

Rx

OMCAGLIM 1 TABLET

- Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc
- Để thuốc xa tầm tay trẻ em.
- Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

1. Thành phần công thức thuốc:

Mỗi viên nén không bao chứa:

Thành phần được chất: glimepirid 1 mg

Thành phần tá dược: microcrystalline cellulose (101), lactose monohydrate, sodium starch glycolate, maize starch, magnesium stearate, purified talc, F.D & C Blue No. 1, nước tinh khiết*

* Dung môi bay hơi trong quá trình sản xuất

2. Dạng bào chế: Viên nén không bao

Mô tả: Viên nén màu xanh nhạt, phẳng, hình thuôn dài, một mặt có khía, một mặt nhẵn.

3. Chỉ định:

Glimepirid được chỉ định điều trị đái tháo đường typ 2 khi mức glucose huyết không được kiểm soát đầy đủ bằng chế độ ăn kiêng, tập thể dục và giảm cân.

4. Cách dùng, liều dùng:

Liều dùng

Cơ sở để điều trị thành công bệnh đái tháo đường là chế độ ăn uống tốt, hoạt động thể chất thường xuyên, cũng như xét nghiệm máu và nước tiểu thường xuyên. Uống thuốc hoặc insulin không thể cải thiện nếu bệnh nhân không tuân thủ chế độ ăn uống được khuyến nghị.

Liều dùng được xác định bởi kết quả xét nghiệm glucose máu và nước tiểu.

Liều khởi đầu là 1 mg glimepirid mỗi ngày. Nếu kiểm soát tốt, liều này nên được sử dụng cho điều trị duy trì.

Với các chế độ liều khác nhau sẽ có sẵn các hàm lượng phù hợp.

Nếu không đạt yêu cầu về kiểm soát đường huyết, nên tăng liều, dựa trên mức độ kiểm soát đường huyết, theo từng bậc với khoảng thời gian khoảng 1 đến 2 tuần giữa mỗi bước, từ 2, 3 hoặc 4 mg glimepirid mỗi ngày.

Một liều hơn 4 mg glimepirid mỗi ngày cho kết quả tốt hơn chỉ trong những trường hợp đặc biệt. Liều tối đa được khuyến cáo là 6 mg glimepirid mỗi ngày.

Ở những bệnh nhân không được kiểm soát đầy đủ với liều metformin tối đa hàng ngày, có thể bắt đầu liệu pháp dùng đồng thời với glimepirid.

Trong khi duy trì liều metformin, liệu pháp glimepirid được bắt đầu ở liều thấp, và sau đó được điều chỉnh tùy thuộc vào mức độ kiểm soát mong muốn cho đến liều tối đa hàng ngày. Cần bắt đầu liệu pháp kết hợp dưới sự giám sát y tế chặt chẽ.



Ở những bệnh nhân không được kiểm soát đầy đủ với liều glimepirid tối đa hàng ngày, có thể bắt đầu liệu pháp insulin đồng thời nếu cần thiết. Trong khi duy trì liều glimepirid, điều trị insulin được bắt đầu ở liều thấp và điều chỉnh tùy thuộc vào mức độ kiểm soát mong muốn. Cần bắt đầu liệu pháp kết hợp dưới sự giám sát y tế chặt chẽ.

Thông thường một liều glimepirid hàng ngày là đủ. Khuyến cáo dùng thuốc ngay trước hoặc trong một bữa ăn sáng thật sự hoặc - nếu không thực hiện được - có thể dùng ngay trước hoặc trong bữa ăn chính đầu tiên.

Nếu quên dùng thuốc, không nên tăng liều ở lần dùng tiếp theo.

Nếu một bệnh nhân có phản ứng hạ đường huyết với liều glimepirid 1g mỗi ngày, điều này cho thấy rằng họ có thể kiểm soát bằng chế độ ăn uống mà không cần dùng thuốc.

Trong quá trình điều trị, vì sự cải thiện trong việc kiểm soát bệnh đái tháo đường có liên quan đến độ nhạy insulin cao hơn, liều glimepirid có thể giảm. Do đó, để tránh hạ đường huyết, phải xem xét giảm liều hoặc ngừng điều trị. Thay đổi liều lượng cũng có thể là cần thiết, nếu có những thay đổi về cân nặng hoặc lối sống của bệnh nhân, hoặc các yếu tố khác làm tăng nguy cơ hạ đường huyết hoặc tăng đường huyết.

Chuyển từ các thuốc hạ đường huyết đường uống khác sang glimepirid

Có thể thực hiện chuyển đổi từ các thuốc hạ đường huyết đường uống khác sang glimepirid. Để chuyển sang glimepirid, hàm lượng và thời gian bán hủy của thuốc trước đó phải được tính đến. Trong một số trường hợp, đặc biệt là ở thuốc điều trị đái tháo đường có thời gian bán hủy dài (ví dụ clorpropamid), nên chờ vài ngày để giảm thiểu nguy cơ phản ứng hạ đường huyết do tác dụng phụ gia tăng.

Liều khởi đầu được khuyến cáo là 1 mg glimepirid mỗi ngày. Dựa trên đáp ứng, liều lượng glimepirid có thể được tăng lên từng bước, như đã chỉ ra trước đó.

Chuyển từ insulin sang glimepirid

Trong những trường hợp đặc biệt, khi bệnh nhân đái tháo đường typ 2 được kiểm soát bằng insulin, có thể chỉ định chuyển sang glimepirid. Việc chuyển đổi nên được thực hiện dưới sự giám sát y tế chặt chẽ.

Đối tượng đặc biệt

Bệnh nhân suy gan hoặc thận:

Xem phần “*Chống chỉ định*”

Trẻ em:

Không có dữ liệu có sẵn về việc sử dụng glimepirid ở bệnh nhân dưới 8 tuổi. Đối với trẻ em từ 8 đến 17 tuổi, có rất ít dữ liệu về glimepirid dưới dạng đơn trị liệu.

Không đủ dữ liệu có sẵn về tính an toàn và hiệu quả và do đó không nên sử dụng thuốc ở trẻ em.

Cách dùng

Dùng đường uống



5. Chống chỉ định:

Mẫn cảm với glimepirid, các sulfonylure hoặc sulfonamid khác hay bất kỳ thành phần nào của thuốc.

Đái tháo đường phụ thuộc insulin, hôn mê và nhiễm keto-acid do đái tháo đường.

Rối loạn chức năng gan hoặc thận nặng: Nên chuyển sang dùng insulin.

6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:

Thuốc phải được dùng ngay trước hoặc trong bữa ăn.

Việc ăn uống không đúng giờ hoặc bỏ bữa có thể dẫn đến hạ đường huyết khi điều trị bằng glimepirid. Các triệu chứng có thể có của hạ đường huyết bao gồm: đau đầu, đói cồn cào, buồn nôn, nôn, mệt mỏi, buồn ngủ, rối loạn giấc ngủ, bồn chồn, hung hăng, suy giảm khả năng tập trung, giảm sự tỉnh táo và tốc độ phản ứng, trầm cảm, nhầm lẫn, rối loạn ngôn ngữ và thị giác, mất ngôn ngữ, run, liệt nhẹ, rối loạn cảm giác, chóng mặt, mất sức, mất khả năng tự kiểm soát, mê sảng, co giật não, ngù gà và mất ý thức đến đến hôn mê, thở nông và nhịp tim chậm. Ngoài ra, các dấu hiệu của điều hoà ngược adrenergic có thể xuất hiện như đỏ mào hôi, da lạnh, lo lắng, nhịp tim nhanh, tăng huyết áp, đánh trống ngực, đau thắt ngực và rối loạn nhịp tim.

Hình ảnh lâm sàng của cơn hạ đường huyết nghiêm trọng có thể giống như đột quỵ.

Các triệu chứng hầu như luôn có thể được cải thiện ngay sau khi dùng carbohydrat (đường).

Chất làm ngọt nhân tạo không có hiệu quả.

Kinh nghiệm từ việc sử dụng các sulphonylure khác cho thấy, mặc dù việc điều trị bước đầu thành công những vẫn có thể bị hạ đường huyết tái phát.

Hạ đường huyết nặng hoặc hạ đường huyết kéo dài có thể chỉ tạm thời được kiểm soát bằng cách dùng đường, những vẫn cần điều trị y tế ngay lập tức và đôi khi phải nhập viện.

Các yếu tố thuận lợi gây ra hạ đường huyết bao gồm:

- bệnh nhân không hợp tác hoặc (phổ biến hơn ở bệnh nhân cao tuổi) không đủ khả năng hợp tác,
- suy dinh dưỡng, giờ ăn không đều hoặc bỏ bữa hoặc nhịn ăn kéo dài,
- thay đổi chế độ ăn uống,
- không cân đối lượng carbohydrat với chế độ luyện tập,
- sử dụng rượu, đặc biệt khi kết hợp bỏ bữa,
- suy giảm chức năng thận,
- rối loạn chức năng gan nghiêm trọng,
- dùng quá liều glimepirid,
- một số rối loạn nội tiết mất bù liên quan đến chuyển hóa carbohydrat hoặc cơ chế điều hoà ngược của hạ đường huyết (ví dụ như rối loạn chức năng tuyến giáp và thùy trước tuyến yên hoặc suy vỏ thượng thận),
- sử dụng đồng thời một số sản phẩm thuốc khác (xem *Tương tác thuốc*).



Điều trị bằng glimepirid đòi hỏi phải theo dõi thường xuyên nồng độ glucose trong máu và nước tiểu. Ngoài ra, khuyến cáo xác định tỷ lệ haemoglobin glycosyl hóa (HbA1c).

Cần kiểm tra gan và huyết học thường xuyên (đặc biệt là bạch cầu và tiểu cầu) trong quá trình điều trị bằng glimepirid.

Trong các tình huống stress (ví dụ: tai nạn, phẫu thuật cấp, sốt nhiễm khuẩn...), có thể chỉ định tạm thời chuyển sang dùng insulin.

Không có kinh nghiệm nào liên quan đến việc sử dụng glimepirid ở những bệnh nhân bị suy giảm nghiêm trọng chức năng gan hoặc bệnh nhân đang thẩm tách máu. Ở những bệnh nhân bị suy giảm nghiêm trọng chức năng thận hoặc gan, nên chuyển sang dùng insulin.

Điều trị bằng các ulfonylurea cho bệnh nhân bị thiếu G6PD có thể dẫn đến thiếu máu tán huyết. Vì glimepirid thuộc nhóm thuốc sulfonylurea, cần thận trọng ở những bệnh nhân thiếu G6PD và cần cân nhắc lựa chọn thay thế không sulfonylurea.

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

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

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:

Rủi ro liên quan đến bệnh đái tháo đường

Mức đường huyết bất thường trong thai kỳ có liên quan đến tỷ lệ mắc các bất thường bẩm sinh và tỷ lệ tử vong chu sinh cao hơn. Vì vậy, mức đường huyết phải được theo dõi chặt chẽ trong thai kỳ để tránh nguy cơ gây quái thai. Việc sử dụng insulin là bắt buộc trong những trường hợp như vậy. Bệnh nhân dự định mang thai nên thông báo cho bác sĩ.

Rủi ro liên quan đến glimepirid

Không có dữ liệu đầy đủ từ việc sử dụng glimepirid ở phụ nữ mang thai. Các nghiên cứu trên động vật cho thấy có độc tính trên khả năng sinh sản liên quan đến tác dụng dược lý (hạ đường huyết) của glimepirid.

Do đó, glimepirid không nên được sử dụng trong toàn bộ thai kỳ.

Trong trường hợp điều trị bằng glimepirid, nếu bệnh nhân có kế hoạch mang thai hoặc nếu phát hiện có thai, việc điều trị nên được chuyển đổi càng sớm càng tốt sang liệu pháp insulin.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú:

Không rõ thuốc có được bài tiết vào sữa người hay không. Glimepirid được bài tiết qua sữa chuột. Vì các sulfonylure khác được bài tiết qua sữa mẹ và vì có nguy cơ gây hạ đường huyết ở trẻ bú mẹ, không nên cho trẻ bú trong quá trình điều trị bằng glimepirid.

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

Chưa có nghiên cứu nào về ảnh hưởng của thuốc đến khả năng lái xe và sử dụng máy móc được thực hiện.



Khả năng tập trung và phản ứng của bệnh nhân có thể bị suy giảm do hạ đường huyết hoặc tăng đường huyết hoặc, ví dụ, suy giảm thị lực. Điều này có thể gây rủi ro trong các tình huống đặc biệt quan trọng (ví dụ: lái xe ô tô hoặc vận hành máy móc).

Bệnh nhân được khuyên nên thực hiện các biện pháp phòng ngừa để tránh hạ đường huyết trong khi lái xe. Điều này đặc biệt quan trọng ở những người đã giảm hoặc không nhận thức được các triệu chứng cảnh báo hạ đường huyết hoặc thường xuyên bị hạ đường huyết. Cần xem xét liệu có nên lái xe hoặc vận hành máy móc trong những trường hợp này hay không.

9. Tương tác, tương kỵ của thuốc:

Nếu glimepirid được sử dụng đồng thời với một số thuốc khác, cả sự tăng và giảm không mong muốn về tác dụng hạ đường huyết của glimepirid đều có thể xảy ra. Vì lý do này, việc sử dụng các thuốc khác chỉ nên được thực hiện dưới sự chỉ dẫn của bác sĩ.

Glimepirid được chuyển hóa bởi cytochrom P450 2C9 (CYP2C9). Sự chuyển hoá của thuốc được biết là bị ảnh hưởng bởi việc sử dụng đồng thời các chất gây cảm ứng CYP2C9 (ví dụ như rifampicin) hoặc các chất ức chế (ví dụ fluconazol).

Kết quả từ một nghiên cứu tương tác *in vivo* được báo cáo trong tài liệu cho thấy AUC của glimepirid tăng khoảng 2 lần bởi fluconazol, một trong những chất ức chế CYP2C9 mạnh nhất. Dựa trên kinh nghiệm với glimepirid và với các sulphonylure khác, các tương tác sau đây phải được đề cập.

Trong một số trường hợp, hạ đường huyết có thể xảy ra khi một trong các thuốc sau đây được sử dụng, ví dụ:

- phenylbutazon, azapropazone và oxyfenbutazon,
- insulin và các thuốc điều trị đái tháo đường đường uống, chẳng hạn metformin,
- các salicylat và acid p-amino-salicylic,
- các steroid đồng hoá và hormon sinh dục nam,
- chloramphenicol, một số sulfonamid tác dụng kéo dài, các tetracyclin, các kháng sinh quinolon và clarithromycin,
- thuốc chống đông máu dẫn xuất coumarin,
- fenfluramin,
- disopyramid
- các fibrat,
- các thuốc ức chế ACE,
- fluoxetin, các thuốc ức chế MAO,
- allopurinol, probenecid, sulfinpyrazon,
- các thuốc ức chế giao cảm,
- cyclophosphamid, trophosphamid và các iphosphamid,
- miconazol, fluconazol.
- pentoxifyllin (tiêm liều cao),



- tritoqualin

Làm suy yếu tác dụng hạ đường huyết và do đó tăng lượng đường trong máu có thể xảy ra khi một trong các thuốc sau đây được sử dụng, ví dụ:

- các oestrogen và progestogen,
- các thuốc lợi tiểu thải muối, các thuốc lợi tiểu thiazid,
- các thuốc cường giáp, glucocorticoid,
- các dẫn xuất phenothiazin, chlorpromazin,
- adrenalin và các thuốc cường giao cảm,
- acid nicotinic (liều cao) và các dẫn xuất,
- thuốc nhuận tràng (sử dụng kéo dài),
- phenytoin, diazoxid,
- glucagon, các barbiturat và rifampicin,
- acetazolamid.

Thuốc đối kháng H_2 , thuốc chẹn beta, clonidin và reserpin có thể dẫn đến tăng hoặc làm suy yếu tác dụng hạ đường huyết.

Dưới ảnh hưởng của các thuốc ức chế giao cảm như thuốc chẹn beta, clonidin, guanethidin và reserpin, các dấu hiệu của điều hoà ngược adrenergic đối với hạ đường huyết có thể giảm hoặc bị che lấp.

Uống rượu có thể làm tăng hoặc giảm tác dụng hạ đường huyết của glimepirid một cách không thể đoán trước.

Glimepirid có thể làm tăng hoặc làm giảm tác dụng của các dẫn xuất coumarin.

Colesevelam liên kết với glimepirid và làm giảm sự hấp thụ glimepirid qua đường tiêu hóa. Không có tương tác được ghi nhận khi glimepirid được uống ít nhất 4 giờ trước khi dùng colesevelam. Do đó, glimepirid nên được dùng ít nhất 4 giờ trước khi dùng colesevelam.

Tương kỵ:

Do chưa 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:

Các phản ứng bất lợi sau đây là từ các nghiên cứu lâm sàng dựa trên kinh nghiệm với glimepirid và các sulfonylure khác, được liệt kê theo hệ thống cơ quan và theo tần suất (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: $\geq 1/10.000$ đến $< 1/1.000$; rất hiếm gặp: $< 1/10.000$), chưa rõ (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn).

Rối loạn máu và hệ bạch huyết:

Hiếm gặp: giảm tiểu cầu, giảm bạch cầu, giảm bạch cầu hạt, mất bạch cầu hạt, giảm hồng cầu, thiếu máu tán huyết và giảm toàn thể huyết cầu, nhìn chung thường phục hồi khi ngừng thuốc.

Chưa rõ: giảm tiểu cầu nặng với số lượng tiểu cầu dưới $10.000/\mu l$ kèm ban xuất huyết giảm tiểu cầu.



Rối loạn hệ miễn dịch

Rất hiếm gặp: viêm mạch huyết bạch cầu, phản ứng quá mẫn nhẹ có thể tiến triển nặng kèm theo khó thở, giảm huyết áp và đôi khi gây sốc.

Chưa rõ: có thể gây dị ứng chéo với các sulfonamide, sulfonamid hoặc các chất liên quan.

Rối loạn chuyển hoá và dinh dưỡng

Hiếm gặp: hạ đường huyết.

Những phản ứng hạ đường huyết này chủ yếu xảy ra ngay lập tức, có thể nặng lên và không phải lúc nào cũng dễ điều chỉnh. Sự xuất hiện của các phản ứng như vậy phụ thuộc, như với các liệu pháp hạ đường huyết khác, vào các yếu tố riêng của từng bệnh nhân như thói quen ăn kiêng và liều lượng.

Rối loạn thị giác

Chưa rõ: rối loạn thị giác tạm thời, có thể xảy ra đặc biệt là khi bắt đầu điều trị, do những thay đổi về lượng đường trong máu.

Rối loạn tiêu hoá

Hiếm gặp: rối loạn vị giác.

Rất hiếm gặp: buồn nôn, nôn, tiêu chảy, chướng bụng, khó chịu ở bụng và đau bụng, hiếm khi dẫn đến ngừng điều trị.

Rối loạn gan mật

Rất hiếm gặp: chức năng gan bất thường (ví dụ như ứ mật và vàng da), viêm gan và suy gan.

Chưa rõ: enzym gan tăng

Rối loạn da và mô dưới da

Hiếm: rụng tóc.

Chưa rõ: phản ứng quá mẫn của da có thể xảy ra như ngứa, phát ban, nổi mề đay và nhạy cảm ánh sáng.

Các xét nghiệm

Hiếm gặp: tăng cân

Rất hiếm gặp: natri máu giảm.

Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi dùng thuốc.

11. Quá liều và cách xử trí:

Triệu chứng

Sau khi uống quá liều thuốc, hạ đường huyết có thể xảy ra, kéo dài từ 12 đến 72 giờ và có thể tái phát sau khi hồi phục bước đầu. Các triệu chứng có thể không xuất hiện trong tối đa 24 giờ sau khi uống. Nhìn chung cần theo dõi ở bệnh viện. Buồn nôn, nôn và đau vùng thượng vị có thể xảy ra. Hạ đường huyết nói chung có thể đi kèm với các triệu chứng thần kinh như bồn chồn, run, rối loạn thị giác, rối loạn khả năng phối hợp, buồn ngủ, hôn mê và co giật.

Xử trí



Điều trị chủ yếu bao gồm ngăn chặn sự hấp thu bằng cách gây nôn và sau đó uống nước lọc hoặc nước chanh với than hoạt tính (chất hấp phụ) và natri sulphat (thuốc nhuận tràng). Nếu quá liều một lượng lớn thuốc, phải rửa dạ dày, sau đó dùng than hoạt tính và natri sulphat. Trong trường hợp quá liều (nặng) cần nhập viện trong khoa chăm sóc đặc biệt. Bắt đầu sử dụng glucose càng sớm càng tốt, nếu cần thiết bằng cách tiêm tĩnh mạch nhanh 50 ml dung dịch 50%, sau đó truyền dung dịch 10% với sự theo dõi chặt chẽ đường huyết. Tiếp theo nên điều trị triệu chứng.

Trẻ em

Đặc biệt khi điều trị hạ đường huyết do vô tình uống glimepirid ở trẻ sơ sinh và trẻ nhỏ, liều glucose được cung cấp phải được kiểm soát cẩn thận để tránh khả năng gây tăng đường huyết nguy hiểm. Đường huyết cần được theo dõi chặt chẽ.

12. Đặc tính dược lực học:

Nhóm dược lý: *Thuốc giảm glucose huyết, trừ insulin: các sulfonamid, dẫn chất của urê.*

Mã ATC: *A10BB12*

Glimepirid là một thuốc trị đái tháo đường thuộc nhóm sulphonylure. Nó có thể được sử dụng trong đái tháo đường không phụ thuộc insulin.

Cơ chế tác dụng

Tác dụng chủ yếu của glimepiride là kích thích tế bào beta tuyến tụy giải phóng insulin.

Cũng như các sulphonylure khác, tác dụng này dựa trên sự gia tăng khả năng đáp ứng của các tế bào beta tuyến tụy với kích thích glucose sinh lý. Ngoài ra, glimepirid cũng có tác dụng ngoài tuyến tụy như các sulphonylure khác.

Giải phóng insulin

Sulphonylurea điều chỉnh bài tiết insulin bằng cách đóng kênh kali phụ thuộc ATP ở màng tế bào beta. Việc đóng kênh kali gây khử cực màng, làm mở kênh calci khiến ion calci tăng gia nhập vào trong tế bào. Điều này dẫn đến kích thích giải phóng insulin theo cơ chế xuất bào.

Glimepirid liên kết với tỷ lệ cao với protein màng tế bào beta có liên quan đến kênh kali phụ thuộc ATP nhưng khác với vị trí liên kết sulphonylure thông thường.

Tác dụng ngoài tuyến tụy

Các tác dụng ngoài tuyến tụy bao gồm cải thiện độ nhạy cảm của mô ngoại vi đối với insulin và giảm sự hấp thu insulin của gan.

Sự hấp thu glucose từ máu vào các mô cơ và mỡ ngoại vi xảy ra thông qua các protein vận chuyển đặc biệt, nằm trên màng tế bào. Việc vận chuyển glucose trong các mô này là bước hạn chế tốc độ trong quá trình sử dụng glucose. Glimepirid tăng rất nhanh số lượng các phân tử vận chuyển glucose hoạt động trên màng plasma của các tế bào cơ và mỡ, dẫn đến sự hấp thu glucose được kích thích.



Glimepiride làm tăng hoạt tính của phospholipase C đặc hiệu với glycosyl-phosphatidylinositol, yếu tố có thể có mối tương quan với quá trình tổng hợp lipid và glycogen do thuốc trên các tế bào cơ và chất béo được ly trích.

Glimepirid ức chế tân tạo glucose ở gan bằng cách tăng nồng độ nội bào của fructose-2,6-bisphosphat, từ đó ức chế quá trình tân tạo glucose.

Tác dụng toàn thân

Ở những người khỏe mạnh, liều uống hiệu quả tối thiểu là khoảng 0,6 mg. Tác dụng của glimepirid phụ thuộc vào liều lượng và có thể lặp lại. Đáp ứng sinh lý đối với hoạt động thể lực cấp, giảm bài tiết insulin, vẫn còn duy trì khi dùng glimepirid.

Không có sự khác biệt đáng kể về hiệu quả bất kể thuốc được uống 30 phút trước hay ngay trước bữa ăn. Ở bệnh nhân đái tháo đường, có thể kiểm soát glucose huyết tốt trong 24 giờ với một liều duy nhất hàng ngày.

Mặc dù chất chuyển hóa hydroxy của glimepirid gây ra sự giảm glucose huyết thanh nhỏ nhưng đáng kể ở những người khỏe mạnh, nó chỉ chiếm một phần nhỏ trong tổng tác dụng của thuốc.

Liều pháp kết hợp với metformin

Kiểm soát glucose huyết được cải thiện đối với liệu pháp dùng đồng thời glimepirid so với metformin đơn thuần ở những bệnh nhân không được kiểm soát đầy đủ với liều metformin tối đa đã được chỉ ra trong một nghiên cứu.

Liều pháp kết hợp với insulin

Dữ liệu cho liệu pháp kết hợp với insulin còn hạn chế. Ở những bệnh nhân không được kiểm soát đầy đủ với liều glimepirid tối đa, có thể bắt đầu liệu pháp insulin đồng thời. Trong hai nghiên cứu, sự kết hợp đã đạt được sự cải thiện tương tự trong việc kiểm soát trao đổi chất như insulin đơn thuần; tuy nhiên, một liều insulin trung bình thấp hơn được yêu cầu trong liệu pháp kết hợp.

Đối tượng đặc biệt

Trẻ em:

Sau khi điều trị glimepirid, không có các vấn đề an toàn mới được ghi nhận ở trẻ em so với bệnh nhân người lớn bị đái tháo đường typ 2. Không có dữ liệu về hiệu quả và an toàn lâu dài có sẵn ở bệnh nhân nhi.

13. Đặc tính dược động học:

Hấp thu

Glimepirid có sinh khả dụng đường uống rất cao. Thức ăn không có ảnh hưởng liên quan đến sự hấp thu, chỉ có tốc độ hấp thu giảm đi một chút. Nồng độ tối đa trong huyết thanh (C_{max}) đạt được khoảng 2,5 giờ sau khi uống (trung bình 0,3 $\mu\text{g/ml}$ trong nhiều liều 4 mg/ngày) và có mối quan hệ tuyến tính giữa liều và cả C_{max} và AUC (diện tích dưới đường cong thời gian/nồng độ).

Phân bố



Glimepirid có thể tích phân bố rất thấp (khoảng 8,8 lít), gần bằng với khoang phân bố albumin. Glimepirid liên kết cao với protein huyết tương (99%) và có độ thanh thải thấp (xấp xỉ 48ml/phút).

Ở động vật, glimepirid được bài tiết qua sữa. Glimepirid qua được nhau thai. Khả năng qua hàng rào máu não thấp.

Chuyển hoá và thải trừ

Thời gian bán thải trong huyết thanh của glimepirid là 5 – 8 giờ, nhưng khi dùng liều cao, thời gian bán thải sẽ dài hơn.

Sau khi uống glimepirid được đánh dấu, thấy 58% các chất chuyển hóa thải trừ qua nước tiểu và 35% qua phân. Trong nước tiểu, không còn có glimepirid ở dạng chưa chuyển hóa. Hai chất chuyển hóa – chủ yếu là chuyển hóa ở gan (enzym chính là CYP2C9) - được thấy cả trong nước tiểu và phân: dẫn xuất hydroxy và dẫn xuất carboxy. Sau khi uống glimepirid, chu kỳ bán thải cuối cùng của các chất chuyển hóa này lần lượt là 3 đến 6 và 5 đến 6 giờ.

So sánh dùng đơn liều và đa liều hàng ngày cho thấy không có sự khác biệt đáng kể về dược động học, và sự thay đổi ở từng bệnh nhân rất thấp. Không có sự tích lũy liên quan.

Đối tượng đặc biệt

Người cao tuổi

Dược động học tương tự ở nam và nữ, cũng như ở bệnh nhân trẻ tuổi và cao tuổi (trên 65 tuổi).

Suy thận

Ở những bệnh nhân có độ thanh thải creatinin thấp, có xu hướng độ thanh thải glimepirid tăng lên và nồng độ trung bình trong huyết thanh giảm, rất có thể là do thải trừ nhanh hơn vì liên kết protein thấp hơn. Thải trừ qua thận của hai chất chuyển hóa đã bị suy yếu. Nhìn chung, không có nguy cơ thuốc ở những bệnh nhân này.

Dược động học ở năm bệnh nhân không mắc bệnh đái tháo đường sau phẫu thuật ống mật tương tự như ở những người khỏe mạnh.

Trẻ em

Một nghiên cứu đã được thực hiện về dược động học cho thấy tính an toàn và khả năng dung nạp của liều đơn glimepirid 1 mg sau khi ăn, ở 30 bệnh nhân nhi khoa (4 trẻ em từ 10-12 tuổi và 26 trẻ em từ 12-17 tuổi) mắc bệnh đái tháo đường typ 2 cho thấy AUC_(0-cuối cùng) trung bình, C_{max} và t_{1/2} tương tự như ở người lớn.

14. Quy cách đóng gói: Hộp 3 vỉ x 10 viên

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

Bảo quản: Bảo quản ở nhiệt độ không quá 30°C. Tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất

Tiêu chuẩn chất lượng: USP

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

The ACME Laboratories Ltd.



Địa chỉ: Dhulivita, Dhamrai, Dhaka, Bangladesh

17. Tên, địa chỉ cơ sở đăng ký thuốc:

OMNICALS PHARMA PRIVATE LIMITED

Địa chỉ: Flat-C-210, Plot 63 To 65&73 to 75, Sect-44A Nerul, Navi Mumbai Thane,
Maharashtra, India, 400706 (Ấn Độ).

