

## Tương tác thuốc

### *Thuốc làm tăng độc tính của linezolid:*

Thuốc ức chế monoamin oxiadase (MAO): linezolid là chất ức chế hồi phục không chọn lọc MAO. Vì vậy, không sử dụng linezolid trên những bệnh nhân đang sử dụng hoặc đã sử dụng trong vòng 2 tuần trước đó một trong các thuốc ức chế MAO như isocarboxazid, phenelzin, selegilin, tranylcypromine.

Thuốc tác động lên hệ serotonergic: phối hợp linezolid với các thuốc tác động lên hệ serotonergic làm tăng nguy cơ gặp hội chứng serotonin. Do vậy, không nên sử dụng linezolid trên những bệnh nhân đang dùng các thuốc SSRI (citalopram, escitalopram, fluoxatin, fluvoxamin, paroxetin, sertraline), các thuốc SNRI (desvenlafaxin, duloxetin, venlafaxin), thuốc chống trầm cảm 3 vòng (amoxapin, amitriptylin, clomipramin, desipramin, doxepin, imipramin, nortriptylin, protriptylin, trimipramin), các thuốc chủ vận receptor serotonin 5-HT (almotriptan), các thuốc khác như meperidin, bupropion, buspirone.

### *Thuốc làm giảm tác dụng của linezolid*

Thuốc gây cảm ứng enzym gan: linezolid được chuyển hóa một phần nhỏ ở gan, có thể qua trung gian cytochrome P450. Các thuốc gây cảm ứng enzym gan mạnh có thể làm giảm nồng độ của linezolid khi dùng phối hợp, như rifampicin, carbamazepin, phenytoin, phenobarbital.

### *Các thuốc có nguy cơ tăng độc tính khi phối hợp với linezolid*

Thuốc hạ đường huyết: Linezolid là chất ức chế MAO, có thể gây tăng insulin huyết ở bệnh nhân tái tháo đường typ 2 còn khả năng tiết insulin, dẫn đến hạ đường huyết ở những bệnh nhân này khi đang dùng insulin hoặc các thuốc hạ đường huyết như acarbose, clorpropamide, glimepiride, glipizide, glyburide, metformin, nateglinide, repaglinide, tolazamide, tolbutamide.

Thuốc tác động lên hệ adrenergic: Khi linezolid dùng kèm với các thuốc tác động lên hệ adrenergic, có thể gây đảo ngược tác dụng trên huyết áp của các thuốc này, bao gồm các thuốc tác động gián tiếp lên hệ giao cảm (phenylpropanolamin, pseudoephedrin), epinephrin, norepinephrin, các thuốc tác động lên hệ dopaminergic (dopamine, dobutamine). Không nên phối hợp linezolid với các thuốc này, hoặc nếu cần phối hợp thì giảm liều các thuốc này.

## Tương kỵ

Các dung môi tương hợp với linezolid bao gồm dung dịch natri clorid 0,9%; dung dịch glucose 5%, Ringer lactate.

Linezolid gặp tương kỵ vật lý với các thuốc amphotericin B, clorpromazine hydrochloride, diazepam, pentamidine isothionate, erythromycin, phenytoin natri, trimethoprim-sulfamethoxazole. Ngoài ra, linezolid gặp tương kỵ hóa học khi phối hợp với ceftriaxon.

## Quá liều và xử trí

**Triệu chứng:** Chưa ghi nhận trường hợp quá liều trên người. Dấu hiệu quá liều trên chuột khi dùng linezolid 3 000 mg/kg/ngày là giảm hoạt động, mất điều hòa, còn trên chó khi dùng 2 000 mg/kg/ngày là nôn và run.

**Xử trí:** Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Lọc máu có thể giúp loại nhanh linezolid ra khỏi cơ thể. Khoảng 30% lượng thuốc có thể được loại bỏ trong vòng 3 giờ lọc máu.

Cập nhật lần cuối: 2019.

## LIOTHYRONIN

**Tên chung quốc tế:** Liothyronine.

**Mã ATC:** H03AA02.

**Loại thuốc:** Hormon tuyến giáp.

## Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén natri liothyronin: 5 microgam; 10 microgam, 20 microgam; 25 microgam; 50 microgam.

Thuốc tiêm natri liothyronin (chỉ để tiêm tĩnh mạch): Dung dịch tiêm 10 microgam trong 1 ml; bột đóng khô pha tiêm 20 microgam pha trong 1 hoặc 2 ml nước cất pha tiêm.

## Dược lực học

Liothyronin là một trong hai hormon chủ yếu của tuyến giáp, có tên hóa học là 3,5,3'-triiodo L-thyronine, có thể được gọi bằng các tên liothyronin, L-triiodothyronine, triiodothyronine hoặc T<sub>3</sub>; hormon còn lại của tuyến giáp là levothyroxine (L-thyroxine, thyroxine hoặc T<sub>4</sub>).

Tuyến giáp đóng vai trò điều hòa chuyển hóa trong các mô cơ thể thông qua T<sub>3</sub> và T<sub>4</sub>. Sự tổng hợp hormon tuyến giáp phụ thuộc vào lượng iod đưa vào cơ thể qua đường ăn uống và được điều hòa bằng cơ chế tự điều hòa trong tuyến giáp và theo trực tiếp dưới đồi - tuyến yên - tuyến giáp. Ở điều kiện tuyến giáp hoạt động bình thường, khi hàm lượng T<sub>3</sub> và T<sub>4</sub> tự do trong máu dưới ngưỡng sinh lý sẽ kích thích vùng dưới đồi tiết hormon giải phóng thyrotropin (thyrotropin releasing hormone-TRH), TRH sau đó kích thích tuyến yên giải phóng hormon kích thích tuyến giáp (thyrotropin-TSH). TSH tác động lên các thụ thể của nó ở tế bào tuyến giáp để tăng tổng hợp và tiết T<sub>3</sub> và T<sub>4</sub> và cũng giải phóng hormon dự trữ trong tuyến. Ngược lại, khi hàm lượng T<sub>3</sub> và T<sub>4</sub> trong máu vượt ngưỡng sinh lý cần thiết, tiết TSH và có thể cả TRH sẽ bị ngừng lại.

Lượng liothyronin lưu hành trong tuần hoàn chỉ một phần nhỏ được tiết trực tiếp từ tuyến giáp, phần chủ yếu được khử iod từ levothyroxine ở các mô ngoại vi. Khoảng 40% lượng T<sub>4</sub> được chuyển thành T<sub>3</sub>, và 40% được chuyển thành T<sub>3</sub> không hoạt động (gọi là reverse T<sub>3</sub>).

Liothyronin sử dụng trong điều trị là chế phẩm tổng hợp, đồng phân tă tuyến, dưới dạng muối natri.

Liothyronin có cùng tác dụng được lý như thyroxine natri và các chế phẩm từ tuyến giáp, nhưng cũng có nhiều khác biệt (xem Dược động học). Tác dụng của liothyronin mạnh hơn levothyroxine khoảng từ 3 đến 5 lần, 20 - 25 microgam liothyronin natri có tác dụng tương đương khoảng 100 microgam levothyroxine natri. Liothyronin thường được dùng khi cần phải có tác dụng nhanh, chẳng hạn như trong hôn mê do thiếu năng giáp hoặc chuẩn bị người bệnh trước khi dùng liệu pháp <sup>131</sup>I để điều trị ung thư tuyến giáp. Liệu pháp thay thế dùng liothyronin lâu dài ít được dùng vì phải dùng thuốc nhiều lần, giá cao và khiến nồng độ triiodothyronine trong huyết thanh dao động nhiều và có khả năng gây các tác dụng có hại cho tim mạch.

Liothyronin được dùng chủ yếu trong test ức chế T<sub>SH</sub> để chẩn đoán phân biệt nghi ngờ cường giáp và tuyến giáp chức năng bình thường ở người bệnh dùng <sup>131</sup>I có trị số cao trong ranh giới bình thường (máp mé cao).

## Dược động học

**Hấp thu:** Sau khi uống, liothyronine natri hấp thu gần hoàn toàn qua đường tiêu hóa (khoảng 95%) trong 4 giờ. Liothyronin có thời gian tiềm tàng rất ngắn, tác dụng xuất hiện trong vòng vài giờ và tác dụng tối đa từ ngày thứ 2 - 3.

**Phân bố:** Trong máu, liothyronine liên kết chủ yếu với globulin liên kết thyroxine (thyroxine-binding globulin: TBG), một lượng nhỏ liên kết với tiền albumin và albumin liên kết thyroxine (thyroxine-binding pre-albumin: TBPA) và thyroxine-binding albumin: TBA). Ái lực liên kết protein huyết tương của liothyronine thấp hơn levothyroxine, do đó liothyronin dễ dàng xâm nhập vào các mô và có thể tích phân bố lớn hơn 4 lần levothyroxine. Sau đó, gan cũng chuyển đổi

triiodothyronin thành nhiều chất chuyển hóa không có hoạt tính. Một lượng nhỏ thuốc (2 - 10%) qua nhau thai.

**Chuyển hóa:** Triiodothyronin được tạo thành một phần ở tuyến giáp và một phần ở gan. Vai trò của gan là chuyển đổi tetriiodothyronin thành triiodothyronin với mức độ cần thiết. Bệnh thận và gan ít ảnh hưởng đến sự chuyển hóa này.

Tác dụng của liothyronin xuất hiện nhanh hơn và thời gian tác dụng ngắn hơn so với levothyroxine. Nửa đời thải trừ của liothyronin ở người có chức năng tuyến giáp bình thường khoảng 1 - 2 ngày và của levothyroxine là 6 - 7 ngày. Nửa đời thải trừ của liothyronin và levothyroxine giảm ở người cường giáp và tăng ở người thiều năng tuyến giáp. Liothyronin không gây tích lũy, khi ngừng điều trị, người bệnh trở về trạng thái chuyển hóa trước điều trị trong vòng 2 - 3 ngày.

Sau khi tiêm tĩnh mạch một liều duy nhất liothyronin natri, đáp ứng chuyển hóa có thể phát hiện được trong vòng 2 - 4 giờ và tác dụng điều trị tối đa trong vòng 2 ngày. Sau khi ngừng đợt điều trị dài ngày, tác dụng tồn tại lâu hơn sự có mặt của lượng nội tiết tố có thể phát hiện được (tối 72 giờ với liothyronin và 1 - 3 tuần với levothyroxine).

**Thải trừ:** Thuốc được thải trừ qua thận và phân.

#### Chỉ định

Liothyronin được chỉ định khi cần có tác dụng nhanh, nhất thời như trong:

**Hỗn mê do thiều năng tuyến giáp:** Có thể dùng đường tiêm, kết hợp với các thuốc khác bao gồm cả corticosteroid tiêm tĩnh mạch. Với trường hợp ít nghiêm trọng hoặc với mục đích duy trì, nên dùng ở dạng uống.

Các hội chứng suy giáp bẩm sinh hoặc mắc phải do bất cứ nguyên nhân nào, trừ trường hợp suy giáp nhất thời trong thời kỳ hồi phục viêm giáp bán cấp. Điều trị hỗ trợ carbimazole để ngăn ngừa suy giáp cận lâm sàng trong quá trình điều trị nhiễm độc giáp bằng carbimazole. Thiều năng tuyến giáp tốt nhất là được điều trị thay thế bằng levothyroxine mà không dùng liothyronin.

**Chẩn đoán rối loạn chức năng tuyến giáp:** Được dùng làm test ứ chẽ để chẩn đoán phân biệt giữa cường giáp nhẹ với bướu giáp thể nang.

Ức chế TSH tuyến yên.

#### Chống chỉ định

Mẫn cảm với liothyronin.

Nhiễm độc tuyến giáp không điều trị.

Suy tim mắt bù; suy mạch vành; loạn nhịp mắt kiểm soát.

Suy thượng thận không hồi phục.

Dùng liothyronin tiêm tĩnh mạch cùng biện pháp làm tăng thân nhiệt nhân tạo cho bệnh nhân.

#### Thận trọng

Không chỉ định liothyronin cho mục đích chống béo phì, làm giảm cân; liều thấp không có tác dụng, liều cao gây nguy hiểm đặc biệt khi kết hợp với các thuốc nhóm amphetamine.

Không dùng để điều trị vô sinh ở nam hoặc nữ trừ khi các tình trạng này có liên quan đến thiều năng tuyến giáp.

Thận trọng cho người mắc bệnh tim mạch, đái tháo nhạt, đái tháo đường (cần tăng liều thuốc chống đái tháo đường, kể cả insulin), người cao tuổi, tăng huyết áp, suy tuyến giáp lâu dài, suy toàn bộ tuyến yên (panhypopituitarism) (phải dùng corticosteroid trước khi chỉ định liothyronin), xu hướng suy vỏ thượng thận (bắt đầu bằng corticosteroid trước khi chỉ định liothyronin).

(Xem thêm các khuyến cáo mục Thận trọng của chuyên luận levothyroxine).

#### Thời kỳ mang thai

Nội tiết tố tuyến giáp có thể qua nhau thai, nhưng chỉ ở mức hạn chế. Nhu cầu liothyronin ở phụ nữ mang thai cao hơn bình thường. Quá thừa hoặc không đủ hormon đều ảnh hưởng đến thai nhi, do đó cần đánh giá chức năng tuyến giáp ở người mẹ trước khi mang thai (nếu có thể), tại thời điểm phát hiện có thai, các lần khám thai theo lịch hẹn, chu kỳ giữa và cuối của giai đoạn mang thai, sau khi sinh (kiểm soát thường xuyên hơn khi bắt đầu hoặc khi chinh liều thuốc liothyronin).

#### Thời kỳ cho con bú

Một lượng nhỏ nội tiết tố tuyến giáp được bài tiết trong sữa người. Người mẹ cho con bú có thể tiếp tục điều trị với liothyronin.

#### Tác dụng không mong muốn (ADR)

Khi quá liều hoặc tăng liều quá nhanh, có nguy cơ xảy ra những triệu chứng như khi cường giáp, gồm đánh trống ngực, nhịp tim nhanh, loạn nhịp tim, đau thắt ngực. Những triệu chứng này liên quan trực tiếp với sự tăng nồng độ T<sub>3</sub>. Khi đó, ngừng thuốc trong 2 - 3 ngày, rồi lại tiếp tục với liều hàng ngày thấp hơn.

#### Ít gặp

Tim mạch: đánh trống ngực, nhịp tim nhanh, loạn nhịp tim, đau ngực.

TKTW: tình trạng kích động, mất ngủ, sốt, nhức đầu, mất điều hòa.

Da: rụng tóc lông.

Nội tiết và chuyển hóa: thay đổi trong chu kỳ kinh nguyệt.

Tiêu hóa: sút cân, tăng ngon miệng, ỉa chảy, co cứng cơ bụng.

Thần kinh cơ và xương: đau cơ, run bàn tay, run.

Hô hấp: hơi thở ngắn.

Khác: toát mồ hôi.

Trẻ em: có thể tăng calci niêu.

#### Hiếm gặp

Phản ứng dị ứng trên da.

#### Hướng dẫn cách xử trí ADR

Có thể giảm tỷ lệ ADR bằng cách tăng chậm liều ban đầu tới liều tối thiểu có hiệu lực. Trẻ em có thể bị rụng tóc ở những tháng đầu điều trị, nhưng không cần ngừng thuốc, tóc thường mọc lại, ngay cả khi tiếp tục dùng thuốc. Có thể giảm bớt ADR như tăng hoạt động ở trẻ em bằng dùng liều bắt đầu tương đương một phần tư liều thay thế đầy đủ, rồi mỗi tuần tăng thêm một phần tư cho tới khi đạt liều thay thế đầy đủ. Nếu xảy ra triệu chứng cường giáp, ngừng thuốc trong 2 - 3 ngày sau đó dùng lại với liều thấp hơn. Nếu xảy ra ADR tim mạch, phải giảm liều liothyronin.

#### Liều lượng và cách dùng

##### Cách dùng

Phải hiệu chỉnh liều theo từng người bệnh dựa trên đáp ứng lâm sàng, xét nghiệm sinh hóa và phải giám sát đều đặn.

Cần đánh giá đáp ứng điều trị sau mỗi 6 - 8 tuần. Khi chức năng tuyến giáp và nồng độ TSH trở về bình thường, có thể đánh giá thua hơn, sau mỗi 6 - 12 tháng. Tuy nhiên, nếu thay đổi liều levothyroxine, nồng độ TSH cần được kiểm tra sau 8 - 12 tuần.

Khi bệnh nhân chuyển từ chế phẩm tuyến giáp khác sang sử dụng liothyronin, có thể ngừng ngay chế phẩm tuyến giáp và bắt đầu điều trị với liothyronin ở liều thấp rồi tăng dần từng lượng nhỏ sau khi thuốc trước hết tác dụng. Ngược lại khi bệnh nhân chuyển từ liothyronin sang sử dụng chế phẩm tuyến giáp khác cần nhớ rằng tác dụng của liothyronin bắt đầu và hết tương đối nhanh, nên để tránh tái phát, cần phải sử dụng chế phẩm tuyến giáp khác vài ngày trước khi ngừng hẳn liothyronin.

##### Liều lượng

Liều dùng liothyronin dưới đây được biểu thị theo khối lượng của liothyronin natri. 20 - 25 microgam natri liothyronin tương đương khoảng 100 microgam natri levothyroxine.

### Hỗn mè do thiếu năng tuyến giáp

Tiêm tĩnh mạch chậm liều ban đầu 5 - 20 microgam, nhắc lại sau 12 giờ hoặc ít hơn nếu cần. Khoảng cách giữa các lần đura thuốc tối thiểu là 4 giờ. Cũng có thể dùng liều khởi đầu 50 microgam tiêm tĩnh mạch chậm, sau đó cứ 8 giờ dùng thêm 1 liều 25 microgam cho đến khi có đáp ứng, giảm liều xuống 25 microgam/lần, dùng 2 lần trong ngày. Có thể dùng đường uống 60 microgam qua ống thông dạ dày, sau đó 20 microgam mỗi 8 giờ. Tuy nhiên thường nên bắt đầu với đường tiêm tĩnh mạch hơn.

Chi định thêm corticosteroid là cần thiết để ngăn ngừa sốc do suy vỏ thượng thận cấp (xem phần Thận trọng).

Liệu pháp hormon giáp đường uống nên được dùng ngay khi tình trạng người bệnh đã ổn định và có thể uống được thuốc. Nếu dùng liothyronin đường uống nên bắt đầu bằng liều thấp ngay khi ngừng tiêm và tăng liều từ từ theo đáp ứng của bệnh nhân. Nếu sau khi tiêm liothyronin dự kiến dùng levothyroxin đường uống, cần lưu ý sự đáp ứng trễ của levothyroxin so với liothyronin, trường hợp này cần giảm liều liothyronin đường tiêm từ từ trước khi ngừng hẳn.

### Điều trị thiếu năng giáp

#### Người lớn

Liều uống ban đầu thông thường từ 5 đến 25 microgam/ngày, tăng liều từ từ để đạt đến liều duy trì khoảng 60 đến 75 microgam/ngày chia làm 2 - 3 lần; một số trường hợp liều duy trì có thể tăng đến 100 microgam/ngày. Đối với người cao tuổi, người bị bệnh tim mạch hoặc với người bị thiếu năng tuyến giáp nặng lâu ngày, điều trị phải từ từ hơn, dùng liều ban đầu thấp hơn (2,5 - 5 microgam/24 giờ), liều tăng nhò hơn và khoảng cách giữa các lần tăng thuốc cũng dài hơn khi cần.

#### Trẻ em

**Thiếu năng tuyến giáp bẩm sinh:** Levothyroxin là thuốc thường được chọn để dùng. Nhưng liothyronin cũng đã được dùng với liều: Uống 5 microgam, ngày 1 lần; tăng liều 5 microgam mỗi lần, cách 3 - 4 ngày, cho tới khi đạt kết quả mong muốn. Liều duy trì: Trẻ em dưới 1 tuổi: Liều có thể tới 20 microgam/ngày.

Trẻ em từ 1 đến 3 tuổi: Liều có thể tới 50 microgam/ngày.

Trẻ em trên 3 tuổi: Dùng liều như người lớn.

**Hỗ trợ carbimazol trong điều trị nhiễm độc giáp bằng carbimazol:** 20 microgam mỗi 8 giờ.

#### Chẩn đoán rối loạn chức năng tuyến giáp:

Cho uống 75 - 100 microgam liothyronin mỗi ngày, trong 7 ngày. Xác định lượng iod phóng xạ  $I^{131}$  hấp thu trước và sau đợt uống 7 ngày liothyronin nói trên. Với người bệnh cường giáp, lượng iod phóng xạ hấp thu sẽ không thay đổi đáng kể, trái lại với người có chức năng tuyến giáp bình thường, lượng iod phóng xạ hấp thu sẽ bị giảm xuống dưới 20% trị số ban đầu.

#### Ức chế TSH tuyến yên (Bướu giáp đơn thuần, không độc):

Sử dụng đường uống. Liều ban đầu 5 microgam/ngày. Tăng 5 - 10 microgam mỗi ngày trong từ 1 - 2 tuần. Khi đạt đến liều 25 microgam/ngày, có thể tăng thêm 12,5 hoặc 25 microgam mỗi ngày trong 1 đến 2 tuần cho đến khi đạt được đáp ứng mong muốn. Liều duy trì thông thường là 75 microgam mỗi ngày.

#### Tương tác thuốc

Hormon tuyến giáp làm tăng tác dụng của thuốc chống đông đường uống (do tăng chuyển hóa các yếu tố gây đông máu của phức hợp thrombin) và dễ dẫn đến nguy cơ chảy máu. Cần theo dõi thường xuyên chỉ số prothrombin, chỉ số INR và điều chỉnh liều thuốc chống đông đường uống khi dùng trên những bệnh nhân thiếu năng giáp đang điều trị thay thế với hormon tuyến giáp hoặc bệnh nhân cường giáp.

Amiodaron làm giảm chuyển hóa từ thyroxin thành triiodothyronin, tăng nguy cơ rối loạn chức năng tuyến giáp. Tránh kết hợp hai thuốc này.

Colestyramin làm giảm hấp thu liothyronin tại ổng tiêu hóa. Trường hợp cần dùng liothyronin đường uống cùng với thuốc trên phải uống cách nhau ít nhất 2 tiếng.

Các thuốc carbamazepin, phenobarbital, phenytoin, primidon, barbiturat, griseofulvin, rifampicin làm giảm tác dụng của liothyronin do cảm ứng enzym làm tăng chuyển hóa T<sub>3</sub>. Theo dõi nồng độ T<sub>3</sub>, TSH trong máu và hiệu chỉnh liều hormon giáp là cần thiết trong quá trình điều trị cùng với các thuốc gây cảm ứng enzym hoặc khi ngừng các thuốc này.

Liothyronin làm tăng tính nhạy của thụ thể đối với catecholamin, dẫn tới tăng nguy cơ kích ứng hệ TKTW (cũng như loạn nhịp tim) khi dùng chung với thuốc chống trầm cảm ba vòng hoặc bốn vòng.

Khi dùng đồng thời, liothyronin có thể làm tăng nhu cầu thuốc trị đái tháo đường; cần cẩn thận theo dõi kiểm soát đái tháo đường, đặc biệt khi bắt đầu, thay đổi hoặc ngừng điều trị với hormon tuyến giáp. Việc sử dụng đồng thời với estrogen có thể làm tăng nhu cầu về liothyronin do tăng nồng độ globulin gắn thyroxin trong huyết thanh. Hormon tuyến giáp có thể làm tăng tốc độ chuyển hóa của digitalis, do đó cần tăng liều digitalis.

Các thuốc hoạt động trên đường tiêu hóa (antacid, simethicon, sulcralfat) làm chậm hoặc giảm hấp thu liothyronin, do đó dùng liothyronin cách các thuốc trên tối thiểu 4 giờ.

#### Quá liều và xử trí

Khi dùng quá liều dài ngày, nếu xảy ra các triệu chứng cường giáp, phải ngừng liothyronin trong 1 - 2 ngày, sau đó dùng lại với liều thấp hơn.

Khi quá liều cấp tính với liều lớn, nếu có thể được, làm giảm hấp thu qua đường tiêu hóa bằng cách gây nôn và sau đó điều trị triệu chứng và hỗ trợ, gồm: rửa dạ dày; cho thở oxygen; dùng glycosid trợ tim nếu xảy ra suy tim sung huyết; điều trị sốt, giảm đường huyết hoặc mất dịch; dùng thuốc kháng adrenergic như propranolol để điều trị chứng tăng hoạt tính thần kinh giao cảm, ví dụ nhịp tim nhanh.

Cập nhật lần cuối: 2021.

## LIRAGLUTID

**Tên chung quốc tế:** Liraglutide.

**Mã ATC:** A10BJ02.

**Loại thuốc:** Thuốc điều trị đái tháo đường, chất tương tự glucagon-like peptid-1 (GLP-1).

#### Dạng thuốc và hàm lượng

Bút tiêm nắp sẵn thuốc: 18 mg/3 ml (mỗi ml dung dịch có chứa 6 mg liraglutid sản xuất bằng kỹ thuật tái tổ hợp DNA trong tế bào *Saccharomyces cerevisiae*).

#### Dược lực học

Liraglutid là một chất tương tự GLP-1 có trình tự chuỗi tương đồng 97% với GLP-1 của người. Thuốc gắn kết và hoạt hóa receptor GLP-1. Các receptor GLP-1 là đích đối với GLP-1 tự nhiên, một loại hormone incretin nội sinh có tác dụng làm tăng tiết insulin phụ thuộc vào glucose từ các tế bào beta của tuyến tụy. Không giống như GLP-1 tự nhiên, liraglutid có đặc điểm được động học và được lực học ở người thích hợp để dùng 1 lần/ngày. Sau khi tiêm dưới da, đặc tính tác dụng kéo dài của liraglutid dựa trên ba cơ chế: tự kết hợp, dẫn đến sự hấp thu chậm; liên kết với albumin; và tính ổn định với enzym cao hơn đối với các enzym dipeptidyl peptidase-4 (DPP-4) và endopeptidase (NEP) trung tính, dẫn đến nửa đời thải trừ trong huyết tương dài.

Hoạt động của liraglutid được thực hiện thông qua tương tác đặc hiệu với các receptor GLP-1, dẫn đến sự gia tăng adenosin