

เอกสารกำกับยาภาษาไทย

อินกลิπτิน

1. ชื่อผลิตภัณฑ์ยา

INGLIPTIN

2. ชื่อและความแรงของตัวยาสําคัญ

ใน 1 เม็ดเคลือบฟิล์ม ประกอบด้วย Sitagliptin phosphate เทียบเท่า Sitagliptin 100 มิลลิกรัม

3. ลักษณะของผลิตภัณฑ์

เม็ดรูปกลม นูนทั้งสองด้าน เคลือบฟิล์มสีส้ม ด้านหนึ่งมีตัวอักษร “S” อีกด้านหนึ่งมีตัวเลข “100”

4. เภสัชพลศาสตร์/เภสัชจลนศาสตร์

4.1 คุณสมบัติทางเภสัชพลศาสตร์¹

กลไกการออกฤทธิ์

Sitagliptin ออกฤทธิ์โดยการยับยั้งเอนไซม์ dipeptidyl peptidase IV (DPP-IV) ส่งผลให้ incretin ออกฤทธิ์ได้ยาวนานขึ้น ฮอร์โมน incretin ได้แก่ glucagon-like peptide-1 (GLP-1) และ glucose-dependent insulintropic polypeptide (GIP) ช่วยควบคุมระดับ glucose โดยการเพิ่มการสังเคราะห์อินซูลินจาก beta cell ของตับอ่อน และลดการหลั่ง glucagon ส่งผลให้ลดการสร้าง hepatic glucose โดยปกติฮอร์โมน incretin จะถูกปลดปล่อยออกมาทางลำไส้ในระหว่างวัน โดยระดับฮอร์โมนจะเพิ่มขึ้นสัมพันธ์กับมื้ออาหาร ซึ่งฮอร์โมน incretin ที่หลั่งออกมาจะถูกทำลายอย่างรวดเร็วด้วยเอนไซม์ DPP-IV

4.2 คุณสมบัติทางเภสัชจลนศาสตร์^{1,2}

การดูดซึม: หลังรับประทานยาเม็ดจะถูกดูดซึมอย่างรวดเร็ว

การกระจายยา: ~198 ลิตร

การจับกับโปรตีน: 38%

เมตาบอลิซึม: CYP3A4 และ 2C8

ค่าชีวประสิทธิผล: ~87%

ค่าครึ่งชีวิตของการกำจัดยา: 12.4 ชั่วโมง

ระดับยาสูงสุด: 1-4 ชั่วโมง

การกำจัดยา: ทางปัสสาวะ 87% (~79% ในรูปไม่เปลี่ยนแปลง, 16% ในรูปเมทาบอลิท์); ทางอุจจาระ 13%

5. ข้อบ่งใช้^{1,2,5}

การรักษาโดยใช้เป็นยาเดี่ยว

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้คือเป็นยาที่ใช้เสริมกับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายเพื่อให้ความคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้นในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2

การใช้ร่วมกับยาเมทฟอร์มิน

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2 เพื่อให้ความคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้น โดยการใช้ร่วมกับยาเมทฟอร์มินตั้งแต่เริ่มการรักษา หรือเมื่อใช้เป็นยาเดี่ยวควบคู่กับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายไม่สามารถควบคุมระดับน้ำตาลได้อย่างเพียงพอ

การใช้ร่วมกับยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยเบาหวานชนิดที่ 2 เพื่อให้ความคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้น ในการใช้ร่วมกับยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย เมื่อการรักษาด้วยยานี้เพียงตัวเดียวควบคู่กับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายไม่สามารถควบคุมระดับน้ำตาลได้อย่างเพียงพอ

การใช้ร่วมกับยากลุ่ม PPAR γ agonist

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2 เพื่อให้ควบคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้น ในการใช้ร่วมกับยากลุ่ม PPAR γ agonist (เช่น thiazolidinediones) ตั้งแต่เริ่มการรักษา หรือเมื่อใช้ยานี้เพียงตัวเดียว ควบคู่กับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายไม่สามารถควบคุมระดับน้ำตาลได้อย่างเพียงพอ

การใช้ร่วมกับยาเมทฟอร์มินและยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2 เพื่อให้ควบคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้น โดยการให้ร่วมกับยาเมทฟอร์มินและยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย เมื่อการรักษาด้วยยา 2 ชนิดนี้ควบคู่กับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายไม่สามารถควบคุมระดับน้ำตาลได้อย่างเพียงพอ

การใช้ร่วมกับยาเมทฟอร์มินและยากลุ่ม PPAR γ agonist

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2 เพื่อให้ควบคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้น โดยการให้ร่วมกับยาเมทฟอร์มินและยากลุ่ม PPAR γ agonist (เช่น thiazolidinediones) เมื่อการรักษาด้วยยา 2 ชนิดนี้ ควบคู่กับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายไม่สามารถควบคุมระดับน้ำตาลได้อย่างเพียงพอ

การใช้ร่วมกับอินซูลิน

INGLIPTIN มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 2 คือเป็นยาที่ใช้เสริมกับการควบคุมอาหารและการออกกำลังกายเพื่อให้ควบคุมระดับน้ำตาลในเลือดได้ดีขึ้นโดยให้ร่วมกับอินซูลิน (ใช้ร่วมหรือไม่ร่วมกับยาเมทฟอร์มิน)

6. ขนาดยาที่แนะนำ^{1,2,3,5}

ขนาดยาที่แนะนำของ INGLIPTIN คือ 100 มก. วันละครั้ง เป็นการรักษาโดยใช้ยานี้เพียงตัวเดียว หรือเป็นการรักษาโดยการให้ร่วมกับเมทฟอร์มิน ยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย อินซูลิน (ใช้ร่วมหรือไม่ใช้ร่วมกับยาเมทฟอร์มิน) ยากลุ่ม PPAR γ agonist (เช่น thiazolidinediones) ยาเมทฟอร์มินและยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย หรือยาเมทฟอร์มินและยากลุ่ม PPAR γ agonist INGLIPTIN สามารถให้ร่วมหรือไม่ร่วมกับอาหารก็ได้

เมื่อใช้ INGLIPTIN ร่วมกับยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรียหรือร่วมกับอินซูลิน อาจพิจารณาลดขนาดยาของยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรียหรืออินซูลิน เพื่อลดความเสี่ยงของการเกิดภาวะน้ำตาลในเลือดต่ำที่ถูกเหนี่ยวนำโดยยากลุ่มซัลโฟนิลยูเรีย หรืออินซูลิน

ผู้ป่วยไตเสื่อม

สำหรับผู้ป่วยที่ไตเสื่อมเล็กน้อย (ค่า creatinine clearance [CrCl] \geq 50 มล./ นาที เทียบเท่ากับระดับ creatinine ในซีรัมประมาณ \leq 1.7 มก./ ดล. ในเพศชาย และ \leq 1.5 มก./ ดล. ในเพศหญิง) ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยา INGLIPTIN

สำหรับผู้ป่วยที่ไตเสื่อมระดับปานกลาง (CrCl \geq 30 ถึง $<$ 50 มล./ นาที เทียบเท่ากับระดับ creatinine ในซีรัมประมาณ $>$ 1.7 ถึง \leq 3.0 มก./ ดล. ในเพศชาย และ $>$ 1.5 ถึง \leq 2.5 มก./ ดล. ในเพศหญิง) ขนาดยาของ INGLIPTIN คือ 50 มก. วันละครั้ง

สำหรับผู้ป่วยที่ไตเสื่อมระดับรุนแรง (CrCl $<$ 30 มล./ นาที เทียบเท่ากับระดับ creatinine ในซีรัมประมาณ $>$ 3.0 มก./ ดล. ในเพศชาย และ $>$ 2.5 มก./ ดล. ในเพศหญิง) หรือเป็นโรคไตวายระยะสุดท้าย (ESRD) ที่ต้องได้รับการล้างไตด้วยการฟอกเลือดด้วยไตเทียม หรือการล้างไตทางช่องท้อง ขนาดยาของ INGLIPTIN คือ 25 มก. วันละครั้ง อาจให้ยา INGLIPTIN โดยไม่ต้องคำนึงถึงเวลาของการล้างไต เนื่องจากมีการปรับขนาดยาตามการทำงานของไต จึงแนะนำให้มีการประเมินการทำงานของไตก่อนเริ่มการรักษาด้วย INGLIPTIN และทำเป็นระยะๆ หลังจากนั้น

การใช้ในเด็ก

ยังไม่มีการศึกษาด้านความปลอดภัยและประสิทธิผลของยา Sitagliptin ในผู้ป่วยเด็กที่อายุต่ำกว่า 18 ปี

การใช้ในผู้สูงอายุ

ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยาจากปัจจัยด้านอายุ ผู้ป่วยสูงอายุมีแนวโน้มที่การทำงานของไตลดลงตามอายุ จึงควรใช้ด้วยความระมัดระวัง และอาจมีความจำเป็นต้องปรับขนาดยา หากมีภาวะไตเสื่อมอย่างมีนัยสำคัญ

7. วิธีการใช้ยา^{1,3}

Sitagliptin เป็นยาชนิดรับประทานวันละครั้ง สามารถให้ร่วมหรือไม่ร่วมกับอาหารก็ได้

8. ข้อห้ามใช้^{1,3}

ห้ามใช้ยานี้ในผู้ที่เกิดภูมิแพ้รุนแรง เช่น anaphylaxis, หลอดเลือดบวม น้ำ จากการได้รับ Sitagliptin หรือส่วนประกอบอื่นใดในตำรับ

9. คำเตือนและข้อควรระวัง^{2,4}

- 1) มีรายงานของการเกิดตับอ่อนอักเสบเฉียบพลัน รวมถึงตับอ่อนอักเสบที่มีเลือดออกหรือเนื้อตับอ่อนตาย ควรมีการเฝ้าระวังในผู้ป่วยที่ได้รับ Sitagliptin และหยุดยาหากเกิดอาการของตับอ่อนอักเสบเฉียบพลันขึ้น
- 2) อาจทำให้เกิดภาวะหัวใจล้มเหลว ควรติดตามอาการและพิจารณาหยุดยา
- 3) Sitagliptin ไม่มีข้อบ่งใช้ในผู้ป่วยโรคเบาหวานชนิดที่ 1
- 4) Sitagliptin ไม่มีข้อบ่งใช้สำหรับรักษาภาวะเลือดเป็นกรดเนื่องจากโรคเบาหวาน (diabetes ketoacidosis)
- 5) พบรายงานอาการปวดข้อรุนแรงในผู้ป่วยที่ได้รับยาในกลุ่มยับยั้งการทำงานของ DPP-IV โดยสามารถพบได้ตั้งแต่ภายใน 1 วัน ถึงหลายปีหลังจากเริ่มใช้ยา พบว่าอาการดีขึ้นหลังจากหยุดใช้ยา และพบการเกิดอาการซ้ำเมื่อกลับไปใช้ยาซ้ำ
- 6) พบรายงานอาการแพ้ที่รุนแรง เช่น หลอดเลือดบวม น้ำ, anaphylaxis และ Stevens-Johnson syndrome ภายใน 3 เดือนแรกของการใช้ยา
- 7) ควรมีการปรับขนาดยาในผู้ป่วยไตเสื่อมระดับปานกลาง ไตเสื่อมระดับรุนแรง และไตวายระยะสุดท้าย (ESRD) ที่ต้องได้รับการล้างไตด้วยไตเทียมหรือการล้างไตทางช่องท้อง และพบรายงานการทำงานของไตแย่งลงหรือเกิดไตวายเฉียบพลันที่ต้องได้รับการล้างไตในผู้ป่วยที่ได้รับ Sitagliptin
- 8) มีรายงานการเกิดโรคตุ่มน้ำพองจากภูมิคุ้มกันในผู้ป่วยที่ได้รับยาในกลุ่มยับยั้งการทำงานของ DPP-IV หากเกิดตุ่มน้ำพองหรือรอยแผลขึ้น ให้หยุดใช้ยาและทำการรักษาต่อไป

คำเตือนตามประกาศกระทรวงสาธารณสุข⁶

1. ห้ามใช้ในผู้ที่เคยแพ้ยานี้
2. ห้ามใช้รักษาโรคเบาหวานชนิดที่ 1 ผู้ป่วยภาวะ ketoacidosis ผู้ป่วยภาวะติดเชื้อรุนแรง ผู้ป่วยได้รับอุบัติเหตุรุนแรง
3. สตรีมีครรภ์ควรหลีกเลี่ยงการใช้ยานี้ และสตรีให้นมบุตรระมัดระวังในการใช้ยานี้
4. ไม่ควรใช้ยานี้ร่วมกับเครื่องดื่มที่มีแอลกอฮอล์
5. ยานี้อาจเพิ่มความเสี่ยงในการเจ็บข้ออย่างรุนแรง (severe joint pain)

10. อันตรกิริยากับยาอื่น ๆ¹

Sitagliptin จะมีผลเพิ่มฤทธิ์ของ Angiotensin-Converting Enzyme Inhibitors, Digoxin, Hypoglycemia-Associated Agents, Insulins, Sulfonylureas

Sitagliptin จะมีฤทธิ์เพิ่มขึ้นเมื่อให้ร่วมกับ Alpha-Lipoic Acid, Androgens, Guanethidine, Lumacaftor, Monoamine Oxidase Inhibitors, Pegvisomant, P-glycoprotein/ABCB1 Inhibitors, Prothioamide, Quinolones, Ranolazine, Salicylates, Selective Serotonin Reuptake Inhibitors

Sitagliptin จะมีฤทธิ์ลดลงเมื่อให้ร่วมกับ Hyperglycemia-Associated Agents, Lumacaftor, P-glycoprotein/ABCB1 inducers, Quinolones, Thiazide and Thiazide-Like Diuretics

11. สตรีมีครรภ์และสตรีระหว่างให้นมบุตร^{3,5}

สตรีมีครรภ์

จัดเป็น Pregnancy category B

ยังไม่มีการศึกษาที่เพียงพอและมีการควบคุมที่ดีในสตรีมีครรภ์ ดังนั้นความปลอดภัยของ Sitagliptin ในสตรีมีครรภ์ยังไม่เป็นที่ทราบ เช่นเดียวกับยาโรคเบาหวานชนิดรับประทานตัวอื่นๆ คือไม่แนะนำให้ใช้ในระหว่างการตั้งครรภ์

สตรีให้นมบุตร

Sitagliptin ถูกขับออกมาในน้ำนมของหนูแรท ยังไม่เป็นที่ทราบว่า Sitagliptin ถูกขับถ่ายออกมาในน้ำนมของมนุษย์หรือไม่ ดังนั้นไม่ควรใช้ยาในสตรีที่ให้นมบุตร

12. อาการอันไม่พึงประสงค์¹

ระบบต่อมไร้ท่อและเมตาบอลิก: น้ำตาลในเลือดต่ำ

ระบบทางเดินอาหาร: ท้องเสีย, คลื่นไส้

ไต: เพิ่มระดับ serum creatinine

ระบบทางเดินหายใจ: ช่องจมูกและคอหอยอักเสบ

พบน้อย แต่เป็นอันตรายถึงชีวิต: ตับอ่อนอักเสบเฉียบพลัน (ทั้งตับอ่อนอักเสบที่มีเลือดออกและเนื้อตับอ่อนตาย), ภาวะไตวายเฉียบพลัน (อาจต้องใช้การล้างไตร่วมด้วย), anaphylaxis, หลอดเลือดบวมน้ำ, อาการปวดข้อ, ปวดหลัง, โรคตุ่มน้ำพองจากภูมิคุ้มกัน, ท้องผูก, ผื่นแพ้, ปวดหัว, ภาวะภูมิไวเกิน, หลอดเลือดอักเสบ, เอนไซม์ตับเพิ่มขึ้น, ปวดแขนขา, ปวดกล้ามเนื้อ, เกิดแผลในช่องปาก, ปวด, โรคเพมฟิกอยด์, คัน, การทำงานของไตบกพร่อง, อาการปวดข้อรุนแรง, ผื่นผิวหนัง, Stevens-Johnson syndrome, เยื่อในช่องปากอักเสบ, ผื่นลมพิษ, อาเจียน

13. การได้รับยาเกินขนาดและวิธีการรักษา⁵

กรณีที่ได้รับยาเกินขนาด ควรใช้วิธีการรักษาประคับประคองอาการต่างๆ ไป เช่น กำจัดยาที่ยังไม่ดูดซึมออกจากทางเดินอาหาร เผื่อระวังอาการทางคลินิก (รวมถึงการตรวจคลื่นไฟฟ้าหัวใจ) และให้การรักษาตามอาการที่จำเป็น

14. สถานะการเก็บรักษา⁷

เก็บที่อุณหภูมิต่ำกว่า 30 °C

15. รูปแบบยาและขนาดบรรจุที่มีจำหน่าย

Dosage Forms: ยาเม็ดเคลือบฟิล์ม

Packaging Available: บรรจุแผง PVDC/Aluminium blister แผงละ 10 เม็ด บรรจุในกล่องกระดาษ กล่องละ 1, 2, 3, 10 หรือ 50 แผง

16. ชื่อและที่อยู่ผู้ผลิต



บริษัท ชุมชนเภสัชกรรม จำกัด (มหาชน)

1 ซอยคูบอน 11 แขวงรามอินทรา เขตคันนายาว กรุงเทพฯ 10230 ประเทศไทย

โทรศัพท์ 0-2943-0935-7 แฟกซ์ 0-2510-7874

17. วันที่มีการแก้ไขปรับปรุงเอกสาร

24 กรกฎาคม 2566

เอกสารกำกับยาภาษาอังกฤษ

INGLIPTIN

1. Product Name

INGLIPTIN

2. Name and strength of active ingredient

Each film-coated tablet contains: Sitagliptin phosphate eq. to Sitagliptin 100 mg

3. Product description

Orange round, biconvex film coated tablet. One side has letter “S”. Another side has letter “100”.

4. Pharmacodynamic/Pharmacokinetics

4.1 Pharmacodynamic¹

Mechanism of action

Sitagliptin inhibits dipeptidyl peptidase IV (DPP-IV) enzyme resulting in prolonged active incretin levels. Incretin hormones (eg. glucagon-like peptide-1 (GLP-1) and glucose-dependent insulinotropic polypeptide (GIP)) regulate glucose homeostasis by increasing insulin synthesis and release from pancreatic beta cells and decreasing glucagon secretion results in decreased hepatic glucose production. Under normal physiologic circumstances, incretin hormones are released by the intestine throughout the day and levels are increased in response to a meal; incretin hormones are rapidly inactivated by the DPP-IV enzyme.

4.2 Pharmacokinetics^{1,2}

Absorption: Rapid

Distribution: ~198L

Protein-binding: 38%

Metabolism: CYP3A4 and 2C8

Bioavailability: ~87%

Half-life elimination: 12.4 hours

Time to peak: 1-4 hours

Excretion: Urine 87% (~79% as unchanged drug, 16% as metabolites); feces 13%

5. Indication^{1,2,5}

Monotherapy

INGLIPTIN is indicated as an adjunct to diet and exercise to improve glycemic control in patients with type 2 diabetes mellitus.

Combination with Metformin

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus to improve glycemic control in combination with metformin as initial therapy or when the single agent alone, with diet and exercise, does not provide adequate glycemic control.

Combination with a Sulfonylurea

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus to improve glycemic control in combination with a sulfonylurea when treatment with the single agent alone, with diet and exercise, does not provide adequate glycemic control.

Combination with a PPAR γ agonist

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus to improve glycemic control in combination with a PPAR γ agonist (i.e., thiazolidinediones) as initial therapy or when the single agent alone, with diet and exercise, does not provide adequate glycemic control.

Combination with Metformin and a Sulfonylurea

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus to improve glycemic control in combination with metformin and a sulfonylurea when dual therapy with these agents, with diet and exercise, does not provide adequate glycemic control.

Combination with Metformin and a PPAR γ agonist

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus to improve glycemic control in combination with metformin and a PPAR γ agonist (i.e., thiazolidinediones) when dual therapy with these agents, with diet and exercise, does not provide adequate glycemic control.

Combination with Insulin

INGLIPTIN is indicated in patients with type 2 diabetes mellitus as an adjunct to diet and exercise to improve glycemic control in combination with insulin (with or without metformin).

6. Recommended Dose^{1,2,3,5}

The recommended dose of INGLIPTIN is 100 mg once daily as monotherapy or as combination therapy with metformin, a sulfonylurea, insulin (with or without metformin), a PPAR γ agonist (i.e., thiazolidinediones), metformin plus a sulfonylurea, or metformin plus a PPAR γ agonist. INGLIPTIN can be taken with or without food.

When INGLIPTIN is used in combination with a sulfonylurea or with insulin, a lower dose of sulfonylurea or insulin may be considered to reduce the risk of sulfonylurea or insulin-induced hypoglycemia.

Patients with Renal Insufficiency

For patients with mild renal insufficiency (creatinine clearance [CrCl] \geq 50 mL/ min, approximately corresponding to serum creatinine levels of \leq 1.7 mg/dL in men and \leq 1.5 mg/dL in women), no dosage adjustment for INGLIPTIN is required.

For patients with moderate renal insufficiency (CrCl \geq 30 to $<$ 50 mL/ min, approximately corresponding to serum creatinine levels of $>$ 1.7 to \leq 3.0 mg/dL in men and $>$ 1.5 to \leq 2.5 mg/dL in women), the dose of INGLIPTIN is 50 mg once daily.

For patients with severe renal insufficiency (CrCl $<$ 30 mL/ min, approximately corresponding to serum creatinine levels of $>$ 3.0 mg/dL in men and $>$ 2.5 mg/dL in women) or with end-stage renal disease (ESRD) requiring hemodialysis or peritoneal dialysis, the dose of INGLIPTIN is 25 mg once daily. INGLIPTIN may be administered without regard to the timing of dialysis

Because there is a dosage adjustment based upon renal function, assessment of renal function is recommended prior to initiation of INGLIPTIN and periodically thereafter.

Pediatric use

Safety and effectiveness of Sitagliptin in pediatric patients under 18 years have not been established.

Use in the elderly

No dosage adjustment is required based on age. Because elderly patients are more likely to have decreased renal function, care should be taken in dose selection in the elderly, and dosage adjustment may be required in the presence of significant renal insufficiency.

7. Mode of Administration^{1,3}

Sitagliptin should be administered orally once daily with or without food.

8. Contraindication^{1,3}

INGLIPTIN is contraindicated in patients with known serious hypersensitivity (eg. anaphylaxis, angioedema) to Sitagliptin or to any ingredient in the formulation.

9. Warning and Precaution^{2,4}

- 1) Acute pancreatitis, including fatal and nonfatal hemorrhagic and necrotizing pancreatitis, has been reported in patients taking Sitagliptin; monitoring recommended and discontinue therapy if signs or symptoms develop.
- 2) Heart failure may occur; monitoring recommended and consider discontinuation.
- 3) Sitagliptin is not indicated for use in patients with type 1 diabetes mellitus.
- 4) Sitagliptin is not indicated for the treatment of diabetes ketoacidosis.
- 5) Severe and disabling arthralgia has been reported with DPP-IV inhibitor use; onset may occur within 1 day to years after treatment initiation and may resolve with discontinuation of therapy. Some patients may experience a recurrence of symptoms if DPP-IV inhibitor therapy resumed.
- 6) Serious hypersensitivity and allergic reactions such as angioedema, anaphylaxis and Stevens-Johnson syndrome have been reported, particularly within first 3 months of treatment.
- 7) Sitagliptin requires a dosage adjustment in patients with moderate or severe renal insufficiency and in patients with ESRD requiring hemodialysis or peritoneal dialysis. There have been reports of worsening renal function and acute renal failure requiring dialysis in patients treated with Sitagliptin.
- 8) Bullous pemphigoid has been reported with dipeptidyl peptidase-4 inhibitors; if blisters or erosions develop during treatment and bullous pemphigoid is suspected, discontinue treatment and medically manage.

10. Interactions with Other Medication¹

Sitagliptin may increase the levels/effects of Angiotensin-Converting Enzyme Inhibitors, Digoxin, Hypoglycemia-Associated Agents, Insulins, Sulfonylureas.

The levels/effects of Sitagliptin may be increased by Alpha-Lipoic Acid, Androgens, Guanethidine, Lumacaftor, Monoamine Oxidase Inhibitors, Pegvisomant, P-glycoprotein/ABCB1 Inhibitors, Prothioamide, Quinolones, Ranolazine, Salicylates, Selective Serotonin Reuptake Inhibitors.

The levels/effects of Sitagliptin may be decreased by Hyperglycemia-Associated Agents, Lumacaftor, P-glycoprotein/ABCB1 inducers, Quinolones, Thiazide and Thiazide-Like Diuretics.

11. Pregnancy and Lactation^{3,5}

Pregnancy

Pregnancy category B

There are no adequate and well-controlled studies in pregnant women; therefore, the safety of Sitagliptin in pregnant women is not known. Sitagliptin, like other oral antihyperglycemic agents, is not recommended for use in pregnancy.

Lactation

Sitagliptin is secreted in the milk of lactating rats. It is not known whether Sitagliptin is secreted in human milk. Therefore, Sitagliptin should not be used by a woman who is nursing.

12. Undesirable Effects¹

Endocrine & metabolic: hypoglycemia

Gastrointestinal: diarrhea, nausea

Renal: increased serum creatinine

Respiratory: nasopharyngitis

Rare but important or life-threatening: acute pancreatitis (including hemorrhagic or necrotizing forms), acute renal failure (possibly requiring dialysis), anaphylaxis, angioedema, arthralgia, back pain, bullous pemphigoid, constipation, exfoliative dermatitis, headache, hypersensitivity, hypersensitivity vasculitis, increased liver enzymes, limb pain, myalgia, oral mucosa ulcer, pain, pemphigoid, pruritus, renal insufficiency, severe arthralgia, skin rash (including macular), Stevens-Johnson syndrome, stomatitis, urticaria, vomiting.

13. Overdose and Treatment⁵

In the event of an overdose, it is reasonable to employ the usual supportive, eg. remove unabsorbed material from the gastrointestinal tract, employ clinical monitoring (including obtaining an electrocardiogram), and institute supportive therapy if required.

14. Storage Condition⁷

Store at a temperature below 30 °C

15. Dosage Forms and Packaging Available

Dosage Forms: Film-coated tablet

Packaging Available: 10 tablets in PVDC/ Aluminium blister pack which packed in carton box of 1, 2, 3, 10 or 50 blisters.

16. Name and Address of Manufacturing



COMMUNITY PHARMACY PUBLIC COMPANY LIMITED

1 Soi Khubon 11, Ramintra, Kannayao, Bangkok 10230, Thailand

Tel. 0-2943-0935-7 Fax. 0-2510-7874

17. Date of revision of package insert

24 July 2023