

Rx
PERGLIM M-1
PERGLIM M-2
Viên nén phồng thích chậm Metformin hydrochloride/Glimepiride

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

Thành phần
Thành phần được chứa:
Perglim M-1: Mỗi viên nén phồng thích chậm chứa:
Metformin hydrochloride.....500 mg
Glimepiride.....1 mg
Tà dược màu: oxyd sắt đỏ
Perglim M-2: Mỗi viên nén phồng thích chậm chứa:
Metformin hydrochloride.....500 mg
Glimepiride.....2 mg
Thành phần tá dược:
Tà dược màu: oxyd sắt vàng, titan dioxyd.
*Tà dược khác:*hypromellose, natri carboxymethylcellulose, macrogol 6000, povidon, methacrylic acid copolymer dispersion, magnesii stearat, lactose, cellulose vi tinh thể, pregelatinised starch, tinh bột natri glycolat.

Dạng bào chế
Viên nén phồng thích chậm

Mô tả
Perglim M-1: Viên nén, hình thuẫn dài, hai mặt hơi lồi, hai lớp: một lớp màu trắng và một lớp màu đỏ.
Perglim M-2: Viên nén, hình thuẫn dài, hai mặt hơi lồi, hai lớp: một lớp màu trắng và một lớp màu vàng.

Chỉ định
Tiểu đường không phụ thuộc insulin (tiểu đường typ II) ở bệnh nhân trên 18 tuổi, khi chế độ ăn kiêng, tập thể dục và giảm cân không kiểm soát được đường huyết. Điều trị thay thế ở những bệnh nhân tiểu đường đã điều trị ổn định với glimepiride (1-2 mg) và metformin (500 mg dạng phồng thích chậm).

Cách dùng, liều dùng
Liều khuyến cáo
Glimepiride 1 mg/ metformin hydrochloride 500 mg: Uống 1 – 2 viên/ lần/ ngày, tối đa 3 viên/ngày hoặc theo sự chỉ định của thầy thuốc.
Glimepiride 2 mg/ metformin hydrochloride 500 mg: Uống 1 viên/ ngày hoặc theo sự chỉ định của thầy thuốc.
Liều khởi đầu của metformin đối với bệnh nhân đang không sử dụng metformin là 500 mg, một lần/ngày, dùng đường uống. Nếu bệnh nhân không gặp phản ứng có hai đường tiểu hóa và cần phải tăng liều thì có thể dùng thêm 500 mg sau mỗi khoảng thời gian điều trị từ 1 đến 2 tuần. Liều dùng của Perglim M cần được cân nhắc điều chỉnh trên từng bệnh nhân cụ thể dựa trên hiệu quả và độ dung nạp của bệnh nhân và không vượt quá liều tối đa được khuyến cáo (2000 mg/ ngày cho metformin và 8 mg/ngày cho glimepiride).
Uống nguyên viên với nước, không được nghiền hoặc nhai viên thuốc. Nền bắt đầu với 1 viên mỗi ngày. Mục đích của việc điều trị là làm giảm đường huyết lúc đói và đưa glycosylated hemoglobin về giới hạn bình thường ở liều tối thiểu có tác dụng.
Khuyến cáo sử dụng thuốc trên bệnh nhân suy thận
Đánh giá chức năng thận trước khi khởi đầu điều trị với PERGLIM M và đánh giá định kỳ sau đó.
Chống chỉ định PERGLIM M trên bệnh nhân có eGFR dưới 30 mL/phút/1,73 m²
Không khuyến cáo khởi đầu điều trị với PERGLIM M ở bệnh nhân có eGFR nằm trong khoảng 30 – 45 mL/phút/1,73 m².
Ở bệnh nhân đang sử dụng PERGLIM M và có eGFR giảm xuống dưới 45 mL/phút/1,73 m², đánh giá nguy cơ – lợi ích khi tiếp tục điều trị.

Ngừng sử dụng PERGLIM M nếu bệnh nhân có eGFR giảm xuống dưới 30 mL/phút/1,73 m² [xem mục Chống chỉ định, mục thận trọng].
Ngừng sử dụng PERGLIM M khi thực hiện xét nghiệm chẩn đoán hình ảnh có sử dụng thuốc cản quang chứa iod
Trên những bệnh nhân có eGFR nằm trong khoảng từ 30 – 60 mL/phút/1,73 m², trên những bệnh nhân có tiền sử bệnh lý về gan, nghiện rượu hoặc suy tim, hoặc trên những bệnh nhân sẽ sử dụng thuốc cản quang chứa iod qua đường động mạch, ngừng PERGLIM M trước hoặc tại thời điểm thực hiện xét nghiệm chẩn đoán hình ảnh có sử dụng thuốc cản quang chứa iod. Đánh giá lại chỉ số eGFR sau khi chiếu chụp 48 giờ, sử dụng lại PERGLIM M nếu chức năng thận ổn định [xem mục thận trọng].

Chống chỉ định
- Bệnh nhân mẫn cảm với Metformin hydrochloride, Glimepiride, Sulfonylurea, các Sulfonamid khác, hay bất kỳ thành phần nào của thuốc.
- Bất kỳ thể nào của nhiễm toan chuyển hóa cấp hoặc mạn tính (như nhiễm acid lactic, nhiễm toan thể ceton do đói tháo đường).
- Tiền hôn mê đói tháo đường.
- Suy thận nặng (độ lọc cầu thận ước lượng (eGFR)<30mL/phút/1,73 m²) (xem mục Thận trọng)
- Các trường hợp cấp tính có khả năng làm biến đổi chức năng thận như: mất nước, nhiễm trùng nặng, sốt.
- Bệnh có thể gây nên tình trạng thiếu oxy mô (đặc biệt bệnh cấp tính, hoặc tình trạng nặng thêm của bệnh mạn tính) như: suy tim mất bù, suy hô hấp, nhồi máu cơ tim gần đây, sốc.
- Suy gan, nhiễm độc rượu cấp tính, nghiện rượu.
- Glimepiride không thích hợp để điều trị bệnh đói tháo đường lệ thuộc insulin (typ 1) (ví dụ điều trị bệnh nhân đói tháo đường có tiền sử nhiễm toan-keton), tình trạng nhiễm toan-keton do đói tháo đường, tiền hôn mê hoặc hôn mê do đói tháo đường. Chưa thu thập được kinh nghiệm về việc sử dụng glimepiride trên bệnh nhân suy gan nặng và bệnh nhân được thẩm phân. Trên bệnh nhân suy thận nặng hoặc suy gan nặng, nên đổi sang dùng insulin, nhất là để đạt được sự kiểm soát chuyển hóa tối ưu.

Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc
Glimepiride
Nếu có nguy cơ bị hạ huyết áp, cần điều chỉnh liều của Glimepiride hoặc điều trị tổng quát. Xử lý tương tự khi xảy ra trong quá trình điều trị hoặc khi thay đổi sinh hoạt của bệnh nhân.
Triệu chứng hạ đường huyết thường nhẹ hơn hoặc không có trường hợp hạ hạ huyết từ từ, ở người cao tuổi, bệnh nhân bị bệnh thần kinh tự động hoặc đang điều trị đồng thời với các thuốc ức chế beta (beta-blocker), clonidin, reserpin, guanethidin hay các thuốc ức chế giao cảm khác.
Hầu hết các trường hợp hạ đường huyết kiểm soát được bằng cách dùng ngay carbonhydrat (như đường, nước trái cây có đường hoặc trà có đường). Bệnh nhân phải luôn mang theo người ít nhất 20 g đường. Có thể cần sự hỗ trợ của người khác để tránh biến chứng. Chất ngọt nhân tạo không có tác dụng kiểm soát hạ đường huyết.
Phải theo dõi bệnh nhân chặt chẽ. Điều trị ngay lập tức các trường hợp hạ đường huyết nặng, cần có sự theo dõi của bác sĩ và đôi khi phải nhập viện.
Trong trường hợp bệnh nhân bị stress (như chấn thương, phẫu thuật, nhiễm trùng kèm theo sốt) khả năng kiểm soát đường huyết bị suy giảm, cần tạm thời chuyển sang dùng Insulin.
Trong suốt thời gian điều trị bằng Glimepiride, phải thường xuyên kiểm tra glucose huyết và glucose niệu. Ngoài ra, lượng glycated hemoglobin cũng nên được kiểm tra. Sự tinh táo và hoạt bát có thể bị giảm do tăng hoặc hạ đường huyết, đặc biệt khi bắt đầu, khi ngừng dùng thuốc hoặc dùng thuốc không đều. Điều này có thể ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc.
Metformin
Nhiễm toan lactic
Quá trình giám sát hậu mãi đã ghi nhận những ca nhiễm toan lactic liên quan đến metformin, bao gồm cả trường hợp tử vong, giảm thân nhiệt, tụt huyết áp, loạn nhịp chậm kéo dài. Khởi phát của tình trạng nhiễm toan acid lactic liên quan đến

metformin thường không dễ phát hiện, kèm theo các triệu chứng không điển hình như khó chịu, đau cơ, suy hô hấp, lơ mơ và đau bụng. Nhiễm toan acid lactic liên quan đến metformin được đặc trưng bằng nồng độ lactat tăng lên trong máu (>5 mmol/L), khoảng trống anion (không có bằng chứng của keto niệu hoặc keto máu), tăng tỷ lệ lactat/pyruvat và nồng độ metformin huyết tương nói chung tăng > 5µg/mL. Yếu tố nguy cơ của nhiễm toan acid lactic liên quan đến metformin bao gồm suy thận, sử dụng đồng thời với một số thuốc nhất định (ví dụ các chất ức chế carbonic anhydrase như topiramat), từ 65 tuổi trở lên, có thực hiện chiếu chụp sử dụng thuốc cản quang, phẫu thuật và thực hiện các thủ thuật khác, tình trạng giảm oxy hít vào (ví dụ suy tim sung huyết cấp), uống nhiều rượu và suy gan.
Các biện pháp giảm thiểu nguy cơ và xử trí nhiễm toan acid lactic liên quan đến metformin ở nhóm bệnh nhân có nguy cơ cao được trình bày chi tiết trong tờ hướng dẫn sử dụng thuốc (mục Liều dùng và cách dùng, Chống chỉ định, Cảnh báo và thận trọng, Tương tác thuốc và Sử dụng thuốc trên những đối tượng đặc biệt).
Nếu nghi ngờ có toan lactic liên quan đến metformin, nên ngừng sử dụng metformin, nhanh chóng đưa bệnh nhân đến bệnh viện và tiến hành các biện pháp xử trí. Ở những bệnh nhân đã điều trị với metformin, đã được chẩn đoán toan lactic hoặc nghi ngờ có khả năng cao bị toan lactic, khuyến cáo nhanh chóng lọc máu để điều chỉnh tình trạng nhiễm toan và loại bỏ phần metformin đã bị tích lũy (metformin hydroclorid có thể thẩm tách được với độ thanh thải 170 mL/phút trong điều kiện huyết động lực tốt). Lọc máu có thể làm đảo ngược triệu chứng và hồi phục.
Hướng dẫn cho bệnh nhân và người nhà về các triệu chứng của toan lactic và nếu những triệu chứng này xảy ra, cần ngừng thuốc và báo cáo những triệu chứng này cho bác sĩ.
Đối với mỗi yếu tố làm tăng nguy cơ nhiễm toan lactic liên quan đến metformin, những khuyến cáo nhằm giúp giảm thiểu nguy cơ và xử trí tình trạng toan lactic liên quan đến metformin, cụ thể như sau:
Suy thận: Những ca nhiễm toan lactic liên quan đến metformin trong quá trình giám sát thuốc hầu như xảy ra chủ yếu trên những bệnh nhân bị suy thận nặng. Nguy cơ tích lũy metformin và nhiễm toan lactic liên quan đến metformin tăng lên theo mức độ nghiêm trọng của suy thận bởi metformin được thải trừ chủ yếu qua thận. Khuyến cáo làm sáng data trên chức năng thận của bệnh nhân bao gồm [xem mục Liều dùng và cách dùng]:
– Trước khi khởi đầu điều trị với metformin cần ước tính mức độ lọc cầu thận (eGFR) của bệnh nhân.
– Chống chỉ định metformin trên bệnh nhân có eGFR dưới 30 mL/phút/1,73 m² [xem mục Chống chỉ định].
– Không khuyến cáo khởi đầu điều trị với metformin ở bệnh nhân có eGFR nằm trong khoảng 30 – 45 mL/phút/1,73 m².
– Thu thập dữ liệu về eGFR ít nhất 1 lần/năm ở tất cả các bệnh nhân sử dụng metformin. Ở bệnh nhân có khả năng tăng nguy cơ suy thận (ví dụ như người cao tuổi), chức năng thận nên được đánh giá thường xuyên hơn.
– Ở bệnh nhân đang sử dụng metformin và có eGFR giảm xuống dưới 45 mL/phút/1,73 m², đánh giá nguy cơ – lợi ích của việc tiếp tục phác đồ.
Tương tác thuốc: Sử dụng đồng thời metformin với một số thuốc có thể làm tăng nguy cơ nhiễm toan lactic liên quan đến metformin: bệnh nhân suy giảm chức năng thận dẫn tới những thay đổi đáng kể về mật độ huyết động, ảnh hưởng tới cân bằng acid-base hoặc làm tăng tích lũy metformin [xem mục Tương tác thuốc]. Vì vậy, cần nhắc theo dõi bệnh nhân thường xuyên hơn.
Bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên: Nguy cơ toan lactic liên quan đến metformin tăng lên theo tuổi của bệnh nhân bởi bệnh nhân cao tuổi có khả năng bị suy gan, suy thận, suy tim lớn hơn những bệnh nhân trẻ tuổi hơn. Cần đánh giá chức năng thận thường xuyên hơn đối với những bệnh nhân lớn tuổi.
Thực hiện các xét nghiệm chẩn đoán có sử dụng thuốc cản quang: Tiêm thuốc cản quang vào nội mạch ở những bệnh nhân đang điều trị metformin có thể dẫn tới suy giảm cấp tính chức năng thận và gây ra toan lactic. Ngừng sử dụng metformin trước hoặc tại thời điểm thực hiện chiếu chụp có sử dụng thuốc cản quang có chứa iod ở những bệnh nhân có eGFR nằm trong khoảng 30-60 mL/phút/1,73 m², những bệnh nhân có tiền sử suy gan, nghiện rượu, suy tim hoặc những bệnh nhân sẽ sử dụng thuốc cản quang chứa iod theo đường động mạch. Đánh giá lại eGFR 48h sau khi chiếu chụp và sử dụng lại metformin nếu chức năng thận ổn định.
Phẫu thuật hoặc các thủ thuật khác: Sự lưu giữ thuốc ăn và dịch trong quá trình phẫu

thuật hoặc thực hiện các thủ thuật khác có thể làm tăng nguy cơ giảm thể tích, tụt huyết áp và suy thận. Nên tạm thời ngừng sử dụng metformin khi bệnh nhân bị giới hạn lượng thức ăn và dịch nạp vào.

Tình trạng giảm oxy hít vào: Quá trình theo dõi hậu mồi đã ghi nhận một số ca nhiễm toan lactic liên quan đến metformin xảy ra trong bệnh cảnh suy tim sung huyết cấp (đặc biệt khi có kèm theo giảm tưới máu và giảm oxy huyết). Truy tìm mạch (sốc), nhồi máu cơ tim cấp, nhiễm khuẩn huyết và các bệnh lý khác liên quan đến giảm oxy huyết có mối liên quan với toan lactic và cũng có thể gây nito huyết trước thận. Khi những biến cố này xảy ra, ngừng metformin.

Uống rượu: Rượu có khả năng ảnh hưởng đến tác động của metformin lên chuyển hóa lactat và từ đó có thể làm tăng nguy cơ nhiễm toan lactic liên quan đến metformin. Cảnh báo bệnh nhân không uống rượu khi sử dụng metformin.

Suy gan: Bệnh nhân suy gan có thể tiến triển thành toan lactic liên quan đến metformin do suy giảm thải trừ lactat dẫn tới tăng nồng độ lactat trong máu. Vì vậy, tránh sử dụng metformin trên những bệnh nhân đã được chẩn đoán bệnh gan thông qua bằng chứng xét nghiệm hoặc lâm sàng.

Hạ đường huyết: Thường hạ đường huyết không xảy ra khi dùng Metformin đơn trị, nhưng có thể xảy ra khi phối hợp Metformin với sulfonylurea và/ hoặc rượu.

Thiếu acid folic, sắt và vitamin B12: Khi điều trị dài hạn, nên kiểm tra nồng độ vitamin B12 trong huyết thanh định kỳ mỗi năm trong suốt thời gian điều trị.

Các xét nghiệm cần lâm sàng: Nên kiểm tra đáp ứng trị liệu định kỳ bằng cách đo mức glucose huyết lúc đói và glycosylated hemoglobin. Trong điều trị ban đầu, cần cử vào mức glucose huyết lúc đói để xác định đáp ứng. Sau đó, cả glucose huyết và glycosylated hemoglobin đều cần thiết cho việc kiểm tra đánh giá dài hạn.

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

Phụ nữ có thai
Thông thường, chống chỉ định cho phụ nữ có thai, nên dùng insulin cho bệnh nhân tiểu đường trong thời gian mang thai.

Phụ nữ cho con bú
Các thành phần của thuốc có thể bài tiết được qua sữa mẹ. Do đó, không nên dùng cho phụ nữ đang cho con bú.

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

Thị lực, sự tỉnh táo và phản ứng trong khi lái xe hoặc vận hành máy móc có thể suy giảm khi điều trị dài tháo đường không được cân bằng đúng mức hoặc trong trường hợp bị hạ đường huyết.

Tương tác, tương kỵ của thuốc

Cimetidin: Metformin có tương tác với cimetidin. Vì vậy, nên giảm liều Metformin khi kê toa đồng thời với cimetidin.

Thuốc tăng đường huyết: Các thuốc có khả năng làm tăng đường huyết (như nhóm thiazid, corticosteroid và một số thuốc khác) có thể bù đắp vào tác động chống tăng đường huyết của Metformin, nên kiểm soát đường huyết chặt chẽ trong trường hợp này.

Rượu: rượu làm tăng tác động của Metformin trong chuyển hóa lactat cũng như chống tăng đường huyết. Vì vậy không nên uống rượu khi đang điều trị bằng Metformin. Chống chỉ định trong trường hợp nghiện rượu.

Các tương tác khác: Các nghiên cứu cho thấy furosemid và nifedipin làm tăng nồng độ Metformin trong huyết tương. Tuy nhiên tình trạng này không xảy ra với propranolol và ibuprofen. Acarbose và chất gôm có thể làm giảm hấp thu Metformin.

Hạ đường huyết có thể xảy ra khi dùng Glimepiride với một trong những thuốc sau đây: insulin và thuốc hạ tiểu đường dạng uống, chất ức chế men chuyển, allopurinol, các steroid đồng hóa và nội tiết tố sinh dục nam, chloramphenicol, dẫn xuất của coumarin, cyclophosphamid, disopyramid, fenfluramin, febyramidol, các fibrat, fluoxetin, guanethidin, ifosamid, chất ức chế MAO, miconazol, acid para aminosali cylic, penfoxyfyllin (liều cao dạng tiêm), phenylbutazon, azapropazon, oxyphenbuta zon, probenecid, quinolon, salicylat, sulfipnyrazon, sulfonamid, tetracyclin, tritoqualin, trofoslamid.

Tăng đường huyết có thể xảy ra khi dùng Glimepiride với một trong những thuốc sau đây: acetazolamid, barbiturats, corticosteroids, diazoxid, thuốc lợi tiểu, epinephrin (adrenalin) và các thuốc kích thích thần kinh giao cảm khác, glucagons, thuốc nhuận trường (sau khi điều trị dài hạn), acid nicotinic (liều cao), oestrogen và progesteron,

phenothiazin, phenytoin, rifampicin, nội tiết tố tuyến giáp.

Các thuốc đối kháng thụ thể H2, clonidin và reserpin có thể làm tăng hay giảm tác dụng hạ đường huyết của Glimepiride. Các beta-blocker có thể làm tăng tác dụng hạ đường huyết.

Tác dụng của dẫn chất coumarin có thể tăng hoặc giảm khi dùng phối hợp.

Tác dụng không mong muốn

Hạ đường huyết: Hạ đường huyết có thể xảy ra và kéo dài do tác dụng hạ đường huyết của Glimepiride.

Mất: Có thể xảy ra rối loạn thị giác tạm thời do thay đổi đường huyết, đặc biệt trong giai đoạn đầu điều trị.

Rối loạn tiêu hóa: Đôi khi xảy ra buồn nôn, nôn, cảm giác tức hoặc đầy hơi ở vùng thượng vị, đau bụng và tiêu chảy. Trong một số trường hợp có thể tăng men gan, suy chức năng gan (như vàng da ứ mật), viêm gan có thể dẫn đến suy gan.

Huyết học: Hiếm khi xảy ra giảm tiểu cầu; một số trường hợp xảy ra giảm bạch cầu, thiếu máu tán huyết, giảm hồng cầu, giảm bạch cầu hạt và có thể làm giảm huyết cầu toàn thể (như giảm sản sinh tế bào máu).

Các tác dụng phụ khác: Có thể xảy ra các phản ứng dị ứng hoặc giả dị ứng như ngứa, nổi mề đay hay phát ban. Các triệu chứng dị ứng nhẹ như trên có thể trở nên trầm trọng đi kèm với khó thở và tụt huyết áp, đôi khi dẫn đến sốc. Do đó, phải thông báo ngay cho bác sĩ khi bị nổi mề đay.

Một số trường hợp có thể xảy ra viêm mạch máu dị ứng, da nhạy cảm với ánh sáng và giảm natri huyết.

Thông báo cho bác sỹ các tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc

Quá liều và cách xử trí

Thảm thán máu có thể có lợi trong trường hợp nghi ngờ quá liều Metformin.

Đặc tính dược lực học

Nhóm được lý: Thuốc điều trị dài tháo đường uống.

Mã ATC: A10BD02.

Glimepiride

Glimepiride là một sulfonamid dùng đường uống, có tác dụng hạ glucose huyết, thuốc nhóm sulfonylurea. Tác dụng chủ yếu của glimepiride là kích thích giải phóng insulin từ các tế bào beta đảo Langerhans của tuyến tụy.

Cơ chế tác dụng của glimepiride là liên kết với thụ thể ở màng beta, làm đóng các kênh kali phụ thuộc ATP lại. Việc đóng kênh kali sẽ gây khử cực màng, làm mở kênh calci, khiến cho ion calci tăng xâm nhập vào bên trong tế bào. Việc tăng nồng độ ion calci trong tế bào sẽ kích thích sự giải phóng insulin ra khỏi tế bào.

Ngoài ra, glimepiride cũng còn có tác dụng ngoài tụy. Glimepiride cải thiện sự nhạy cảm của các mô ngoại vi đối với insulin và làm giảm sự thu nạp insulin ở gan. Glimepiride làm tăng rất nhanh số lượng các chất chuyển chở glucose qua màng tế bào cơ và tế bào mỡ, làm tăng thu nạp glucose vào các mô cơ và mô mỡ.

Chất chuyển hóa hydroxyl của glimepiride cũng có tác dụng hạ glucose huyết nhẹ, nhưng chỉ đóng góp một phần nhỏ vào tác dụng hạ glucose huyết toàn phần. Glimepiride có hiệp đồng tác dụng với metformin hoặc với insulin.

Metformin

Metformin là một thuốc chống đái tháo đường nhóm biguanid, có cơ chế tác dụng khác với các thuốc chống đái tháo đường nhóm sulfonylurea. Không giống sulfonylurea, metformin không kích thích giải phóng insulin từ các tế bào beta tuyến tụy. Thuốc không có tác dụng hạ đường huyết ở người không bị đái tháo đường. Ở người đái tháo đường, metformin làm giảm sự tăng đường huyết nhưng không gây tai biến hạ đường huyết (trừ trường hợp nhịn đói hoặc phối hợp thuốc hiệp đồng tác dụng). Vì vậy trước đây cả biguanid và sulfonylurea đều được coi là thuốc hạ đường huyết, nhưng thực ra biguanid (thí dụ như metformin) phải được coi là thuốc chống tăng đường huyết mới thích hợp.

Metformin làm giảm nồng độ glucose trong huyết tương, khi đói và sau bữa ăn, ở người bệnh đái tháo đường typ II (không phụ thuộc insulin). Cơ chế tác dụng ngoại biên của metformin là làm tăng sử dụng glucose ở tế bào, cải thiện liên kết của insulin với thụ thể và có lẽ cả tác dụng sau thụ thể, ức chế tổng hợp glucose ở gan và giảm hấp thu glucose ở ruột. Ngoài tác dụng chống đái tháo đường, metformin phần nào có ảnh hưởng tốt trên chuyển hóa lipoprotein, thường bị rối loạn ở người bệnh đái tháo đường không phụ thuộc insulin. Trái với các sulfonylurea, thể trọng của người

được điều trị bằng metformin có xu hướng ổn định hoặc có thể hơi giảm.

Dùng metformin đơn trị liệu có thể có hiệu quả tốt đối với những người không đáp ứng hoặc chỉ đáp ứng một phần với sulfonylurea hoặc những người không còn đáp ứng với sulfonylurea. Ở những người bệnh này, nếu với metformin đơn trị liệu mà đường huyết vẫn không được khống chế theo yêu cầu thì phối hợp metformin với một sulfonylurea có thể có tác dụng hiệp đồng, vì cả hai thuốc cải thiện dung nạp glucose bằng những cơ chế khác nhau nhưng lại bổ sung cho nhau.

Đặc tính dược động học

Glimepiride

Glimepiride có sinh khả dụng rất cao. Thúc ăn không làm thay đổi đáng kể sự hấp thu của thuốc, nhưng tốc độ hấp thu có chậm hơn. Nồng độ tối đa trong huyết tương đạt được khoảng 2 giờ 30 phút sau khi uống thuốc.

Glimepiride có thể tích phân bố rất thấp (khoảng 8,8 lít) tương tự như thể tích phân bố của albumin. Glimepiride liên kết mạnh với protein huyết tương (> 99%) và có độ thanh thải thấp (xấp xỉ 48 ml/phút). Nửa đời trong huyết tương của glimepiride là 5-8 giờ, nhưng khi dùng liều cao, nửa đời sẽ dài hơn.

Dùng glimepiride được đánh dấu, thấy 58% các chất chuyển hóa thải trừ qua nước tiểu và 35% qua phân. Trong nước tiểu, không thấy glimepiride còn ở dạng chưa chuyển hóa. Glimepiride chủ yếu bị chuyển hóa ở gan. Hai dẫn chất hydroxyl và carboxy của glimepiride đều thấy trong phân và nước tiểu.

Glimepiride bài tiết được qua sữa trong nghiên cứu ở động vật, thuốc qua được hàng rào nhau thai, nhưng qua hàng rào nhau rất kém.

Metformin

Metformin hấp thu chậm và không hoàn toàn ở đường tiêu hóa. Khả dung sinh học tuyệt đối của 500 mg metformin uống lúc đói xấp xỉ 50-60%. Không có sự tỉ lệ với liều khi tăng liều, do hấp thu giảm. Thúc ăn làm giảm mức độ hấp thu và làm chậm sự hấp thu metformin. Metformin liên kết với protein huyết tương mức độ không đáng kể. Metformin phân bố nhanh chóng vào các mô và dịch. Thuốc cũng phân bố vào trong hồng cầu.

Metformin không bị chuyển hóa ở gan và không bài tiết qua mật. Bài tiết ở ống thận là đường thải trừ chủ yếu của metformin.

Sau khi uống khoảng 90% lượng thuốc hấp thu được thải trừ qua phân trong vòng 24 giờ đầu ở dạng không chuyển hóa. Nửa đời trong huyết tương là 1,5 – 4,5 giờ. Có thể có nguy cơ tích lũy trong trường hợp suy giảm chức năng thận. Độ thanh thải metformin qua thận giảm ở người bệnh suy thận và người cao tuổi.

Quy cách đóng gói

- Hộp lớn x 5 hộp nhỏ x 1 vi x 20 viên
- Hộp 5 vi x 20 viên
- Hộp 1 vi x 20 viên

Điều kiện bảo quản

Bảo quản nơi khô mát, dưới 30°C. Tránh ánh sáng và tránh ẩm

Hạn dùng

24 tháng kể từ ngày sản xuất

Tiêu chuẩn chất lượng của thuốc

TCCS

Tên, địa chỉ của cơ sở sản xuất thuốc

Inventia Healthcare Limited

F1-F1/1-F75/1, Additional Ambernath M.I.D.C., Ambernath (East), Thane 421506, Maharashtra State, Ấn Độ.



We care

Sản xuất dưới sự nhượng quyền của:
MEGA LIFESCIENCES (AUSTRALIA) PTY., LTD.
Victoria 3810, Úc