

Rx

OMCAGLIM 2 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 hoạt chất: glimepiride 2 mg

Thành phần tá dược: microcrystalline cellulose (101), lactose monohydrate, sodium starch glycolate, povidone (K-30), sodium lauryl sulfate, orange red color, microcrystalline cellulose (102), magnesium stearate, 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 cam nhạt, phẳng, hình thuôn dài, một mặt có khía, một mặt nhẵn.

3. Chỉ định:

Glimepiride được chỉ điều trị đái tháo đường typ 2 khi mức glucose huyết không được kiểm soát thỏa đáng 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 tiểu đường là chế độ ăn uống tốt, hoạt động thể chất thường xuyên, cũng như kiểm tra máu và nước tiểu thường xuyên. Viên nén hoặc insulin không thể cải thiện nếu bệnh nhân không tuân thủ chế độ ăn uống được khuyến nghị.

Liều lượng được xác định bởi kết quả kiểm tra glucose máu và nước tiểu.

Liều khởi đầu là 1 mg glimepiride 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 kiểm soát đường huyết, theo cách từng bước với khoảng thời gian khoảng 1 đến 2 tuần giữa mỗi bước, từ 2, 3 hoặc 4 mg glimepiride mỗi ngày.

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



Trong khi duy trì liều metformin, liệu pháp glimepiride được bắt đầu ở liều thấp, và sau đó được điều chỉnh tùy thuộc vào mức độ kiểm soát trao đổi chất mong muốn lên 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 glimepiride tối đa hàng ngày, có thể bắt đầu liệu pháp insulin đồng thời nếu cần thiết. Trong khi duy trì liều glimepiride, điều trị insulin được bắt đầu ở liều thấp và điều chỉnh tùy thuộc vào mức độ kiểm soát trao đổi chất mong muốn. Cần bắt đầu liệu pháp kết hợp dưới sự giám sát y tế chặt chẽ.

Thông thường một liều glimepiride hàng ngày là đủ. Khuyến cáo dùng thuốc ngay trước hoặc trong một bữa ăn sáng đầy đủ 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 glimepiride 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 glimepiride có thể giảm. Để tránh hạ đường huyết, do đó, 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 glimepiride

Có thể thực hiện chuyển đổi từ các thuốc hạ đường huyết đường uống khác sang glimepiride. Để chuyển sang glimepiride, 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 glimepiride mỗi ngày. Dựa trên đáp ứng, liều lượng glimepiride có thể được tăng lên từng bước, như đã chỉ ra trước đó.

Chuyển từ insulin sang glimepiride

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

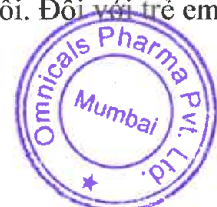
Đối tượng đặc biệt

Bệnh nhân suy gan hoặc thận:

Xem phần “Chống chỉ định”

Trẻ em:

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

Khi bữa ăn được thực hiện vào những giờ không đều hoặc bỏ qua hoàn toàn, điều trị bằng glimepiride có thể dẫn đến hạ đường huyết. Các triệu chứng có thể có của hạ đường huyết bao gồm: nhức đầu, đói, buồn nôn, nôn, khó chịu, 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, rối loạn cảm giác, chóng mặt, mất sức, mất kiểm soát, mê sảng, co giật não, buồn ngủ và mất ý thức và bao gồm hôn mê, hô hấp nông và nhịp tim chậm. Ngoài ra, các dấu hiệu của cơ chế điều hoà ngược adrenergic có thể xuất hiện như đổ mồ hôi, da nhẵn nhợt, lo lắng, nhịp tim nhanh, tăng huyết áp, đánh trống ngực, đau thắt ngực và rối loạn nhịp tim.

Bức tranh lâm sàng của việc hạ đường huyết nghiêm trọng có thể giống như đột quỵ.

Các triệu chứng hầu như luôn có thể được kiểm soát kịp thời bằng cách dùng carbohydrat ngay lập tức (đường). Chất làm ngọt nhân tạo không có tác dụng.

Sử dụng các sulphonylure khác nhận thấy rằng, mặc dù các biện pháp xử lý thành công ban đầu, hạ đường huyết vẫn có thể tái phát.

Hạ đường huyết nặng hoặc hạ đường huyết kéo dài, chỉ tạm thời được kiểm soát bởi lượng đường thông thường, cần điều trị y tế ngay lập tức và đôi khi phải nhập viện.

Các yếu tố thúc đẩy hạ đường huyết bao gồm:

- không hợp tác hoặc (phổ biến hơn ở bệnh nhân cao tuổi) mất khả năng hợp tác của bệnh nhân,
- thiếu dinh dưỡng, giờ ăn không đều hoặc bỏ bữa hoặc nhịn ăn,
- thay đổi chế độ ăn uống,
- mất cân bằng giữa gắng sức về thể chất và lượng carbohydrat,
- sử dụng rượu, đặc biệt là kết hợp với các bữa ăn bị bỏ qua,
- suy giảm chức năng thận,
- rối loạn chức năng gan nghiêm trọng,
- quá liều với glimepiride,



- một số rối loạn không bù đắp của hệ thống nội tiết ảnh hưởng đến chuyển hóa carbohydrat hoặc chống hạ đường huyết (ví dụ như trong một số rối loạn chức năng tuyến giáp và suy tuyến yên trước hoặc tuyến thượng thận),
- sử dụng đồng thời một số sản phẩm thuốc khác (xem Tương tác thuốc).

Điều trị bằng glimepiride 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.

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

Trong các tình huống căng thẳng (ví dụ: tai nạn, phẫu thuật cấp tính, nhiễm trùng sốt, v.v.), có thể chỉ định chuyển đổi tạm thời sang insulin.

Không có kinh nghiệm nào có được liên quan đến việc sử dụng glimepiride ở những bệnh nhân bị suy giảm nghiêm trọng chức năng gan hoặc bệnh nhân lọc máu. Ở những bệnh nhân bị suy giảm nghiêm trọng chức năng thận hoặc gan, đổi sang insulin được chỉ định.

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

Glimepiride chứa monohydrat lactose. 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 cần nhắc mang thai nên thông báo cho bác sĩ.

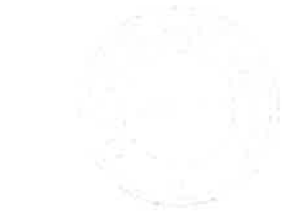
Rủi ro liên quan đến glimepiride

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

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

Trong trường hợp điều trị bằng glimepiride, nếu bệnh nhân có kế hoạch mang thai hoặc nếu phát hiện mang 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. Glimepiride được bài tiết qua sữa chuột. Vì các sulfonylurea khác được bài tiết qua sữa mẹ và vì có nguy cơ hạ đường huyết ở trẻ bú mẹ, không nên cho con bú trong quá trình điều trị bằng glimepiride.

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

Không có nghiên cứu nào về ảnh hưởng của thuốc đến khả năng lái xe và sử dụng máy móc đã 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, do suy giảm thị lực. Điều này có thể tạo thành rủi ro trong các tình huống mà những khả năng này có tầm quan trọng đặc biệt (ví dụ: lái xe ô tô hoặc vận hành máy móc).

Bệnh nhân nên được khuyến nghị 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 glimepiride 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 glimepiride 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.

Glimepiride 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 glimepiride tăng khoảng 2 lần bởi fluconazol, một trong những chất ức chế CYP2C9 mạnh nhất.

Dựa trên kinh nghiệm với glimepiride 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 hormone sinh dục nam,
- chloramphenicol, một số sulfonamide tác dụng kéo dài nhất định, các tetracyclin, các kháng sinh quinolon và clarithromycin,
- thuốc chống đông máu coumarin,
- fenfluramin,



- disopyramide
- 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 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 phản ứng adrenergic đối với hạ đường huyết có thể giảm hoặc không có.

Uống rượu có thể làm tăng hoặc làm suy yếu hoạt động hạ đường huyết của glimepiride một cách không thể đoán trước.

Glimepiride có thể làm tăng hoặc làm suy yếu tác dụng của các dẫn xuất coumarin.

Colesevelam liên kết với glimepiride và làm giảm sự hấp thụ glimepiride từ đường tiêu hóa. Không có tương tác được quan sát thấy khi glimepiride được uống ít nhất 4 giờ trước khi dùng colesevelam. Do đó, glimepiride nên được dùng ít nhất 4 giờ trước khi dùng colesevelam.

Tương kỵ của thuốc

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:

Các phản ứng bất lợi sau đây là từ các nghiên cứu lâm sàng dựa trên kinh nghiệm với glimepiride 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: $< 1/10.000$), không biết (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 ba dòng, nhìn chung có thể đảo ngược khi ngừng thuốc.

Không biết: giảm tiểu cầu nặng với số lượng tiểu cầu dưới 10.000/ μ l và ban xuất huyết giảm tiểu cầu.

Rối loạn hệ miễn dịch

Rất hiếm gặp: viêm mạch bạch cầu, phản ứng quá mẫn nhẹ có thể phát triển thành phản ứng nghiêm trọng với khó thở, giảm huyết áp và đôi khi sốc

Không biết: có thể gây dị ứng chéo với các sulfonylure, 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 nghiêm trọng 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 mắt

Không biết: rối loạn thị giác thoáng qua, 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, trướng bụng, khó chịu ở bụng và đau bụng, hiếm khi dẫn đến ngừng điều trị.

Rối loạn gan mật

Chưa biết: enzym gan tăng

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

Rối loạn da và mô dưới da

Hiếm: rụng tóc.

Không biết: 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 ban 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, các vấn đề về phối hợp, buồn ngủ, hôn mê và co giật.

Xử trí

Điều trị chủ yếu bao gồm ngăn chặn sự hấp thụ bằng cách gây nôn và sau đó uống nước hoặc nước chanh với than hoạt tính (chất hấp phụ) và natri sulphat (nhuận tràng). Nếu một lượng lớn đã được uống, rửa dạ dày được chỉ định, tiếp theo là than hoạt tính và natri sulphat. Trong trường hợp quá liều (nặng) cần nhập viện trong một 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. Điều trị thêm là điều trị triệu chứng.

Trẻ em

Đặc biệt khi điều trị hạ đường huyết do vô tình uống glimepiride 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

Glimepiride 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, glimepiride 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 ra khỏi tế bào

Điều này dẫn đến giải phóng insulin thông qua exocytosis.

Glimepiride liên kết với tỷ lệ trao đổi 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.

Hoạt động ngoài tuyến tụy

Các tác dụng ngoài tuyến tụy là ví dụ như 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 trong màng tế bào. Việc vận chuyển glucose trong các mô này là bước giới hạn tỷ lệ trong việc sử dụng glucose. Glimepiride tăng rất nhanh số lượng các phân tử vận chuyển glucose hoạt động trong màng plasma của các tế bào cơ và mỡ, dẫn đến sự hấp thu glucose được kích thích.

Glimepiride làm tăng hoạt động của phospholipase C đặc hiệu glycosyl-phosphatidylinositol có thể tương quan với lipogenesis và glycogenesis do thuốc gây ra trong các tế bào cơ và chất béo bị cô lập.

Glimepiride ức chế sản xuất glucose trong gan bằng cách tăng nồng độ nội bào của fructose-2,6-bisphosphat, từ đó ức chế gluconeogenesis.

Tổng quát

Ở những người khỏe mạnh, liều uống hiệu quả tối thiểu là khoảng 0,6 mg. Tác dụng của glimepiride phụ thuộc vào liều lượng và có thể lặp lại. Đáp ứng sinh lý đối với tập thể dục cấp tính, giảm bài tiết insulin, vẫn còn hiện diện khi dùng glimepiride.

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 trao đổi chất tốt trong 24 giờ với một liều duy nhất hàng ngày

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

Liều pháp kết hợp với metformin

Kiểm soát trao đổi chất được cải thiện đối với liệu pháp dùng đồng thời glimepiride 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 glimepiride tối đa, có thể bắt đầu liệu pháp insulin đồng thời.



nguyên 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 glimepiride, không có mối quan tâm mới về sự an 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

Glimepiride 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

Glimepiride có thể tích phân bố rất thấp (khoảng 8,8 lít) tương tự như của albumin. Glimepiride liên kết nhiều với protein huyết tương (99%) và có độ thanh thải thấp (xấp xỉ 48ml/phút).

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

Chuyển hoá và thải trừ

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

Sau khi uống glimepiride được đánh dấu, thấy 58% các chất chuyển hóa thải trừ qua nước tiểu và 35% qua phân. Trong nước tiểu, không còn có glimepiride 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 cacboxy. Sau khi uống glimepiride, 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 liều lượng một lần và nhiều lần mỗi 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 và già (trên 65 tuổi).

Suy thận

Ở những bệnh nhân có độ thanh thải creatinin thấp, có xu hướng độ thanh thải glimepiride tăng lên và nồng độ trung bình trong huyết thanh giảm, rất có thể là do loại bỏ nhanh hơn và liên kết



protein thấp hơn. Thái trừ qua thận của hai chất chuyển hóa đã bị suy yếu. Nhìn chung, không có thêm nguy cơ tích lũy nào được giả định ở những bệnh nhân như vậy.

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 sau ăn điều tra dược động học, tính an toàn và khả năng dung nạp của liều glimepiride đơn 1 mg 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: Navi Mumbai, Ấn Độ

