nên được thực hiện trước khi bắt đầu điều trị bằng vildagliptin để biết các giá trị ban đầu của bệnh nhân. Chức năng gan nên được theo dõi trong khi điều trị với vildagliptin cách nhau ba tháng trong năm đầu tiên và định kỳ sau đó. Những bệnh nhân bị tăng nồng độ transaminase nên được theo dõi bằng đánh giá chức năng gan lần thứ hai để xác nhận kết quả và được theo dõi sau đó bằng các xét nghiệm chức năng gan thường xuyên cho đến khi (các) bất thường trở lại bình thường. Nếu sự gia tăng AST hoặc ALT từ 3x ULN trở lên vẫn kéo dài, nên ngừng điều trị vildagliptin.

Những bệnh nhân bị vàng da hoặc các dấu hiệu khác gợi ý đến rối loạn chức năng gan nên ngừng sử dụng vildagliptin.

Sau khi ngừng điều trị bằng vildagliptin và bình thường hóa các xét nghiệm chức năng gan, không nên bắt đầu lại điều trị bằng vildagliptin.

Suy tim

Một thử nghiệm lâm sàng về vildagliptin ở những bệnh nhân có phân loại chức năng I-III của Hiệp hội Tim mạch New York (NYHA) cho thấy điều trị bằng vildagliptin không liên quan đến sự thay đổi chức năng tâm thất trái hoặc làm trầm trọng thêm tình trạng suy tim sung huyết (CHF) đã có từ trước so với giả dược. Kinh nghiệm lâm sàng ở những bệnh nhân suy chức năng NYHA độ III được điều trị bằng vildagliptin vẫn còn hạn chế và kết quả không thuyết phục.

Không có kinh nghiệm sử dụng vildagliptin trong các thử nghiệm lâm sàng ở bệnh nhân NYHA độ IV và do đó không khuyến cáo sử dụng ở những bệnh nhân này.

Rối loạn da

Các tổn thương da, bao gồm phỏng rộp và loét ở tứ chi của khi đã được báo cáo trong các nghiên cứu độc tính phi lâm sàng. Mặc dù các tổn thương da không được quan sát thấy với tỷ lệ gia tăng trong các thử nghiệm lâm sàng, nhưng kinh nghiệm ở những bệnh nhân bị biến chứng da do đài tháo đường còn hạn chế. Hơn nữa, đã có những báo cáo sau tiếp thị về các tổn thương da nổi mụn nước và tróc vảy. Do đó, để phù hợp với việc chăm sóc định kỳ cho bệnh nhân đài tháo đường, nên theo dõi các rối loạn về da, chẳng hạn như phỏng rộp hoặc loét.

Viêm tụy cấp

Sử dụng vildagliptin có liên quan đến nguy cơ phát triển viêm tụy cấp tính. Bệnh nhân cần được thông báo về các triệu chứng đặc trưng của viêm tụy cấp.

Nếu nghi ngờ viêm tụy, nên ngừng sử dụng vildagliptin; nếu viêm tụy cấp được xác nhận, không nên bắt đầu lại vildagliptin. Cần thận trọng đối với những bệnh nhân có tiền sử viêm tụy cấp.

Ha đường huyết

Sulphonylurea được biết là gây hạ đường huyết. Bệnh nhân dùng vildagliptin kết hợp với sulphonylurea có thể có nguy cơ hạ đường huyết. Do đó, một liều sulphonylurea thấp hơn có thể được xem xét để giảm nguy cơ hạ đường huyết.

Tá dược

Thuốc này có chứa lactose. Bệnh nhân có vấn đề di truyền hiếm gặp về không dung nạp galactose, thiếu hụt lactase toàn phần hoặc kém hấp thu glucose-galactose không nên dùng thuốc này.

Thuốc có chứa ít hơn 1 mmol natri (23 mg) mỗi viên, nghĩa là về cơ bản là 'không có natri'.

7. Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú:

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:

Không có dữ liệu đầy đủ về việc sử dụng vildagliptin ở phụ nữ có thai. Các nghiên cứu trên động vật đã cho thấy độc tính sinh sản ở liều cao.



Những nguy cơ tiềm ẩn cho con người là không xác định. Do thiếu dữ liệu trên người, không nên sử dụng vildagliptin trong thời kỳ mang thai.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú:

Hiện chưa biết liệu vildagliptin có được bài tiết vào sữa mẹ ở người hay không. Các nghiên cứu trên động vật cho thấy sự bài tiết vildagliptin trong sữa. Không nên dùng vildagliptin trong thời kỳ cho con bú.

Khả năng sinh sản

Không có nghiên cứu về ảnh hưởng đến khả năng sinh sản của con người đối với vildagliptin.

8. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc:

Không có nghiên cứu nào về ảnh hưởng đến khả năng lái xe và sử dụng máy móc đã được thực hiện. Những bệnh nhân bị chóng mặt do phản ứng không mong muốn nên tránh lái xe hoặc sử dụng máy móc.

9. Tương tác, tương kỵ của thuốc:

Tương tác:

Vildagliptin có khả năng tương tác thấp với các thuốc dùng chung. Vì vildagliptin không phải là cơ chất của enzym cytochrom P (CYP) 450 và không ức chế hoặc cảm ứng enzym CYP 450, nên nó ít có khả năng tương tác với các hoạt chất là cơ chất, chất ức chế hoặc chất cảm ứng của các enzym này.

Kết hợp với pioglitazon, metformin và glyburid

Kết quả từ các nghiên cứu được thực hiện với các thuốc điều trị đái tháo đường này cho thấy không có tương tác dược động học có liên quan về mặt lâm sàng.

Digoxin (chất nền Pgp), warfarin (chất nền CYP2C9)

Các nghiên cứu lâm sàng được thực hiện với các đối tượng khỏe mạnh không cho thấy có tương tác dược động học có liên quan về mặt lâm sàng. Tuy nhiên, điều này đã không được thiết lập trong dân số mục tiêu.

Kết hợp với amlodipin, ramipril, valsartan hoặc simvastatin

Các nghiên cứu về tương tác thuốc - thuốc ở những đối tượng khỏe mạnh được thực hiện với amlodipin, ramipril, valsartan và simvastatin. Trong các nghiên cứu này, không có tương tác dược động học có liên quan về mặt lâm sàng nào được quan sát thấy sau khi dùng đồng thời vildagliptin.

Kết hợp với thuốc ức chế enzym chuyển

Có thể tăng nguy cơ phù mạch ở những bệnh nhân dùng đồng thời thuốc ức chế enzym chuyển. Cũng như các sản phẩm thuốc trị đái tháo đường đường uống khác, tác dụng hạ đường huyết của vildagliptin có thể bị giảm bởi một số hoạt chất, bao gồm thiazid, corticosteroid, các thuốc hormon tuyến giáp và thuốc cường giao cảm.

Tương kỵ:

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

10. Tác dụng không mong muốn của thuốc:

Tần suất được xác định như sau: Rất thường gặp ($\geq 1/10$), thường gặp ($\geq 1/100$ đến $< 1/10$), ít gặp ($\geq 1/1.000$ đến $< 1/100$), hiếm gặp ($\geq 1/10.000$ to $< 1/1.000$), rất hiếm gặp ($< 1/10.000$), không rõ (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn).

Kết hợp với metformin:

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng

Thường gặp	Hạ đường huyết
------------	----------------



Rối loạn hệ thần kinh	
Thường gặp	Run, đau đầu, chóng mặt
Ít gặp	Mệt mỏi
Rối loạn tiêu hóa	
Thường gặp	Buồn nôn

Kết hợp với sulphonylurea

Nhiễm khuẩn và nhiễm ký sinh trùng	
Rất hiếm gặp	Viêm mũi họng
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Thường gặp	Hạ đường huyết
Rối loạn hệ thần kinh	
Thường gặp	Run, đau đầu, chóng mặt, suy nhược
Rối loạn tiêu hóa	
Ít gặp	Táo bón

Kết hợp với thiazolidinedion

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Thường gặp	Tăng cân
Ít gặp	Hạ đường huyết
Rối loạn hệ thần kinh	
Ít gặp	Đau đầu, suy nhược
Rối loạn mạch	
Thường gặp	Phù ngoại vi

Đơn trị liệu

Nhiễm khuẩn và nhiễm ký sinh trùng	
Rất hiếm gặp	Nhiễm khuẩn đường hô hấp trên
Rất hiếm gặp	Viêm mũi họng
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Ít gặp	Hạ đường huyết
Rối loạn hệ thần kinh	
Thường gặp	Chóng mặt



Ít gặp	Đau đầu
Rối loạn mạch	
Ít gặp	Phù ngoại vi
Rối loạn tiêu hóa	
Ít gặp	Táo bón
Rối loạn cơ xương và mô liên kết	
Ít gặp	Đau khớp

Kết hợp với metformin và một thuốc sulphonylurea

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Thường gặp	Hạ đường huyết
Rối loạn hệ thần kinh	
Thường gặp	Chóng mặt, run
Rối loạn da và mô dưới da	
Thường gặp	Tăng tiết mồ hôi
Rối loạn toàn thân và nơi sử dụng	
Thường gặp	Suy nhược

Kết hợp với insulin

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Thường gặp	Giảm glucose huyết
Rối loạn hệ thần kinh	
Thường gặp	Đau đầu, ớn lạnh
Rối loạn tiêu hóa	
Thường gặp	Buồn nôn, bệnh trào ngược dạ dày-thực quản
Ít gặp	Tiêu chảy, đầy hơi

Kinh nghiệm sau khi lưu hành

Rối loạn tiêu hóa	
Không rõ	Viêm tụy
Rối loạn gan mật	
Không rõ	Viêm gan (có thể hồi phục khi ngưng sử dụng thuốc) Các xét nghiệm chức năng gan bất thường (có thể hồi phục khi ngưng sử dụng thuốc)



Rối loạn cơ xương và mô liên kết	
Không rõ	Đau cơ
Rối loạn da và mô dưới da	
Không rõ	Mày đay Tổn thương da bong tróc và bóng nước, bao gồm pemphigoid bóng nước

11. Quá liều và cách xử trí:

Thông tin liên quan đến quá liều với vildagliptin còn hạn chế.

Triệu chứng

Thông tin về các triệu chứng quá liều có khả năng xảy ra được lấy từ một nghiên cứu về khả năng dung nạp liều tăng ở những người khỏe mạnh dùng vildagliptin trong 10 ngày. Ở liều 400 mg, có ba trường hợp đau cơ, và các trường hợp riêng lẻ bị dị cảm nhẹ và thoáng qua, sốt, phù và tăng nồng độ lipase thoáng qua. Ở liều 600 mg, một đối tượng bị phù nề bàn chân và bàn tay, đồng thời tăng nồng độ creatin phosphokinase (CPK), aspartat aminotransferase (AST), protein phản ứng C (CRP) và nồng độ myoglobin. Ba đối tượng khác bị phù nề bàn chân, hai trường hợp bị tê liệt. Tất cả các triệu chứng và các bất thường trong phòng thí nghiệm được hồi phục mà không cần điều trị sau khi ngừng sử dụng thuốc nghiên cứu.

Xử trí

Trong trường hợp quá liều, nên điều trị hỗ trợ. Không thể loại bỏ vildagliptin bằng thẩm tách máu. Tuy nhiên, chất chuyển hóa thủy phân chính (LAY 151) có thể được loại bỏ bằng thẩm tách máu.

12. Đặc tính dược lực học:

Nhóm dược lý: chất ức chế dipeptidyl-peptidase-4 (DPP-4)

Mã ATC: A10BH02

Cơ chế hoạt động:

Việc sử dụng vildagliptin dẫn đến sự ức chế nhanh chóng và hoàn toàn hoạt động của DPP-4, dẫn đến tăng nồng độ nội sinh trong lúc đói và sau ăn của các hormon incretin GLP-1 (peptid giống glucagon 1) và GIP (polypeptid insulin phụ thuộc vào glucose).

Tác dụng dược lực học

Bằng cách tăng nồng độ nội sinh của các hormon incretin này, vildagliptin tăng cường độ nhạy của tế bào beta với glucose, dẫn đến cải thiện tiết insulin phụ thuộc vào glucose. Điều trị với vildagliptin 50-100 mg mỗi ngày ở bệnh nhân đái tháo đường loại 2 đã cải thiện đáng kể các dấu hiệu chức năng tế bào beta bao gồm HOMA- β (Đánh giá mô hình cân bằng nội môi - β), tỷ lệ proinsulin trên insulin và các phép đo đáp ứng của tế bào beta từ khả năng dung nạp bữa ăn được lấy mẫu kiểm tra thường xuyên. Ở những người không bị đái tháo đường (đường huyết bình thường), vildagliptin không kích thích tiết insulin hoặc làm giảm lượng đường.

Bằng cách tăng mức GLP-1 nội sinh, vildagliptin cũng tăng cường độ nhạy của tế bào alpha với glucose, dẫn đến tiết glucagon thích hợp hơn với glucose.

Tỷ lệ insulin/glucagon tăng cao trong quá trình tăng đường huyết do nồng độ hormon incretin tăng lên dẫn đến giảm sản xuất glucose ở gan lúc đói và sau ăn, dẫn đến giảm đường huyết.

Tác dụng đã biết của việc tăng nồng độ GLP-1 trong việc làm chậm quá trình làm rỗng dạ dày không được ghi nhận khi điều trị bằng vildagliptin.

13. Đặc tính dược động học:

Sự hấp thu

Sau khi uống ở trạng thái đói, vildagliptin được hấp thu nhanh chóng, với nồng độ đỉnh trong huyết tương quan sát được là 1,7 giờ. Thức ăn làm chậm thời gian đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương đến 2,5 giờ, nhưng không làm thay đổi mức phơi nhiễm tổng thể (AUC). Sử dụng



vildagliptin cùng với thức ăn làm giảm C_{max} (19%). Tuy nhiên, mức độ thay đổi không đáng kể về mặt lâm sàng, vì vậy vildagliptin có thể được dùng cùng hoặc không cùng thức ăn. Sinh khả dụng tuyệt đối là 85%.

Phân bố

Sự gắn kết với protein huyết tương của vildagliptin thấp (9,3%) và vildagliptin phân bố đồng đều giữa huyết tương và hồng cầu. Thể tích phân bố trung bình của vildagliptin ở trạng thái ổn định sau khi tiêm tĩnh mạch (Vss) là 71 lít, cho thấy sự phân bố ngoài mạch.

Chuyển hóa

Chuyển hóa là con đường thải trừ chủ yếu của vildagliptin ở người, chiếm 69% liều dùng. Chất chuyển hóa chính (LAY 151) không có hoạt tính dược lý và là sản phẩm thủy phân của gốc cyano, chiếm 57% liều dùng, tiếp theo là glucuronid (BQS867) và các sản phẩm thủy phân amid (4% liều). Dữ liệu *in vitro* trên microsom thận của người cho thấy thận có thể là một trong những cơ quan chính góp phần vào quá trình thủy phân vildagliptin thành chất chuyển hóa không hoạt tính chính của nó, LAY151. DPP-4 đóng góp một phần vào quá trình thủy phân vildagliptin dựa trên một nghiên cứu *in vivo* sử dụng chuột thiếu DPP-4. Vildagliptin không được chuyển hóa bởi các enzym CYP 450 ở bất kỳ mức độ định lượng nào. Do đó, sự thanh thải chuyển hóa của vildagliptin được dự đoán là sẽ không bị ảnh hưởng bởi các thuốc đồng thời là chất ức chế và/hoặc cảm ứng CYP 450. Các nghiên cứu *in vitro* đã chứng minh rằng vildagliptin không ức chế/cảm ứng enzym CYP 450. Do đó, vildagliptin không có khả năng ảnh hưởng đến độ thanh thải chuyển hóa của các thuốc dùng chung được chuyển hóa bởi CYP 1A2, CYP 2C8, CYP 2C9, CYP 2C19, CYP 2D6, CYP 2E1 hoặc CYP 3A4/5.

Thải trừ

Sau khi uống vildagliptin [^{14}C], khoảng 85% liều dùng được bài tiết vào nước tiểu và 15% liều dùng được phục hồi qua phân. Bài tiết vildagliptin không đổi qua thận chiếm 23% liều sau khi uống. Sau khi tiêm tĩnh mạch cho người khỏe mạnh, tổng độ thanh thải trong huyết tương và thận của vildagliptin tương ứng là 41 và 13 L/h. Thời gian bán thải trung bình sau khi tiêm tĩnh mạch là khoảng 2 giờ. Thời gian bán thải sau khi uống khoảng 3 giờ.

Tuyến tính/ không tuyến tính

C_{max} đối với vildagliptin và diện tích dưới đường cong nồng độ trong huyết tương theo thời gian (AUC) tăng gần như tỷ lệ với liều trong khoảng liều điều trị.

Đối tượng đặc biệt

Giới tính

Không thấy sự khác biệt có liên quan dược động học về mặt lâm sàng của vildagliptin giữa các đối tượng nam và nữ khỏe mạnh trong nhiều độ tuổi và chỉ số khối cơ thể (BMI). Sự ức chế DPP-4 của vildagliptin không bị ảnh hưởng bởi giới tính.

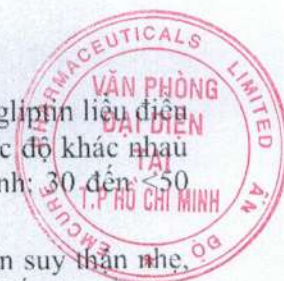
Người cao tuổi

Ở những người cao tuổi khỏe mạnh (≥ 70 tuổi), mức tiếp xúc chung của vildagliptin (100 mg một lần mỗi ngày) tăng 32%, với nồng độ đỉnh trong huyết tương tăng 18% so với những đối tượng trẻ khỏe mạnh (18-40 tuổi). Tuy nhiên, những thay đổi này không được coi là có liên quan đến lâm sàng. Sự ức chế DPP-4 của vildagliptin không bị ảnh hưởng bởi tuổi tác.

Suy gan

Ảnh hưởng của suy giảm chức năng gan đối với dược động học của vildagliptin đã được nghiên cứu ở những bệnh nhân suy gan nhẹ, trung bình và nặng dựa trên thang điểm Child-Pugh (từ 6 đối với mức độ nhẹ đến 12 đối với mức độ nghiêm trọng) khi so sánh với các đối tượng khỏe mạnh. Sự tiếp xúc với vildagliptin sau một liều duy nhất ở bệnh nhân suy gan nhẹ và trung bình đã giảm (tương ứng là 20% và 8%), trong khi sự tiếp xúc với vildagliptin ở bệnh nhân suy gan nặng tăng 22%. Sự thay đổi tối đa (tăng hoặc giảm) khi tiếp xúc với vildagliptin là $\sim 30\%$, điều này không được coi là có ý nghĩa lâm sàng. Không có mối tương quan giữa mức độ nghiêm trọng của bệnh gan và những thay đổi về mức độ tiếp xúc với vildagliptin.

Suy thận



Tiến hành một thử nghiệm nhân mở, đa liều để đánh giá dược động học của vildagliptin liều điều trị thấp hơn (50 mg một lần mỗi ngày) ở bệnh nhân suy thận mạn tính ở các mức độ khác nhau được xác định bởi độ thanh thải creatinin (nhẹ: 50 đến <80 mL/phút, trung bình: 30 đến <50 mL/phút và nặng: <30 mL/phút) so với đối tượng khỏe mạnh bình thường.

AUC vildagliptin tăng trung bình lần lượt là 1,4, 1,7 và 2 lần ở những bệnh nhân suy thận nhẹ, trung bình và nặng so với những người khỏe mạnh bình thường. AUC của các chất chuyển hóa LAY151 và BQS867 tăng trung bình khoảng 1,5, 3 và 7 lần tương ứng ở bệnh nhân suy thận nhẹ, trung bình và nặng. Dữ liệu hạn chế từ những bệnh nhân mắc bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD) chỉ ra rằng mức độ tiếp xúc với vildagliptin tương tự như mức độ tiếp xúc ở những bệnh nhân bị suy thận nặng. Nồng độ LAY151 cao hơn khoảng 2-3 lần so với ở bệnh nhân suy thận nặng.

Vildagliptin bị loại bỏ bằng thẩm tách máu ở mức độ hạn chế (3% trong 3-4 giờ thẩm phân máu bắt đầu sau 4 giờ dùng thuốc).

Chứng tộc

Dữ liệu hạn chế cho thấy rằng chứng tộc không có bất kỳ ảnh hưởng lớn nào đến dược động học của vildagliptin.

14. Quy cách đóng gói: Hộp 2 vỉ x 15 viên, nhôm-nhôm.

15. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc:

- **Điều kiện bảo quản:** Bảo quản ở nơi khô, dưới 30°C, tránh ánh sáng.
- **Hạn dùng:** 24 tháng kể từ ngày sản xuất.
- **Tiêu chuẩn chất lượng của thuốc:** TCCS.

16. Tên, địa chỉ cơ sở sản xuất thuốc:

EMCURE PHARMACEUTICALS LTD.

Lane No.3, Phase II, SIDCO Industrial Complex, Bari Brahmana, Jammu (J&K)-181133, Ấn Độ.