

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc



Glimepiride Denk 3

(Viên nén glimepiride 3 mg)

Để xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

THÀNH PHẦN:

Mỗi viên nén chứa:

Thành phần hoạt chất: Glimepiride 3 mg

Thành phần tá dược: Lactose monohydrate, tinh bột ngô, natri starch glycolate, povidone K30, polysorbate 80, oxid sắt vàng, talc, magnesi stearate.

DẠNG BẢO CHẾ:

Viên nén không bao.

CHỈ ĐỊNH

Glimepiride được dùng để điều trị bệnh tiểu đường typ 2 sau khi đã áp dụng chế độ ăn kiêng, luyện tập và giảm cân nhưng không có kết quả.

LIỀU DÙNG, CÁCH DÙNG

Cơ sở để điều trị thành công bệnh tiểu đường là một chế độ ăn uống phù hợp, thường xuyên hoạt động thể chất cũng như giám sát thường xuyên các chỉ số của máu và nước tiểu. Các tác nhân chống tiểu đường hoặc insulin không thể bù lại được nếu bệnh nhân không giữ được chế độ ăn kiêng theo như khuyến cáo.

Liều dùng được xác định dựa trên kết quả định lượng glucose trong máu và nước tiểu.

Liều khởi đầu là 1 mg glimepiride một ngày. Nếu kiểm soát tốt đường huyết có thể đạt được, nên duy trì sử dụng liều này.

Nếu không kiểm soát được đường huyết, nên tăng liều lên dần dần, dựa trên tình trạng đường huyết, đến 2, 3 hoặc 4 mg glimepiride một ngày trong khoảng thời gian 1 đến 2 tuần.

Chỉ sử dụng liều lớn hơn 4 mg glimepiride một ngày trong trường hợp đặc biệt. Liều tối đa khuyến cáo là 6 mg glimepiride một ngày.

Nếu dùng liều tối đa hàng ngày của một mình metformin mà không kiểm soát được đường huyết của bệnh nhân thì nên bắt đầu điều trị kết hợp với glimepiride. Trong khi duy trì liều metformin, glimepiride nên được bắt đầu điều trị với liều thấp, và sau đó tăng dần lên tới liều tối đa hàng ngày tùy thuộc vào mức độ kiểm soát đường huyết mong muốn. Liệu pháp điều trị kết hợp này phải được bắt đầu dưới sự giám sát chặt chẽ của nhân viên y tế.

Ở bệnh nhân mà dùng liều tối đa hàng ngày của glimepiride không kiểm soát được đường huyết, có thể điều trị kết hợp với insulin nếu cần thiết. Trong khi duy trì glimepiride, insulin nên được bắt đầu điều trị với liều thấp, được bắt đầu với liều thấp, và sau đó tăng dần lên tới liều tối đa hàng ngày tùy thuộc vào mức độ kiểm soát đường huyết mong muốn. Liệu pháp điều trị kết hợp này phải được bắt đầu dưới sự giám sát chặt chẽ của nhân viên y tế.

Thông thường chỉ cần dùng một liều duy nhất glimepiride một ngày là đủ. Nên dùng liều thuốc này ngay trước hoặc trong bữa ăn sáng chính hoặc nếu không ăn sáng thì dùng thuốc ngay trước hoặc trong bữa ăn chính đầu tiên. Nếu quên dùng một liều thuốc, không nên uống bù



bằng cách tăng liều tiếp theo. Uống nguyên cả viên thuốc với đủ nước.

Nếu bệnh nhân bị hạ đường huyết với liều 1 mg glimepiride/ngày, điều này cho thấy rằng bệnh nhân có thể kiểm soát được đường huyết chỉ bằng chế độ ăn kiêng.

Trong quá trình điều trị nhu cầu glimepiride có thể giảm, khi bệnh đã được kiểm soát do độ nhạy cảm với insulin đã tăng lên. Để tránh hạ đường huyết cần phải giảm liều kịp thời hoặc ngừng điều trị. Cần phải điều chỉnh để có một liều thích hợp nếu có sự thay đổi trọng lượng cơ thể hoặc phong cách sống của bệnh nhân hoặc các yếu tố khác làm tăng nguy cơ tăng hoặc hạ đường huyết.

Chuyển từ thuốc chống tiểu đường dùng đường uống khác sang glimepiride

Sự thay đổi từ thuốc chống tiểu đường dùng đường uống khác sang glimepiride nói chung có thể thực hiện được. Đối với việc chuyển sang glimepiride, phải xem xét đến hiệu lực và thời gian bán thải của thuốc dùng trước đó. Trong một số trường hợp, đặc biệt là trong trường hợp thuốc chống tiểu đường có thời gian bán thải dài hơn glimepiride (ví dụ như chlorpropamide) thời gian bán thải khoảng vài ngày được khuyến khích thay thế để giảm thiểu nguy cơ hạ đường huyết do tác dụng phụ của thuốc. Liều khởi đầu được khuyến cáo là 1 mg glimepiride một ngày. Dựa vào đáp ứng của bệnh nhân, liều glimepiride có thể dần dần tăng lên, như mô tả ở trên.

Chuyển từ insulin sang glimepiride

Trong trường hợp đặc biệt, nơi mà bệnh nhân tiểu đường type 2 được điều trị bằng insulin, có thể chỉ định chuyển sang dùng glimepiride. Chuyển đổi này phải được tiến hành dưới sự giám sát chặt chẽ của nhân viên y tế.

Sử dụng ở bệnh nhân suy thận hoặc suy gan

Glimepiride chống chỉ định cho bệnh nhân rối loạn chức năng gan hoặc thận nặng. Cần thay đổi chuyển sang dùng insulin.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Chống chỉ định dùng glimepiride cho những bệnh nhân sau:

- Tiểu đường phụ thuộc insulin
- Hôn mê do tiểu đường
- Tiểu đường nhiễm toan
- Rối loạn chức năng thận hoặc gan nặng
- Quá mẫn với glimepiride, sulfonamide hoặc sulfonamid hay bất kỳ thành phần nào khác của thuốc Trong trường hợp rối loạn chức năng thận hoặc gan nặng, cần phải chuyển sang dùng insulin.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Glimepiride phải được uống ngay trước hoặc trong bữa ăn. Nếu các bữa ăn không đều hoặc bị bỏ qua hoàn toàn, điều trị với glimepiride có thể dẫn đến hạ đường huyết. Triệu chứng có thể xảy ra của hạ đường huyết bao gồm : đau đầu, đói cồn cào, buồn nôn, nôn mửa, mệt mỏi, buồn ngủ, rối loạn giấc ngủ, bồn chồn, hung hăng, giảm tập trung, giảm sự tỉnh táo và phản ứng, trầm cảm, rối loạn lời nói và rối loạn thị giác, mất ngôn ngữ, run, liệt nhẹ, rối loạn cảm giác, chóng mặt, bất lực, mất tự chủ, mê sảng, co giật não, chóng mặt và mất ý thức, dẫn đến hôn mê, thở nông và chậm nhịp tim. Ngoài ra, dấu hiệu kháng adrenergic có thể xảy ra như đổ mồ hôi, da ửng lạnh, lo lắng, bồn chồn, nhịp tim nhanh, tăng huyết áp, đánh trống ngực, đau thắt ngực và rối loạn nhịp tim. Những biểu hiện lâm sàng của hạ đường huyết nặng có thể

giống biểu hiện của một cơn đột quỵ. Hầu như luôn có thể kiểm soát được các triệu chứng một cách kịp thời bằng cách ăn ngay carbohydrate (đường). Chất ngọt nhân tạo không có hiệu quả. Mặc dù biện pháp đối phó ban đầu thành công nhưng hạ đường huyết vẫn có thể tái diễn đã được biết ở các sulfonylurea khác.

Hạ đường huyết nặng hoặc kéo dài chỉ có thể kiểm soát tạm thời bằng một lượng đường thông thường, cần phải điều trị ngay, nếu cần thì phải nhập viện.

Các yếu tố sau đây có thể càng làm hạ đường huyết:

- Bệnh nhân không muốn hoặc không có khả năng hợp tác (thường ở bệnh nhân lớn tuổi)
- Suy dinh dưỡng, bữa ăn thất thường hoặc bỏ bữa hoặc thời kỳ ăn chay
- Mất cân bằng giữa hoạt động thể chất và lượng carbohydrate ăn vào
- Thay đổi chế độ ăn uống
- Uống rượu, đặc biệt là khi kết hợp với bỏ bữa
- Suy giảm chức năng thận
- Rối loạn chức năng gan nặng
- Quá liều với glimepiride, một vài rối loạn mất bù của hệ thống nội tiết tố ảnh hưởng tới chuyển hoá carbohydrate hoặc điều chỉnh ngược của hạ đường huyết (như một số rối loạn chức năng tuyến giáp và trục tuyến yên hoặc suy thượng thận), dùng đồng thời với một số thuốc khác.

Khi điều trị với glimepiride cần phải giám sát thường xuyên của lượng đường trong máu và trong nước tiểu. Ngoài ra, nên xác định tỷ lệ hemoglobin glycosyl (GHb).

Trong khi điều trị với glimepiride, cần thiết phải kiểm tra gan và máu (đặc biệt là các bạch cầu và tiểu cầu) thường xuyên.

Trong những tình huống nguy cấp như tai nạn, phẫu thuật, sốt nhiễm trùng, có thể chỉ định chuyển đổi tạm thời sang dùng insulin.

Kinh nghiệm trong việc dùng glimepiride ở bệnh nhân suy gan nặng hoặc bệnh nhân chạy thận là chưa có. Nên chỉ định chuyển sang dùng insulin cho những bệnh nhân này. Dùng sulfonylurea để điều trị cho bệnh nhân bị thiếu hụt glucose-6-phosphate (G6PD) có thể dẫn đến thiếu máu tan huyết. Vì glimepiride thuộc nhóm sulfonylurea, nên dùng thận trọng ở những bệnh nhân thiếu hụt-G6PD và nên thay thế bằng một thuốc chống tiểu đường không thuộc nhóm sulfonylurea.

Thuốc này có chứa lactose monohydrat. Bệnh nhân không dung nạp galactose di truyền, thiếu hụt enzyme lactase hoặc kém hấp thu glucose galactose không nên dùng Glimepiride Denk 3.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

Phụ nữ có thai

Rủi ro liên quan đến bệnh tiểu đường:

Mức độ đường trong máu bất thường trong thai kỳ có liên quan với một tỷ lệ cao hơn các bất thường bẩm sinh và thai chết lưu. Do đó cần phải giám sát chặt chẽ lượng đường huyết trong quá trình mang thai để tránh nguy cơ gây quái thai.

Trong trường hợp này, cần phải sử dụng insulin. Bệnh nhân đang có kế hoạch mang thai phải thông báo cho bác sĩ.

Rủi ro liên quan đến glimepiride:

Không có dữ liệu đầy đủ về sử dụng glimepiride ở phụ nữ mang thai. Nghiên cứu trên động vật đã cho thấy có độc tính đối với sinh sản mà có thể là liên quan đến tác dụng dược lý (hạ đường huyết) của glimepiride.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỲ CỦA THUỐC

Nếu dùng đồng thời glimepiride với một thuốc khác nào đó, đều có thể gây ra tăng hoặc giảm tác dụng đường huyết của glimepiride.

Vì lý do này, chỉ dùng các thuốc khác khi được bác sĩ khuyên dùng (hoặc chỉ định). Glimepiride được chuyển hóa bởi men cytochrome P450 2C9 (CYP2C9). Chuyển hóa của thuốc bị ảnh hưởng khi dùng đồng thời với các chất gây cảm ứng men CYP2C9 (ví dụ rifampicin) hoặc các chất ức chế (ví dụ fluconazole).

Kết quả đã được công bố từ một nghiên cứu tương tác thuốc trong cơ thể cho thấy diện tích dưới đường cong (AUC) của glimepiride tăng lên gấp khoảng 2 lần do fluconazole, một trong những chất ức chế CYP2C9 mạnh nhất.

Dựa trên kinh nghiệm với glimepiride và các sulfonylurea khác, các tương tác sau đây đã được chỉ ra:

Tăng tác dụng giảm glucose trong máu dẫn đến hạ đường huyết trong một số trường hợp có thể xảy ra khi dùng đồng thời một trong những thuốc sau với glimepiride:

- Phenylbutazone, azapropazone và oxyphenbutazone, sulfinpyrazone
- Insulin và các sản phẩm chống tiểu đường dùng đường uống, một số sulfonamide tác dụng kéo dài.
- Metformin
- Các Tetracycline
- Salicylat và acid para-amino-salicylic
- Các chất ức chế men MAO
- Các steroid đồng hóa và nội tiết tố sinh dục nam
- Kháng sinh nhóm quinolone

Do đó, không nên dùng glimepiride ở bất kỳ thời điểm nào trong thai kỳ. Nếu bệnh nhân có kế hoạch mang thai hoặc phát hiện ra rằng mình đang mang thai trong khi điều trị với glimepiride, nên chuyển sang điều trị bằng insulin càng sớm càng tốt.

Phụ nữ đang cho con bú

Người ta không biết liệu glimepiride có được bài tiết vào sữa người hay không. Glimepiride được bài tiết trong sữa chuột. Giống như các sulfonylurea khác, khi được bài tiết vào sữa mẹ sẽ có nguy cơ hạ đường huyết ở trẻ bú mẹ, nên ngừng cho con bú trong suốt quá trình điều trị với glimepiride. Giống như các dẫn xuất sulfonylurea như là glimepiride được bài tiết trong sữa người, glimepiride chống chỉ định cho phụ nữ đang cho con bú.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Chưa có nghiên cứu về tác động của thuốc lên khả năng lái xe và vận hành máy móc.

Khả năng tập trung và phản ứng của bệnh nhân có thể bị suy giảm do hạ hoặc tăng đường huyết ví dụ như suy giảm thị lực. Điều này có thể là nguy cơ trong những tình huống mà những khả năng này rất quan trọng (như lái xe và vận hành máy móc).

Bệnh nhân nên thận trọng để tránh hạ đường huyết trong khi đang lái xe. Điều này rất quan trọng ở những người thường đã bị hạ đường huyết hoặc những người có những triệu chứng cảnh báo của hạ đường huyết. Nên cân nhắc liệu có nên lái xe và vận hành máy móc trong những trường hợp này.

- Chloramphenicol
- Probenecid
- Các coumarin chống đông máu
- Miconazole
- Fenfluramin
- Pentoxifylline (tiêm liều cao)
- Fibrate
- Tritoqualine
- Các chất ức chế men chuyển (ACE)
- Fluoxetine
- Allopurinol
- Sympatholytics
- Cyclophosphamide, trophosphamide và iphosphamide
- Fluconazole

Giảm tác dụng giảm glucose trong máu dẫn đến tăng đường huyết có thể xảy ra khi dùng đồng thời một trong những thuốc sau với glimepiride:

- Oestrogen và progestagen
- Saluretics, thuốc lợi tiểu thiazide
- Thuốc kích thích tuyến giáp, glucocorticoid
- Dẫn xuất phenothiazine, chlorpromazine
- Adrenaline và thuốc kích thích thần kinh giao cảm
- Acid nicotinic (liều cao) và các dẫn xuất của acid nicotinic
- Thuốc nhuận tràng (sử dụng trong thời gian dài)
- Phenytoin, diazoxide
- Glucagon, thuốc an thần và rifampicin
- Acetazolamide

Thuốc đối kháng H₂, chẹn beta, clonidin và reserpine có thể dẫn đến hoặc làm suy giảm tác dụng hạ glucose trong máu.

Dưới tác dụng của các thuốc kích thích thần kinh giao cảm như chẹn beta, guanethidine, clonidin và reserpine, các dấu hiệu kháng adrenergic để hạ đường huyết có thể bị giảm hoặc che lấp.

Uống rượu có thể làm tăng hoặc giảm tác dụng hạ đường huyết của glimepiride mà không thể đoán trước.

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

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC

Tác dụng không mong muốn của thuốc được phân loại như sau:

Rất thường gặp ($\geq 1/10$)

Thường gặp ($\geq 1/100$ đến $< 1/10$)

Ít gặp ($\geq 1/1000$ đến $< 1/100$)

Hiếm gặp ($\geq 1/10000$ đến $< 1/1000$)

Rất hiếm gặp ($< 1/10000$)

Chưa biết (không thể được đánh giá trên cơ sở dữ liệu sẵn có)

Các tác dụng không mong muốn sau đây thường xảy ra liên quan đến việc dùng glimepiride và các sulfonyleurea khác

Rối loạn máu và hệ bạch huyết

Hiếm gặp: Thay đổi công thức máu (giảm tiểu cầu, giảm bạch cầu, giảm hồng cầu, giảm bạch cầu hạt, mất bạch cầu hạt, thiếu máu tán huyết, giảm số lượng tế bào máu) những triệu chứng này sẽ hồi phục sau khi ngừng thuốc.

Rối loạn hệ miễn dịch

Rất hiếm trường hợp có phản ứng quá mẫn cảm nhẹ có thể chuyển thành phản ứng nặng gây khó thở, hạ huyết áp và đôi khi gây sốc.

Rất hiếm gặp: viêm mạch dị ứng.

Dị ứng chéo với các sulfonylurea, sulfonamid hoặc các chất có liên quan.

Rối loạn chuyển hoá và dinh dưỡng

Hiếm gặp: hạ đường huyết.

Các phản ứng này thường xảy ra ngay lập tức, có thể nặng và thường rất khó chữa. Khi xuất hiện các phản ứng như vậy, giống như điều trị các trường hợp hạ đường huyết khác, thường dựa vào các yếu tố cá nhân như thói quen ăn uống và liều dùng.

Rối loạn mắt

Rối loạn thị giác thoáng qua đặc biệt có thể xảy ra khi bắt đầu điều trị, do sự biến động về lượng đường trong máu.

Rối loạn tiêu hóa

Rất hiếm: buồn nôn, nôn, tiêu chảy và đầy thượng vị, đau bụng. Những triệu chứng này hiếm khi phải cần dừng thuốc.

Rối loạn gan mật

Tăng men gan.

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

Rối loạn da và biểu bì

Phản ứng quá mẫn cảm của da như ngứa, phát ban, nổi mề đay. Rất hiếm: nhạy cảm với ánh sáng.

Những trường hợp nghiêm cứu

Rất hiếm: giảm natri máu.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Hạ đường huyết có thể xảy ra sau khi dùng thuốc quá liều, kéo dài khoảng từ 12 – 72 giờ và có thể bình phục. Triệu chứng sẽ không dễ nhận thấy cho tới 24 giờ sau khi uống. Cần theo dõi thường xuyên bệnh nhân nội trú. Có thể xuất hiện buồn nôn, nôn, đau thượng vị. Hạ đường huyết thường có thể đi kèm với những triệu chứng về thần kinh như bồn chồn, run, rối loạn thị giác, rối loạn điều phối, buồn ngủ, hôn mê và co giật.

Điều trị chủ yếu bao gồm ngăn ngừa sự hấp thu bằng cách dùng than hoạt tính (chất hấp phụ) và natri sulfate (chất nhuận tràng). Nếu đã uống một số lượng lớn, cần phải chỉ định rửa dạ dày, tiếp theo là dùng than hoạt tính và natri sulfate. Trong trường hợp quá liều (nặng) cần phải chỉ định chăm sóc đặc biệt cho bệnh nhân. Nên dùng glucose càng sớm càng tốt, nếu cần thiết có thể tiêm tĩnh mạch 50 ml dung dịch glucose 50%, tiếp theo truyền tĩnh mạch dung dịch glucose 10% với sự giám sát chặt chẽ lượng glucose trong máu. Ngoài ra cũng cần phải điều trị triệu chứng. Đặc biệt khi điều trị hạ đường huyết do tai nạn uống phải glimepiride ở trẻ nhỏ và trẻ em, liều dùng của glucose phải được kiểm soát rất cẩn thận để tránh khả năng nguy hiểm do tăng đường huyết. Cần kiểm soát chặt chẽ lượng glucose trong máu.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: thuốc chống tiểu đường dùng đường uống, dẫn xuất của sulfonylurea.

Mã ATC: A10B B12.

Glimepiride là một chất có tác dụng hạ đường huyết dùng đường uống thuộc nhóm sulfonylurea. Nó được dùng để điều trị tiểu đường không phụ thuộc insulin.

Tác dụng của glimepiride chủ yếu dựa vào việc kích thích giải phóng insulin từ tế bào beta của tuyến tụy. Giống như các sulfonyleurea khác, tác dụng này dựa trên sự tăng đáp ứng của tế bào beta của tuyến tụy đối với tác nhân kích thích sinh học là glucose. Ngoài ra, glimepiride dường như có tác dụng ngoài tuyến tụy rõ rệt, tác dụng này cũng được công nhận ở các sulfonyleurea khác.

Giải phóng insulin

Sulfonyleurea điều tiết giải phóng insulin bằng cách đóng các kênh kali phụ thuộc ATP trên màng các tế bào beta. Việc đóng các kênh kali này dẫn đến khử cực màng trên tế bào beta và làm mở kênh calci, làm cho tăng lượng calci đi vào tế bào. Việc tăng nồng độ calci trong tế bào sẽ làm tăng giải phóng insulin ra khỏi tế bào qua các đại thực bào.

Glimepiride liên kết với protein màng tế bào beta với tỷ lệ cao. Việc này liên quan tới kênh kali phụ thuộc ATP nhưng liên kết này khác vị trí liên kết của các sulfonyleurea thông thường.

Tác dụng ngoài tuyến tụy

Tác dụng ngoài tụy như cải thiện sự nhạy cảm của các mô ngoại vi đối với insulin và giảm sự thu nạp insulin ở gan.

Thu nạp glucose từ máu vào các mô cơ và mô mỡ được thực hiện thông qua các protein vận chuyển qua màng tế bào. Việc vận chuyển glucose vào mô này là nhân tố hạn chế sự tiêu thụ glucose.

Glimepiride làm tăng rất nhanh số lượng các phân tử vận chuyển glucose qua màng tế bào cơ và mỡ kết quả là kích thích thu nạp glucose. Glimepiride làm tăng hoạt động của enzym glycosyl- phosphatidylinositol phospholipase C, enzym này có liên quan đến việc tạo thành lipid và glycogen trong tế bào mỡ và cơ.

Glimepiride ức chế sản xuất glucose ở gan bằng cách tăng nồng độ fructose-2,6-bisphosphate trong tế bào do đó sẽ ức chế tổng hợp glucose.

Thông tin chung

Liều uống tối thiểu có hiệu quả ở người khỏe mạnh là khoảng 0,6 mg. Tác dụng của glimepiride phụ thuộc vào liều và khả năng tái sinh. Đáp ứng sinh lý với hoạt động thể chất, giảm bài tiết insulin, vẫn xảy ra khi dùng glimepiride.

Không có khác biệt đáng kể về tác dụng của thuốc khi thuốc được uống 30 phút trước bữa ăn hoặc ngay trước bữa ăn. Ở bệnh nhân tiểu đường, kiểm soát tốt đường huyết có thể đạt được sau 24 giờ với liều dùng 1 lần hàng ngày.

Mặc dù các chất chuyển hóa hydroxy của glimepiride cũng có tác dụng hạ đường huyết nhẹ ở người khỏe mạnh, nhưng nó chỉ đóng góp một phần nhỏ vào tác dụng hạ glucose huyết toàn phần.

Kết hợp điều trị với metformin

Trong một nghiên cứu trên bệnh nhân cho thấy: cải thiện kiểm soát chuyển hóa trong điều trị kết hợp với glimepiride không tương xứng so với dùng một mình metformin với liều tối đa.

Kết hợp điều trị với insulin

Dữ liệu về liệu pháp điều trị kết hợp với insulin hạn chế. Ở những bệnh nhân không kiểm soát được đường huyết tương xứng với liều tối đa một ngày của một mình glimepiride, thì cần phải chỉ định điều trị kết hợp với insulin. Trong hai nghiên cứu, liệu pháp điều trị kết hợp cũng kiểm soát được đường huyết giống như dùng một mình insulin. Tuy nhiên, trong điều trị kết hợp cần phải liều trung bình của insulin.



ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Sinh khả dụng đường uống của glimepiride rất cao. Thức ăn không có ảnh hưởng đến hấp thu. Tốc độ hấp thu có giảm đi một chút. Nồng độ đỉnh trong huyết thanh (C_{max}) đạt được khoảng 2,5 giờ sau khi uống (có nghĩa là 0,3 $\mu\text{g/ml}$ trong suốt đợt dùng thuốc với liều dùng là 4 mg/ngày) và có một mối quan hệ tuyến tính giữa liều lượng với cả C_{max} và AUC (diện tích dưới đường cong).

Phân bố

Thể tích phân bố của glimepiride rất thấp (khoảng 8,8 lít) tương tự như thể tích phân bố của albumin, liên kết mạnh với protein (> 99%) và độ thanh thải thấp (khoảng 48 ml / phút.). Ở động vật, glimepiride được bài tiết vào sữa mẹ. Glimepiride qua được hàng rào nhau thai. Một lượng nhỏ thuốc vượt qua được hàng rào máu não.

Chuyển hoá và thải trừ

Nửa đời huyết thanh trung bình có liên quan tới nồng độ thuốc trong huyết thanh sau khi dùng liều lặp đi lặp lại, là khoảng 5 đến 8 giờ. Sau khi dùng liều cao, thời gian bán thải của thuốc có hơi kéo dài cũng đã được ghi nhận.

Sau dùng một liều duy nhất glimepiride được đánh dấu, 58% chất này đã được tìm thấy trong nước tiểu và 35% trong phân. Trong nước tiểu, không phát hiện thấy có glimepiride chưa chuyển hoá. Hai chất chuyển hóa - có lẽ hầu hết là kết quả của sự chuyển hóa ở gan (chủ yếu bởi CYP2C9) - đã được phát hiện trong cả nước tiểu và phân, đó là: các dẫn xuất hydroxy và carboxy. Sau khi uống glimepiride, thời gian bán thải cuối cùng của những chất chuyển hoá này tương ứng là 3 - 6 giờ và 5 - 6 giờ.

So sánh sử dụng liều duy nhất và liều lặp đi lặp lại một lần mỗi ngày cho thấy không có sự khác biệt đáng kể về dược động học, và các thay đổi do cá thể là rất thấp. Không có tích lũy liên quan. Dược động học ở nam và nữ là tương tự nhau cũng như ở bệnh nhân trẻ và cao tuổi (trên 65 tuổi). Ở những bệnh nhân có độ thanh thải creatinin thấp, có xu hướng độ thanh thải glimepiride tăng nồng độ và trung bình trong huyết thanh giảm, có lẽ đó là do kết quả của việc thải trừ nhanh do thuốc liên kết với protein thấp. Hai chất chuyển hóa được thải trừ qua thận giảm. Nói chung sẽ không có giả định về tăng nguy cơ tích lũy thuốc ở những bệnh nhân này.

Dược động học ở năm bệnh nhân không bị tiểu đường sau khi phẫu thuật ống mật cũng giống như ở những người khỏe mạnh.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI:

Hộp 3 vỉ $\times$ 10 viên.

BẢO QUẢN, HẠN DÙNG, TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Điều kiện bảo quản: Bảo quản nơi khô thoáng, nhiệt độ dưới 30 °C.

Hạn dùng: 48 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn chất lượng: Nhà sản xuất

TÊN, ĐỊA CHỈ CỦA CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC

Sản xuất tại Đức, bởi:

DENK PHARMA GmbH & Co. KG

Địa chỉ: Gölstr. 1, 84529 Tittmoning, Đức.