https://trungtamthuoc.com/

*HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG THUỐC*

Rx

# VINSAXDE

*Viên nén*

*ĐỂ XA TẦM TAY TRẺ EM.*
*ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG.*
*THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN THUỐC.*

**THÀNH PHẦN CÔNG THỨC THUỐC:** cho 1 viên:
Thành phần dược chất: Vildagliptin 50 mg.
Thành phần tá dược: Calci phosphate dibasic khan, Povidon K30, Natri croscarmellose, Magnesi stearat, Silicon dioxyd keo.

**DẠNG BÀO CHẾ:** Viên nén màu trắng đến vàng nhạt, hình tròn, cạnh và thành viên lành lặn.

**CHỈ ĐỊNH**
Thuốc được chỉ định như một thuốc hỗ trợ cho chế độ ăn và luyện tập để cải thiện sự kiểm soát đường huyết ở bệnh nhân đái tháo đường typ 2 (T2DM):
- Đơn trị liệu cho bệnh nhân không kiểm soát đầy đủ bằng chế độ ăn và tập luyện đơn thuần và không thể sử dụng metformin do có những chống chỉ định hoặc không dung nạp.
- Trong phối hợp 2 loại thuốc:
+ Với metformin ở bệnh nhân không kiểm soát đường huyết đầy đủ khi dùng metformin đơn trị liệu ở liều tối đa dung nạp.
+ Với một sulfonylure (SU) khi chế độ ăn, luyện tập và sulfonylure đơn độc không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.
+ Với một thiazolidinedion (TZD) khi chế độ ăn, luyện tập và thiazolidinedion không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.
- Trong phối hợp 3 loại thuốc:
Với một sulfonylure và metformin khi chế độ ăn, luyện tập và điều trị kép bằng những thuốc này không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.
Vinsaxde cũng được chỉ định phối hợp với insulin (có hoặc không có dùng metformin) khi chế độ ăn, luyện tập và liều insulin ổn định không đem lại sự kiểm soát đường huyết đầy đủ.

**CÁCH DÙNG - LIỀU DÙNG:**
**Liều dùng:**
***Người lớn:***
Kiểm soát việc điều trị đái tháo đường nên tùy theo từng bệnh nhân.
Liều được khuyến cáo của vildagliptin là 50 mg một hoặc hai lần mỗi ngày.
Trong đơn trị liệu và trong điều trị kết hợp với metformin, với thiazolidinedion, với metformin và sulphonylurea hoặc với insulin (có hoặc không có metformin), liều được khuyến cáo của vildagliptin 100 mg/ngày, dùng một liều 50 mg vào buổi sáng và một liều 50 mg vào buổi tối.
Khi điều trị phối hợp hai loại thuốc với một sulfonylure, liều khuyến cáo của vildagliptin là 50 mg một lần một ngày vào buổi sáng. Ở nhóm bệnh nhân này, vildagliptin 100 mg/ngày không hiệu quả hơn vildagliptin 50 mg, 1 lần/ngày. Khi sử dụng kết hợp với một sulphonylure, có thể xem xét liều sulphonylurea thấp hơn để giảm nguy cơ hạ đường huyết.
Liều lớn hơn 100 mg không được khuyến cáo.
Nếu quên một liều Vinsaxde, cần uống ngay khi bệnh nhân nhớ ra. Không nên uống một liều gấp đôi trong cùng một ngày.
Độ an toàn và hiệu quả của vildagliptin trong phác đồ phối hợp ba thuốc đường uống với metformin và một dẫn chất thiazolidinedion chưa được thiết lập.
***Đối tượng đặc biệt***
*Bệnh nhân cao tuổi (trên 65 tuổi)*
Ở những bệnh nhân ≥ 65 tuổi và ≥ 75 tuổi được điều trị bằng vildagliptin, không quan sát thấy sự khác biệt về độ an toàn tổng thể, sự dung nạp hoặc hiệu quả giữa nhóm bệnh nhân cao tuổi này với những bệnh nhân trẻ tuổi hơn. Do đó không cần điều chỉnh liều trên bệnh nhân cao tuổi.
*Suy thận*
Không cần hiệu chỉnh liều vildagliptin ở bệnh nhân suy thận nhẹ (creatinin ≥ 50 ml/phút). Ở bệnh nhân suy thận trung bình hoặc nặng hoặc bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD), liều vildagliptin khuyến cáo là 50 mg, 1 lần/ngày.

https://trungtamthuoc.com/

*Suy gan*
Không khuyến cáo dùng vildagliptin cho bệnh nhân suy gan, kể cả bệnh nhân có ALT hoặc AST trước điều trị > 3 lần giới hạn trên của mức bình thường (ULN).
*Bệnh nhân trẻ em (dưới 18 tuổi)*
Vildagliptin chưa được nghiên cứu ở bệnh nhân dưới 18 tuổi, do đó không khuyến cáo dùng vildagliptin cho trẻ em.
**Cách dùng:**
Dùng đường uống.
Vinsaxde có thể dùng cùng hoặc không cùng thức ăn.

## CHỐNG CHỈ ĐỊNH:
Quá mẫn với dược chất hoặc với bất kỳ thành phần tá dược nào.

## CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC:
Vildagliptin không phải là một chất thay thế insulin trên bệnh nhân cần insulin. Không được dùng Vildagliptin cho bệnh nhân đái tháo đường typ 1 hoặc để điều trị nhiễm toan ceton do đái tháo đường.
***Đối tượng đặc biệt***
*Bệnh nhân suy thận*
Có ít kinh nghiệm ở bệnh nhân ESRD đang chạy thận nhân tạo. Do đó nên sử dụng thuốc một cách thận trọng cho những bệnh nhân này.
*Bệnh nhân suy gan*
Thuốc không được dùng cho bệnh nhân suy gan, kể cả bệnh nhân có ALT hoặc AST > 3 lần ULN trước điều trị.
Các trường hợp hiếm gặp về rối loạn chức năng gan (kể cả viêm gan) đã được báo cáo. Trong những trường hợp này, bệnh nhân thường không có triệu chứng, không có di chứng lâm sàng và các xét nghiệm chức năng gan trở về bình thường sau khi ngừng điều trị. Cần thực hiện các xét nghiệm chức năng gan trước khi bắt đầu điều trị bằng vildagliptin 3 tháng một lần trong năm đầu và định kỳ sau đó. Những bệnh nhân bị tăng nồng độ transaminase cần được theo dõi bằng cách đánh giá lại chức năng gan lần thứ hai để khẳng định kết quả và sau đó phải thường xuyên xét nghiệm chức năng gan cho đến khi các trị số bất thường trở về nồng độ bình thường. Nếu AST hoặc ALT tăng gấp 3 lần ULN (giới hạn trên của mức bình thường) hoặc cao hơn và kéo dài, khuyến cáo ngừng điều trị bằng vildagliptin.
Nếu bệnh nhân bị vàng da hoặc các dấu hiệu khác cho thấy rối loạn chức năng gan, phải dừng dùng vildagliptin và liên hệ với bác sỹ ngay.
Sau khi ngừng điều trị bằng vildagliptin và các xét nghiệm chức năng gan đã trở về bình thường, không được dùng lại vildagliptin.
*Suy tim*
Một thử nghiệm lâm sàng với vildagliptin trên bệnh nhân có phân độ suy tim theo Hiệp hội tim New York (NYHA) từ I - III cho thấy điều trị với vildagliptin không liên quan đến sự thay đổi chức năng thất trái hoặc làm nặng thêm tình trạng suy tim sung huyết (CHF) trước đó, so với giả dược. Kinh nghiệm lâm sàng trên bệnh nhân có suy tim độ III theo NYHA được điều trị với vildagliptin còn hạn chế và kết quả là không kết luận được.
Không có kinh nghiệm về việc sử dụng vildagliptin trong các thử nghiệm lâm sàng ở bệnh nhân suy tim độ IV theo phân độ chức năng của NYHA và do đó không khuyến cáo sử dụng ở những bệnh nhân này.
*Rối loạn da*
Tổn thương da, bao gồm phồng rộp và loét đã được báo cáo ở các chi của khỉ trong các nghiên cứu độc học phi lâm sàng. Mặc dù không quan sát thấy các tổn thương da với tỷ lệ tăng trong các thử nghiệm lâm sàng, có kinh nghiệm còn hạn chế ở bệnh nhân bị biến chứng về da do đái tháo đường.
Hơn nữa, đã có báo cáo hậu mãi về tổn thương da dạng bóng nước và tróc vảy. Vì vậy, để phù hợp với chăm sóc thường quy ở bệnh nhân đái tháo đường, khuyến cáo nên theo dõi các rối loạn da như phồng rộp hoặc loét.
*Viêm tụy cấp*
Theo kinh nghiệm sau khi đưa thuốc ra thị trường, có một số trường hợp viêm tụy cấp được báo cáo tự phát. Bệnh nhân phải được thông báo về các triệu chứng đặc trưng của viêm tụy cấp như: đau bụng nhiều và kéo dài.
Nếu nghi ngờ viêm tụy, phải dừng dùng vildagliptin; nếu đã xác định viêm tụy cấp thì không được điều trị vildagliptin trở lại. Cần thận trọng ở bệnh nhân có tiền sử viêm tụy cấp.
*Hạ đường huyết*
Sulfonylure đã được biết gây hạ đường huyết. Bệnh nhân đang dùng vildagliptin phối hợp với sulfonylure có thể có nguy cơ hạ đường huyết. Vì vậy có thể xem xét dùng một liều sulphonylure thấp hơn để làm giảm nguy cơ hạ đường huyết.

## SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ:
*Phụ nữ có thai*
Chưa có đủ kinh nghiệm sử dụng vildaglipin trên phụ nữ có thai. Vildagliptin không gây quái thai trên cả chuột cống và thỏ. Không nên dùng vildagliptin trong thời kỳ mang thai trừ khi lợi ích mang lại cho người mẹ cao hơn nguy cơ tiềm ẩn đối với thai.

https://trungtamthuoc.com/

*Phụ nữ cho con bú*
Chưa rõ vildagliptin có được bài tiết vào sữa mẹ hay không, do đó không nên dùng vildagliptin đối với phụ nữ cho con bú.
*Khả năng sinh sản*
Chưa có nghiên cứu về ảnh hưởng trên khả năng sinh sản ở người được thực hiện với vildagliptin.

**ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC:**
Chưa ghi nhận được báo cáo phản ứng bất lợi hoặc chưa có nghiên cứu nào về ảnh hưởng của thuốc lên khả năng vận hành máy móc, lái tàu xe, người làm việc trên cao và các trường hợp khác. Vì vậy những bệnh nhân có thể bị chóng mặt nên tránh lái xe hoặc vận hành máy móc.

**TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỴ CỦA THUỐC:**
Vildagliptin có khả năng tương tác thuốc yếu. Vì vildagliptin không phải là một cơ chất của enzym cytochrom P450 (CYP450), không ức chế và cũng không gây cảm ứng các enzym CYP450 nên không có khả năng tương tác với các thuốc dùng đồng thời là cơ chất, chất ức chế hoặc chất gây cảm ứng các enzym này.
Hơn nữa, vildagliptin không ảnh hưởng đến độ thanh thải chuyển hóa của các thuốc dùng đồng thời được chuyển hóa bởi CYP 1A2, CYP 2C8, CYP 2C9, CYP 2C19, CYP 2D6, CYP 2E1 và CYP 3A4/5. Các nghiên cứu về tương tác thuốc - thuốc đã được tiến hành với các thuốc thường được kê đơn đồng thời cho bệnh nhân đái tháo đường typ 2 hoặc những thuốc có cửa sổ điều trị hẹp. Kết quả của những nghiên cứu này cho thấy không có tương tác nào có ý nghĩa lâm sàng với các thuốc điều trị đái tháo đường dạng uống khác (glibenclamid, pioglitazon, metformin), amlodipin, digoxin, ramipril, simvastatin, valsartan hoặc warfarin sau khi dùng đồng thời với vildagliptin.
*Kết hợp với các chất ức chế men chuyển (ACE):*
Có thể có tăng nguy cơ phù mạch ở bệnh nhân dùng kết hợp với chất ức chế ACE.
*Tính tương kỵ*
Chưa quan sát thấy tương kỵ vật lý hoặc hóa học nào.

**TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN (ADR):**
***Khái quát dữ liệu an toàn***
Dữ liệu an toàn thu được từ tổng số 3.784 bệnh nhân dùng vildagliptin với liều hàng ngày 50 mg (1 lần/ngày) hoặc 100 mg (50 mg, 2 lần/ngày hoặc 100 mg, 1 lần/ngày) ở các thử nghiệm có đối chứng trong thời gian ít nhất 12 tuần. Trong số những bệnh nhân này, có 2.264 bệnh nhân dùng vildagliptin đơn trị liệu và 1.520 bệnh nhân dùng vildagliptin phối hợp với một thuốc khác. 2.682 bệnh nhân được điều trị bằng vidagliptin 100 mg/ngày (50 mg, 2 lần/ngày hoặc 100 mg, 1 lần/ngày) và 1.102 bệnh nhân được điều trị bằng vildagliptin 50 mg, 1 lần/ngày.
Đa số các phản ứng bất lợi trong các thử nghiệm này là nhẹ và thoáng qua, không phải ngừng điều trị. Không có sự liên quan giữa những phản ứng bất lợi này với tuổi, chủng tộc, thời gian dùng thuốc hoặc liều lượng hàng ngày.
Các trường hợp hiếm gặp về rối loạn chức năng gan (kể cả viêm gan) đã được báo cáo. Trong những trường hợp này, bệnh nhân thường không có triệu chứng, không có dị chứng lâm sàng và các xét nghiệm chức năng gan trở về bình thường sau khi ngừng điều trị. Trong các dữ liệu của các thử nghiệm đơn trị liệu và điều trị bổ trợ có đối chứng trong thời gian đến 24 tuần, tỷ lệ tăng ALT hoặc AST ≥ 3 lần giới hạn trên của mức bình thường (ULN) (theo phân loại hiện nay dựa vào ít nhất 2 lần đo liên tiếp hoặc lúc thăm khám cuối cùng trong quá trình điều trị) là 0,2% đối với vildagliptin 50 mg, 1 lần/ngày; 0,3% đối với vildagliptin 50 mg, 2 lần/ngày và 0,2% đối với tất cả các thuốc so sánh. Sự tăng các transaminase này thường không có triệu chứng, về bản chất không tiến triển và không đi kèm với ứ mật hoặc vàng da.
Những trường hợp phù mạch hiếm gặp đã được báo cáo khi dùng vildagliptin với một tỷ lệ tương tự như ở nhóm đối chứng. Tỷ lệ cao hơn về các trường hợp này đã được báo cáo khi dùng vildagliptin phối hợp với thuốc ức chế men chuyển (ACEI). Đa số các trường hợp đều ở mức độ nhẹ và qua đi khi tiếp tục điều trị bằng vildagliptin.
***Bảng danh sách các phản ứng bất lợi***
Các phản ứng bất lợi đã được báo cáo ở bệnh nhân dùng vildagliptin trong các nghiên cứu mù đôi dưới dạng đơn trị liệu và điều trị bổ trợ được liệt kê dưới đây, đối với mỗi chỉ định, theo hệ cơ quan và tần suất gặp phải.
Các tần suất được quy ước là: thường xuyên (≥ 1/10); thường gặp (≥ 1/100 đến < 1/10); ít gặp (≥ 1/1.000 đến < 1/100); hiếm gặp (≥ 1/10.000 đến < 1/1.000); rất hiếm gặp (< 1/10.000); không rõ (không thể ước tính từ các dữ liệu hiện có). Trong mỗi nhóm tần suất, các phản ứng bất lợi được trình bày theo thứ độ mức độ nghiêm trọng giảm dần.
*Phối hợp với metformin*

| | |
|---|---|
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Thường gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Thường gặp | Run |
| Thường gặp | Nhức đầu |
| Thường gặp | Chóng mặt |

https://trungtamthuoc.com/

| | |
|---|---|
| Ít gặp | Mệt mỏi |
| *Rối loạn tiêu hóa* | |
| Thường gặp | Buồn nôn |

*Phối hợp với sulfonylure*

| | |
|---|---|
| *Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng* | |
| Rất hiếm gặp | Viêm mũi họng |
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Thường gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Thường gặp | Run |
| Thường gặp | Nhức đầu |
| Thường gặp | Chóng mặt |
| Thường gặp | Suy nhược |
| *Rối loạn tiêu hóa* | |
| Thường gặp | Táo bón |

*Phối hợp với thiazolidinedion*

| | |
|---|---|
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Thường gặp | Tăng cân |
| Ít gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Ít gặp | Nhức đầu |
| Ít gặp | Suy nhược |
| *Rối loạn mạch* | |
| Thường gặp | Phù ngoại biên |

*Đơn trị liệu*

| | |
|---|---|
| *Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng* | |
| Rất hiếm gặp | Nhiễm trùng đường hô hấp trên |
| Rất hiếm gặp | Viêm mũi họng |
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Ít gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Thường gặp | Chóng mặt |
| Ít gặp | Nhức đầu |
| *Rối loạn mạch* | |
| Ít gặp | Phù ngoại biên |
| *Rối loạn tiêu hóa* | |
| Ít gặp | Táo bón |
| *Rối loạn hệ cơ xương và mô liên kết* | |
| Ít gặp | Đau khớp |

https://trungtamthuoc.com/

*Phối hợp với metformin và một sulfonylure*

| | |
|---|---|
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Thường gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Thường gặp | Chóng mặt, run |
| *Rối loạn da và mô dưới da* | |
| Thường gặp | Tăng tiết mồ hôi |
| *Rối loạn toàn thân và tình trạng tại chỗ dùng thuốc.* | |
| Thường gặp | Suy nhược |

*Phối hợp với insulin*

| | |
|---|---|
| *Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng* | |
| Thường gặp | Hạ đường huyết |
| *Rối loạn hệ thần kinh* | |
| Thường gặp | Nhức đầu, ớn lạnh |
| *Rối loạn tiêu hóa* | |
| Thường gặp | Buồn nôn, bệnh trào ngược dạ dày-thực quản |
| Ít gặp | Tiêu chảy, đầy hơi |

*Kinh nghiệm hậu mãi*

| | |
|---|---|
| *Rối loạn tiêu hóa* | |
| Không rõ | Viêm tụy |
| *Rối loạn gan mật* | |
| Không rõ | Viêm gan (có hồi phục khi ngừng thuốc)<br>Xét nghiệm chức năng gan bất thường (có hồi phục khi ngừng thuốc) |
| *Rối loạn da và mô dưới da* | |
| Không rõ | Mề đay<br>Các loại tổn thương da có bóng, nước và tróc vảy, bao gồm bệnh da bọng nước tự nhiên |
| *Cơ xương khớp và rối loạn mô liên kết* | |
| Không rõ | Đau cơ |

*Báo cáo các phản ứng bất lợi*

Việc báo cáo các phản ứng bất lợi nghi ngờ sau khi được cấp giấy phép lưu hành sản phẩm là quan trọng. Điều này cho phép theo dõi liên tục cân bằng giữa lợi ích và nguy cơ của thuốc.

*Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc.*

## QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ:

Thông tin liên quan đến quá liều với vildagliptin còn hạn chế.

***Dấu hiệu và triệu chứng***

Thông tin về các triệu chứng có khả năng xảy ra khi quá liều được lấy từ một nghiên cứu về khả năng dung nạp liều cao ở những người khỏe mạnh được dùng vildagliptin 50mg trong 10 ngày. Ở liều 400 mg, có 3 trường hợp đau cơ, các trường hợp riêng lẻ về dị cảm nhẹ và thoáng qua, sốt, phù và tăng thoáng qua về nồng độ lipase (gấp 2 lần giới hạn trên của mức bình thường). Ở liều 600 mg, một người bị phù bàn chân và bàn tay và nồng độ creatin phosphokinase (CPK) tăng cao, kèm theo tăng aspartat aminotransferase (AST), protein phản ứng C (CRP) và mức myoglobin. Thêm 3 người ở nhóm liều này có biểu hiện phù cả hai bàn chân, kèm theo dị cảm ở 2 trường hợp. Tất cả các triệu chứng và bất thường về xét nghiệm mất đi sau khi ngừng thuốc nghiên cứu.

***Xử trí***

Trong trường hợp quá liều, nên xử trí hỗ trợ. Vildagliptin không thể loại bỏ bằng thẩm tách, tuy nhiên chất chuyển hóa chính do thủy phân (LAY 151) có thể loại bỏ bằng thẩm tách máu.

https://trungtamthuoc.com/

**ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:**

Mã ATC: A10BH02.

Nhóm dược lý: chất ức chế dipeptidyl-peptidase-4 (DPP-4).

**Cơ chế tác động:**

Vildagliptin, một chất thuộc nhóm thuốc tăng cường chức năng tiểu đảo tụy, là chất ức chế dipeptidyl-peptidase-4 (DPP-4) mạnh và chọn lọc nên cải thiện được sự kiểm soát đường huyết. Sự ức chế DPP-4 của vildagliptin làm tăng nồng độ hormon incretin GLP-1 (glucagon- like peptid 1) và GIP (glucose-denpendent insulinotropic polypedtid) nội sinh lúc đói và sau bữa ăn.

**Dược lực học (PD)**

Dùng vildagliptin dẫn đến ức chế nhanh và hoàn toàn hoạt động của DPP-4. Ở bệnh nhân đái tháo đường typ 2, dùng vildagliptin dẫn đến ức chế hoạt tính enzym DPP-4 trong thời gian 24 giờ.

Bằng cách làm tăng nồng độ nội sinh của các hormon incretin này, vildagliptin làm tăng tính nhạy cảm của tế bào β đối với glucose, dẫn đến cải thiện sự tiết insulin phụ thuộc glucose. Điều trị với liều 50 - 100 mg/ngày cho bệnh nhân đái tháo đường typ 2 cải thiện đáng kể các yếu tố chỉ điểm chức năng của tế bào β. Mức độ cải thiện chức năng tế bào β phụ thuộc vào mức độ suy giảm ban đầu; ở người không bị đái tháo đường (đường huyết bình thường), vildagliptin không kích thích tiết insulin hoặc không làm giảm nồng độ glucose huyết.

Bằng cách làm tăng nồng độ GLP-1 nội sinh, vildagliptin tăng tính nhạy cảm của tế bào α đối với glucose, dẫn đến tiết glucagon phù hợp với mức glucose hơn. Sự giảm tiết glucagon không phù hợp trong bữa ăn dẫn đến làm giảm sự đề kháng insulin.

Sự gia tăng tỷ lệ insulin/glucagon trong tăng đường huyết do tăng nồng độ hormon incretin làm giảm sản xuất glucose ở gan lúc đói và sau bữa ăn, dẫn đến giảm đường huyết.

Tác dụng đã biết về sự tăng nồng độ GLP-1 làm chậm rỗng dạ dày không được quan sát thấy khi điều trị bằng vildagliptin. Ngoài ra, đã quan sát thấy sự giảm lipid huyết sau bữa ăn không liên quan với tác dụng qua trung gian incretin của vildagliptin để cải thiện chức năng tiểu đảo tụy.

**ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:**

*Hấp thu*

Sau khi uống lúc đói, vildagliptin được hấp thu nhanh với nồng độ đỉnh trong huyết tương được quan sát thấy sau 1,75 giờ. Dùng cùng với thức ăn làm giảm nhẹ tốc độ hấp thu của vildagliptin, được đặc trưng bởi nồng độ đỉnh giảm 19% và có sự chậm lại về thời gian đến nồng độ đỉnh trong huyết tương đến 2,5 giờ. Không có thay đổi về mức độ hấp thu và thức ăn không làm thay đổi diện tích dưới đường cong (AUC). Sinh khả dụng tuyệt đối là 85%.

*Phân bố*

Vildagliptin liên kết kém với protein huyết tương (9,3%) và phân bố bằng nhau giữa huyết tương và hồng cầu. Thể tích phân bố trung bình của vildagliptin ở trạng thái ổn định sau khi tiêm tĩnh mạch (Vss) là 71 lít gợi ý thuốc được phân bố ở ngoài mạch.

*Chuyển hóa:*

Chuyển hóa là đường thải trừ chính của vildagliptin ở người, chiếm 69% liều dùng. Chất chuyển hóa chính LAY 151 không có hoạt tính dược lý và là sản phẩm thủy phân của nhóm chức cyano chiếm 57% liều dùng, tiếp theo là sản phẩm thủy phân nhóm chức amid (4% liều dùng). DPP-4 đóng góp một phần vào sự thủy phân của vildagliptin như đã được chứng minh trong một nghiên cứu *in vivo* dùng chuột cống thiếu hụt DPP-4. Vildagliptin không bị chuyển hóa bởi các enzym cytochrom P450 ở bất kỳ mức độ nào có thể định lượng được. Các nghiên cứu *in vitro* cho thấy vildagliptin không ức chế hoặc gây cảm ứng enzym cytochrom P450.

*Thải trừ:*

Sau khi uống [14C]-vildagliptin, khoảng 85% liều dùng được bài tiết vào nước tiểu và 15% được tìm thấy ở phân. Vildagliptin dạng không đổi bài tiết qua thận chiếm 23% liều dùng sau khi uống. Sau khi tiêm tĩnh mạch cho người khỏe mạnh, độ thanh thải toàn phần trong huyết tương của vildagliptin là 41 lít/giờ và độ thanh thải thận của vildagliptin là 13 lít/giờ. Thời gian bán thải trung bình sau khi tiêm tĩnh mạch khoảng 2 giờ. Thời gian bán thải sau khi uống khoảng 3 giờ và không phụ thuộc vào liều dùng.

*Tuyến tính/Không tuyến tính*

Nồng độ đỉnh trong huyết tương của vildagliptin và diện tích dưới đường cong nồng độ trong huyết tương theo thời gian (AUC) gần như tăng tỷ lệ với liều dùng trong phạm vi liều điều trị.

***Đối tượng đặc biệt***

*Giới tính*

Không quan sát thấy sự khác nhau về dược động học của vildagliptin giữa các đối tượng nam và nữ với sự khác biệt về tuổi tác và chỉ số cơ thể (BMI). Sự ức chế DPP-4 của vildagliptin không bị ảnh hưởng bởi giới tính.

*Người cao tuổi*

Ở những người cao tuổi khỏe mạnh (≥ 70 tuổi), mức phơi nhiễm toàn bộ với vildagliptin (100 mg, 1 lần/ngày) tăng 32% với nồng độ đỉnh trong huyết tương tăng 18% so với người trẻ tuổi khỏe mạnh (18-40 tuổi). Những thay đổi này được xem là không có ý nghĩa lâm sàng. Sự ức chế DPP-4 của vildagliptin không bị ảnh hưởng do tuổi tác trong những nhóm tuổi được nghiên cứu.

https://trungtamthuoc.com/

*Suy gan*
Ảnh hưởng của suy chức năng gan trên dược động học của vildagliptin đã được nghiên cứu trên những người bị suy gan mức độ nhẹ, trung bình và nặng dựa vào thang điểm Child-Pugh (trong khoảng từ 6 là mức độ nhẹ đến 12 là mức độ nặng) so với người có chức năng gan bình thường. Mức tiếp xúc với vildagliptin ở người bị suy gan nặng tăng 22%. Sự thay đổi tối đa (tăng hoặc giảm) về mức tiếp xúc với vildagliptin khoảng 30% nhưng không được xem là có ý nghĩa lâm sàng. Không có mối tương quan giữa mức độ suy chức năng gan và sự thay đổi về mức tiếp xúc với vildagliptin.
*Suy thận*
AUC của vildagliptin tăng trung bình 1,4; 1,7 và 2 lần ở các bệnh nhân suy thận nhẹ, vừa và nặng, theo thứ tự, so với người bình thường. AUC của các chất chuyển hóa LAY 151 tăng 1,6; 3,2 và 7,3 lần và AUC của BQS867 tăng 1,4; 2,7 và 7,3 lần ở các bệnh nhân suy thận nhẹ, vừa và nặng, theo thứ tự, so với người tình nguyện khỏe mạnh. Dữ liệu hạn chế ở bệnh nhân bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD) cho thấy AUC của vildagliptin tương tự như ở bệnh nhân suy thận nặng. Nồng độ LAY 151 ở các bệnh nhân ESRD cao hơn khoảng 2 đến 3 lần so với các bệnh nhân suy thận nặng. Khuyến cáo chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận trung bình hoặc suy thận nặng hoặc bệnh thận giai đoạn cuối (ESRD).
Vildagliptin đã được loại bỏ đến một mức độ nhất định bằng chạy thận nhân tạo (3% khi chạy thận nhân tạo trong 3 - 4 giờ, bắt đầu 4 giờ sau khi uống thuốc).
*Chủng tộc*
Không có bằng chứng cho thấy chủng tộc có ảnh hưởng đến dược động học của vildagliptin.

**QUY CÁCH ĐÓNG GÓI:** Hộp 3 vỉ x 10 viên. Hộp 2 vỉ x 14 viên.

**ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN:** Nơi khô, nhiệt độ không quá 30°C, tránh ánh sáng.

**HẠN DÙNG:** 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

**TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG:** TCCS.

**TÊN, ĐỊA CHỈ CỦA CƠ SỞ SẢN XUẤT:**

Công ty Cổ phần Dược phẩm Công nghệ cao Abipha
Lô đất CN-2, Khu công nghiệp Phú Nghĩa, Xã Phú Nghĩa, Huyện Chương Mỹ, Thành phố Hà Nội
Điện thoại: 024.363253888; Fax: 024.363253888
Website: www.abipha.com.vn