

4/88
b. lat L
L. ch. bang uo
L. 88
D. 88

Rx. Thuốc bán theo đơn

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ hoặc dược sĩ.

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

Để thuốc xa tầm với trẻ em. Không dùng thuốc quá hạn sử dụng.

GLEMEP

[Thành phần]: Mỗi viên nén chứa:

Hoạt chất: Glimepiride: 2 mg

Tá dược: Microcrystalline Cellulose (Type 101) 137.56mg, Pregelatinized Starch (Starch STA RX-1500)16mg, Sodium Starch Glycolate 3.2mg, Magnesium Stearate 0.8mg, Colloidal Anhydrous Silica 0.4mg.

[Tính chất dược lực học]

Cơ chế làm giảm đường huyết của Glimepiride là kích thích insulin bài tiết từ các tế bào beta của tụy vào máu. Hơn nữa, các tác dụng ngoài tụy có thể có vai trò trong hoạt động của các sulfonylurea như Glimepiride. Điều này được khẳng định qua các nghiên cứu lâm sàng và tiền lâm sàng cho thấy dùng Glimepiride có thể làm tăng độ nhạy cảm của các mô cơ thể với Insulin. Tuy nhiên cũng giống như các sulfonylurea khác, cơ chế hạ đường huyết của Glimepiride trong điều trị dài hạn chưa được xác định rõ.

Glimepiride có hiệu quả trong quá trình điều trị ban đầu. Ở những bệnh nhân không kiểm soát được nồng độ đường huyết khi dùng liệu pháp điều trị đơn bằng glimepiride hoặc metformin, sự kết hợp giữa Glimepiride và metformin có thể có tác dụng hiệp đồng, do cả 2 chất này đều làm tăng độ dung nạp glucose theo các cơ chế hoạt động khác nhau. Trong các nghiên cứu, tác dụng bổ sung này được tìm thấy ở Metformin và các sulfonylurea.

[Tính chất dược động học]

Hấp thu: Sau khi dùng đường uống Glimepiride được hấp thu hoàn toàn từ đường tiêu hoá. Các nghiên cứu cho thấy khi dùng liều đơn theo đường uống cho những cá thể bình thường khoẻ mạnh và nhiều liều nhắc lại cho bệnh nhân đái tháo đường không phụ thuộc Insulin cho thấy một lượng đáng kể Glimepiride được hấp thu trong vòng 1 giờ sau khi uống và nồng độ đỉnh của thuốc (C_{max}) đạt được sau 2 đến 3 giờ. Khi dùng Glimepiride trong bữa ăn, thời gian T_{max} (thời

gian để đạt đến C_{max}) trung bình tăng nhẹ (12%) và C_{max} trung bình và AUC (diện tích dưới đường cong nồng độ) giảm nhẹ (tương ứng là 8% và 9%).

Phân bố: Sau khi tiêm tĩnh mạch cho những cá thể khỏe mạnh, thể tích phân bố (V_d) là 8,8 L (113 ml/kg), và tổng độ thanh thải (CL) là 47,8 ml/phút. Tỷ lệ gắn kết với Protein hơn 99,5%.

Chuyển hoá: Glimepiride được chuyển hoá hoàn toàn do quá trình oxi hoá biến đổi sinh học sau khi dùng theo đường uống hoặc tiêm tĩnh mạch. Các chất chuyển hoá chủ yếu là dẫn chất Cyclohexyl hydroxy methyl (M1) và dẫn chất carboxyl (M2). Cytochrome P450 II C9 có liên quan đến quá trình biến đổi sinh học Glimepiride thành M1. M1 tiếp tục được chuyển hoá thành M2 bởi một hoặc vài enzyme bào tương. Trong các thí nghiệm trên động vật, M1 có khoảng 1/3 tác dụng dược lý so với chất ban đầu chưa chuyển hoá, tuy nhiên tác dụng giảm nồng độ đường của M1 trên lâm sàng chưa được sáng tỏ.

Thời trừ: Khi uống Glimepiride có gắn ^{14}C , có xấp xỉ 60% tổng hoạt lực phóng xạ được bài tiết vào trong nước tiểu trong vòng 7 ngày và M1 (chiếm ưu thế) và M2 chiếm 80% đến 90% được tìm thấy trong nước tiểu. Có khoảng 40% tổng hoạt lực phóng xạ được tìm thấy trong phân và M1 và M2 (chiếm ưu thế) chiếm 70% được tìm thấy trong phân. Không tìm thấy thuốc ở dạng ban đầu chưa chuyển hoá trong nước tiểu và phân. Sau khi tiêm tĩnh mạch, không thấy sự bài tiết đáng kể Glimepiride hoặc chất chuyển hoá M1 của nó trong dịch mật.

[Chỉ định]

Glimepiride được dùng để điều trị đái tháo đường không phụ thuộc insulin (typ II) khi không thể kiểm soát được nồng độ đường huyết chỉ bằng chế độ ăn kiêng, tập thể dục và giảm cân.

Glimepiride cũng được chỉ định kết hợp với Insulin để giảm đường huyết trên bệnh nhân trên bệnh nhân tăng đường huyết không thể kiểm soát được bằng chế độ ăn kiêng, tập thể dục hoặc kết hợp với các thuốc hạ đường huyết đường uống khác.

[Liều lượng và cách dùng]

Cần phải dùng Glimepiride với liều lượng thấp nhất mà vẫn đạt được tác dụng mong muốn. Thời gian sử dụng và liều lượng thuốc được chỉ định bởi bác sĩ khi xem xét tình trạng và lối sống hiện tại của bệnh nhân. Cần thường xuyên làm các xét nghiệm máu và nước tiểu để theo dõi sự thay đổi nồng độ đường huyết của bệnh nhân. Từ đó điều chỉnh quá trình điều trị cho phù hợp. Nên uống thuốc ngày một lần vào bữa ăn sáng hoặc bữa ăn chính đầu tiên trong ngày.

Liều khởi đầu:

Ở bệnh nhân chưa được điều trị, liều khởi đầu là 1-2mg ngày một lần. Ở bệnh nhân suy nhược, suy dinh dưỡng, người già, suy gan hoặc suy thận, bệnh nhân có nguy cơ hạ đường huyết nên khởi đầu bằng liều 1mg ngày một lần.

Ở bệnh nhân từng được điều trị bằng các thuốc tiểu đường khác: liều khởi đầu thông thường ở người lớn là 1-2 mg ngày một lần. Liều khởi đầu không nên quá 2mg mỗi ngày.

Liều duy trì:

Liều duy trì thông thường từ 1-4mg ngày một lần. Ở bệnh nhân đã dùng glimepiride 1mg/ ngày có thể tăng liều đến 2mg một ngày nếu vẫn chưa đạt mức đường huyết mong muốn sau 1 đến 2 tuần điều trị. Khi đã dùng đến liều 2mg, việc điều chỉnh liều sau đó tùy thuộc vào mức dung nạp và đáp ứng của bệnh nhân. Nên tăng liều từ từ, mỗi lần tăng không quá 2mg/ ngày cách quãng khoảng từ 1-2 tuần. Liều tối đa khuyến dùng là 8mg/ngày.

Sử dụng trong nhi khoa: Không khuyến dùng cho trẻ em vì độ an toàn và hiệu lực trên trẻ em chưa được nghiên cứu.

[Chống chỉ định]

- Chống chỉ định điều trị đái tháo đường phụ thuộc Insulin (typ I) (thí dụ điều trị cho bệnh nhân có tiền sử nhiễm acid do nhiễm ketone), cũng chống chỉ định cho bệnh nhân đái tháo đường nhiễm acid do nhiễm ketone, điều trị tiền hôn mê, hôn mê trong đái tháo đường.
- Chống chỉ định cho các bệnh nhân có tiền sử mẫn cảm với Glimepiride, các thuốc điều trị đái tháo đường nhóm Sulfonylure khác, các Sulfonamide, và bất cứ tá dược nào.
- Thuốc chưa từng được sử dụng cho các bệnh nhân phải thẩm tách máu, bệnh nhân có rối loạn chức năng gan nặng. Đối với bệnh nhân suy giảm chức năng thận nặng, chuyển sang dùng Insulin có thể là cần thiết để duy trì tốt sự kiểm soát chuyển hóa.

[Những lưu ý đặc biệt và cảnh báo khi sử dụng thuốc]

Trong những tuần đầu tiên điều trị, bệnh nhân có nguy cơ hạ đường huyết do đó, cần phải theo dõi cẩn thận. Nếu trường hợp này xuất hiện, cần phải điều chỉnh liều Glimepiride. Hạ đường huyết có thể được kiểm soát nhanh chóng tức thời bằng cách sử dụng carbonhydrates (Glucose hay đường, dưới dạng đường khối, nước trái cây có đường, nước trà đường...)

[Tương tác với các thuốc khác, các dạng tương tác khác]

- Tăng tác dụng hạ đường huyết có thể xảy ra khi dùng kết hợp với : Insulin và các thuốc điều trị đái tháo đường dạng uống, thuốc ức chế men chuyển, Allopurinol, các steroid đồng hoá, hormone sinh dục nam, Chloramphenicol, chống đông máu Coumarin, cyclophosphamide, disopyramide, fenfluramine, fenyramidol, fibrates, fluoxetine, guanethidine, ifosfamide, thuốc ức chế MAO, miconazole, fluconazole, acid para-aminobenzoic, pentoxifylline (liều cao ngoài đường uống), phenylbutazol, azapropazone, oxyphebutazone, probenecid, quinolones, salicylates, sulphinpyrazone, kháng sinh sulfonamide, tetracyclines, tritoqualine, trofosfamide, thuốc ức chế cường giao cảm.
- Giảm tác dụng hạ đường huyết khi dùng kết hợp với: acetazolamide, barbiturates, corticosteroid, diazoxide, thuốc lợi tiểu, adrenaline và các thuốc cường giao cảm khác,

glucagons, thuốc nhuận tràng (sử dụng kéo dài), acid nicotinic (liều cao), oestrogens, progesterones, thuốc tránh thai đường uống, phenothiazine, phenytoin, rifampicin, hormone tuyến giáp, chlorpromazine, izoniazid.

- Các thuốc có thể làm tăng hoặc làm giảm tác dụng hạ glucose máu của Glimepiride: các thuốc chủ vận receptor H_2 , clonidine và reserpin.

- Uống nhiều rượu hoặc thường xuyên uống rượu có thể làm tăng khả năng hoặc làm giảm tác dụng của Glimepiride mà không thể dự đoán trước được cách tác dụng.

[Tác dụng không mong muốn của thuốc]

Tác dụng không mong muốn quan trọng nhất là gây hạ đường huyết. Khi xảy ra hạ đường huyết, cần thực hiện như mục "Sử dụng quá liều".

Thường gặp, ADR > 1/100

Thần kinh: Hoa mắt, chóng mặt, nhức đầu.

Tiêu hóa: Buồn nôn, nôn, cảm giác đầy tức ở vùng thượng vị, đau bụng, ỉa chảy.

Mắt: Khi bắt đầu dùng, thường có rối loạn thị giác tạm thời, do sự thay đổi về mức glucose huyết.

Ít gặp 1/1000 < ADR < 1/100

Da: Phản ứng dị ứng hoặc giả dị ứng, mẩn đỏ, mề đay, ngứa.

Hiếm gặp, ADR < 1/1000

Gan: Tăng enzym gan, vàng da, suy giảm chức năng gan.

Máu: Giảm tiểu cầu nhẹ hoặc nặng, thiếu máu tan huyết, giảm hồng cầu, giảm bạch cầu, mất bạch cầu hạt.

Mạch: Viêm mạch máu dị ứng.

Da: Mẫn cảm với ánh sáng.

Cách xử trí ADR

Thông thường, các tác dụng không mong muốn nêu trên sẽ giảm dần và tự hết trong quá trình điều trị. Nhưng nếu xảy ra quá nặng thì phải ngừng thuốc.

[Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú]

- Không sử dụng Glimepiride trong thời kỳ mang thai bởi vì thuốc có thể gây hại cho bào thai. Cần chuyển sang sử dụng Insulin. Bệnh nhân có dự định mang thai, cần phải thông báo cho bác sỹ, và nên chuyển sang dùng insulin.

- Trong các nghiên cứu sinh sản tiến hành trên chuột nhắt, người ta thấy nồng độ thuốc đáng kể trong huyết thanh và sữa chuột mẹ, cũng như trong huyết thanh chuột con. Bởi vì các sulfonylurea khác được bài tiết vào sữa mẹ nên để tránh khả năng Glimepiride có mặt trong sữa, người mẹ phải chuyển sang dùng insulin hoặc ngừng cho con bú.

- Trong một số nghiên cứu tiến hành trên chuột mẹ, chuột con đã cho thấy nồng độ cao Glimepiride trong thời kỳ mang thai, cho con bú làm tăng những dị dạng trên xương chuột con bao gồm làm ngắn, làm dày, làm cong xương cánh tay trong suốt giai đoạn sau khi sinh.

[Tác động của thuốc khi lái xe và vận hành máy móc]

Bệnh nhân điều trị đái tháo đường có thể bị giảm thị giác, độ tỉnh táo và phản xạ khi lái xe và vận hành máy móc nếu quá trình điều trị không phù hợp hoặc khi bị hạ đường huyết.

[Sử dụng quá liều]

Quá liều Glimepiride có thể dẫn đến chứng hạ đường huyết. Trong trường hợp này, sự điều trị cơ bản bao gồm ngăn cản sự hấp thu bằng cách gây nôn, sau đó uống nước hoặc nước chanh với than hoạt (chất hấp phụ) và natri sulfat (để nhuận tràng). Nếu một lượng lớn thuốc đó được uống vào, phải rửa dạ dày rồi dùng than hoạt và natri sulfat.

Nếu nghi ngờ hoặc chẩn đoán bệnh nhân bị hôn mê do hạ đường huyết, cần tiêm tĩnh mạch nhanh dung dịch glucose đặc (50%) cho bệnh nhân, sau đó cần truyền tĩnh mạch dung dịch glucose loãng hơn (10%) với tốc độ để đảm bảo duy trì nồng độ glucose máu trên 100 mg/dl. Bệnh nhân cần được giám sát cẩn thận ít nhất trong 24-48 giờ, bởi vì chứng hạ đường huyết có thể xuất hiện lại sau khi đã có những cải thiện rõ ràng về triệu chứng lâm sàng.

[Bảo quản] Bảo quản trong bao bì kín, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

[Trình bày] Hộp 3 vỉ x 10 viên nén

[Tiêu chuẩn]: Nhà sản xuất

[Hạn dùng] 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Sản xuất tại Băng-la-đét bởi:

Healthcare Pharmaceuticals Limited

Nhà máy: Rajendrapur, Gazipur, Bangladesh.

Văn phòng: 71-72, Old Elephant Road,

Eskaton, Dhaka-1000, Bangladesh.



PHÓ CỤC TRƯỞNG
Nguyễn Việt Hùng