

Rx Thuốc kê đơn

DUMAX
Dapoxetine
Viên nén bao phim

MÔ TẢ

Dumax 30 mg

Mỗi viên nén bao phim chứa Dapoxetine hydrochloride tương đương với 30mg Dapoxetine

Dumax 60 mg

Mỗi viên nén bao phim chứa Dapoxetine hydrochloride tương đương với 60mg Dapoxetine

Tá dược

Tá dược viên: Lactose; Microcrystalline cellulose (101); Croscarmellose sodium

Colloidal anhydrous silica; Magnesium stearate; Quinoline Yellow LK; Erythrosine HS LK;

Tá dược bao: Hypromellose 5 cps; Titanium dioxide; Purified Talc; Propylene Glycol; Quinoline Yellow LK; Erythrosine HS LK

Dạng bào chế

Viên nén bao phim

Viên nén bao phim màu vàng sáng có hình tam giác, hai mặt lõm.

CHỈ ĐỊNH

Dumax được chỉ định trong điều trị xuất tinh sớm (PE) ở nam giới trưởng thành, từ 18 đến 64 tuổi.

Dumax được chỉ định trong các trường hợp sau:

- Xuất tinh khi ở trong âm đạo chưa được 2 phút (IELT); và
- Xuất tinh thường xuyên hoặc đột xuất khi gặp kích thích tình dục trước kia, hiện tại, hoặc ngay sau khi xâm nhập vào âm đạo và sớm hơn mong muốn của bệnh nhân; và
- Có dấu hiệu của xuất tinh khó hoặc xuất tinh khó là hậu quả của PE; và
- Khó khăn trong kiểm soát xuất tinh; và
- Có tiền sử xuất tinh sớm trong phần lớn các lần giao hợp trong vòng 6 tháng trước.

Dumax chỉ nên dùng trước khi sinh hoạt tình dục.

Dumax không nên dùng để trì hoãn xuất tinh với các trường hợp không phải PE.

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG

Liều dùng

Nam giới trưởng thành (từ 18 đến 64 tuổi)

Liều khởi đầu khuyến cáo cho tất cả các bệnh nhân là 30mg, uống nếu cần trước khi sinh hoạt tình dục 1-3 giờ. Không nên bắt đầu điều trị với liều 60mg.

Không dùng Dumax liên tục hàng ngày. Chỉ uống Dumax khi sinh hoạt tình dục. Không nên dùng Dumax nhiều hơn 1 lần cho mỗi 24 giờ.

Nếu đáp ứng của cá thể với 30mg là không đủ và bệnh nhân không có tiền sử gặp các phản ứng bất lợi từ nhẹ đến trầm trọng hoặc có các biểu hiện báo trước về tình trạng ngất thì có thể tăng liều lên gấp đôi là 60mg nếu cần, uống trước khi sinh hoạt tình dục 1-3 giờ. Tỷ lệ và mức độ nghiêm trọng của các tác dụng bất lợi là cao hơn với liều 60mg.

Nếu bệnh nhân đã từng bị hạ huyết áp thể đứng khi dùng liều khởi đầu thì không nên tăng liều lên 60mg.

Bác sĩ cần xem xét, đánh giá cân trọng giữa nguy cơ và lợi ích của bệnh nhân sau 4 tuần điều trị với Dumax để quyết định tiếp tục điều trị với Dumax. Và việc đánh giá này cần được thực hiện hàng tháng khi điều trị với thuốc.

Người cao tuổi (từ 65 tuổi trở lên)

An toàn và hiệu quả của Dumax chưa được xác định với các bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên.

Trẻ em

Không dùng Dumax cho đối tượng này.

Bệnh nhân suy thận

Cần thận trọng khi dùng cho các bệnh nhân suy thận nhẹ hoặc trung bình. Dumax không được khuyến cáo cho các bệnh nhân suy thận nặng.

Bệnh nhân suy gan

Chống chỉ định dùng Dumax ở các bệnh nhân suy gan trung bình và nặng (Child–Pugh Class B and C).

Thuốc sẽ chuyển hóa kém khi dùng đồng thời với các thuốc ức chế mạnh CYP2D6. Cần thận trọng khi tăng liều lên đến 60mg ở những bệnh nhân đã được biết là có gen chuyển hóa kém quá CYP2D6 hoặc ở các bệnh nhân đang điều trị với các thuốc ức chế CYP2D6. Chống chỉ định dùng Dumax đồng thời với các thuốc ức chế vừa hoặc mạnh CYP3A4. Nên giới hạn liều ở 30mg và thận trọng với các trường hợp dùng đồng thời với các thuốc ức chế vừa phải lên CYP3A4

Cách dùng

Dùng đường uống

Nuốt cả viên thuốc để tránh vị đắng. Khuyến cáo nên uống thuốc với 1 ly nước đầy. Dumax có thể được dùng cùng hoặc không cùng thức ăn. Thực hiện các biện pháp phòng ngừa trước khi xử lý hoặc sử dụng thuốc; trước khi điều trị.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn cảm với dược chất hoặc bất kỳ tá dược nào của Dumax.

Trong các trường hợp bệnh lý sau:

- Suy tim (NYHA II-IV)
- Bất thường dẫn truyền như chặn AV hoặc hội chứng nút xoang.
- Dấu hiệu bệnh tim thiếu máu cục bộ.
- Bệnh van tim
- Tiền sử bị ngất
- Tiền sử hưng hoặc trầm cảm nặng.

Chống chỉ định dùng đồng thời với các thuốc ức chế monoamine oxidase (MAOIs), hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với MAOI. Tương tự vậy không nên dùng 1 thuốc thuộc nhóm MAOI trong vòng 7 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với Dumax.

Chống chỉ định dùng đồng thời với các Thioridazine, hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với thioridazine. Tương tự vậy, không nên dùng thioridazine trong vòng 7 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với Dumax.

Không dùng đồng thời với các thuốc ức chế tái hấp thu serotonin [ức chế chọn lọc serotonin (SSRI), thuốc ức chế tái hấp thu serotonin-norepinephrine (SNRIs), thuốc chống trầm cảm ba vòng (TCAs)] hoặc các sản phẩm thảo dược/ thuốc khác có tác dụng serotonin [ví dụ, L-tryptophan, triptans, tramadol, linezolid, lithium, St. John Wort (Hypericum perforatum)] hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với các sản phẩm thuốc/ thảo dược. Tương tự như vậy, các sản phẩm thuốc/ thảo dược không nên dùng trong vòng 7 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với Dumax.

Không dùng đồng thời với các thuốc ức chế mạnh CYP3A4 như ketoconazol, itraconazol, ritonavir, isaquinavir, telithromycin, nefazadone, nelfinavir, atazanavir, vv.

THẬN TRỌNG VÀ CẢNH BÁO ĐẶC BIỆT

Các khuyến nghị chung

Dumax được chỉ định cho nam giới bị xuất tinh sớm có các tiêu chí được kể ra trong mục CHỈ ĐỊNH. Không nên dùng Dumax cho nam giới không được chẩn đoán là bị xuất tinh sớm. Chưa xác định được an toàn và chưa có dữ liệu về tác dụng trị hoãn xuất tinh ở nam giới không bị xuất tinh sớm (PE).

Các hình thức khác của rối loạn chức năng tình dục

Trước khi điều trị, các đối tượng có các hình thức rối loạn chức năng tình dục khác, trong đó có rối loạn chức năng cương dương, cần được bác sĩ kiểm tra một cách cẩn trọng. Không dùng Dumax ở những người bị rối loạn chức năng cương dương (ED), người đang sử dụng thuốc ức chế PDE5.

Hạ huyết áp thể đứng

Trước khi bắt đầu điều trị, bác sĩ cần thực hiện kiểm tra y tế trong đó có tiền sử bệnh về huyết áp thể đứng. Thực hiện bài kiểm tra về tư thế trước khi điều trị (huyết áp và nhịp tim, nằm ngửa và đứng). Trong trường hợp có tiền sử hoặc bị nghi ngờ về phản ứng thể đứng, tránh điều trị với Dumax.

Đã ghi nhận được có trường hợp hạ huyết áp thể đứng trong các thử nghiệm lâm sàng. Bác sĩ kê đơn cần tư vấn cho bệnh nhân nếu trước đó bệnh nhân có các triệu chứng báo trước, ví dụ như lâng lâng ngay sau khi đứng, ngay lập tức nên nằm xuống để đầu thấp hơn so với phần còn lại của cơ thể hoặc ngồi xuống và cúi đầu xuống 2 gối cho đến khi triệu chứng qua đi. Bác sĩ cũng nên thông báo với bệnh nhân không đứng lên quá nhanh sau khi ngồi hoặc nằm lâu.

Tự tử / có ý định tự tử.

Thuốc chống trầm cảm, bao gồm cả các SSRI, làm tăng nguy cơ có ý định tự tử và tự tử trên bệnh nhân so với giả dược trong các nghiên cứu ngắn hạn ở trẻ em và thanh thiếu niên bị trầm cảm và các rối loạn tâm thần khác. Các nghiên cứu ngắn hạn không cho thấy sự gia tăng nguy cơ tự tử ở người lớn

trên 24 tuổi dùng thuốc chống trầm cảm. Trong các thử nghiệm lâm sàng với Dumax để điều trị xuất tinh sớm, không có dấu hiệu rõ ràng về hành vi tự tử ở các đánh giá về tác dụng không mong muốn liên quan đến tự tử ở nhóm Columbia.

Đánh giá về tự vẫn (C-CASA), Montgomery-Asberg Depression Rating Scale, hoặc Beck Depression Inventory-II.

Bất tỉnh

Bệnh nhân cần được cảnh báo để tránh xảy ra tình trạng này, bao gồm cả lái xe và vận hành máy móc nguy hiểm, bất tỉnh hoặc các triệu chứng báo trước của nó như chóng mặt hoặc đầu lảo đảo đang xảy ra.

Các triệu chứng báo trước có thể xảy ra như buồn nôn, chóng mặt/ đầu óc quay cuồng, toát mồ hôi... được báo cáo thường hơn ở những bệnh nhân điều trị với Dumax so với giả dược.

Trong các thử nghiệm lâm sàng, các trường hợp bất tỉnh đặc trưng như mất ý thức, nhịp tim chậm hoặc ngừng xoang quan sát được ở những bệnh nhân theo dõi Holter, được coi là nguyên nhân chính và phần lớn xảy ra trong 3 giờ đầu tiên sau khi dùng thuốc, sau liều đầu tiên, hoặc liên quan đến các thủ tục của nghiên cứu trong các cơ sở khám (như lấy máu và diễn tập thể đứng, đo huyết áp). Có thể có triệu chứng báo trước, chẳng hạn như buồn nôn, chóng mặt, chóng váng, hồi hộp, suy nhược, rối loạn và toát mồ hôi thường xảy ra trong vòng 3 giờ đầu tiên sau khi dùng thuốc, và thường xảy ra trước khi bất tỉnh. Bệnh nhân cần phải biết được rằng họ có thể gặp phải tình trạng này bất cứ lúc nào có hoặc không có triệu chứng báo trước khi điều trị với Dumax. Khi kê đơn bác sĩ nên tư vấn cho bệnh nhân về tầm quan trọng của việc duy trì độ ẩm và làm thế nào để nhận ra các dấu hiệu và triệu chứng báo trước để giảm khả năng chấn thương nghiêm trọng liên quan đến ngã do bất tỉnh. Nếu theo kinh nghiệm bệnh nhân gặp các triệu chứng báo trước, bệnh nhân ngay lập tức nên nằm xuống để đầu mình thấp hơn so với phần thân còn lại của cơ thể hoặc ngồi xuống và cúi đầu giữa hai gối cho đến khi các triệu chứng qua đi, và bệnh nhân cần được cảnh báo để tránh tình trạng chấn thương có thể gây ra, bao gồm cả khi lái xe hoặc vận hành máy móc nguy hiểm, khi bất tỉnh hoặc các hiệu ứng về thần kinh trung ương xảy ra.

Bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ về tim mạch

Các đối tượng có bệnh tim mạch cơ bản đã được loại trừ từ giai đoạn 3 của thử nghiệm lâm sàng. Nguy cơ biến chứng xấu trên tim mạch như ngất (ngất tim và ngất do các nguyên nhân khác) được tăng lên ở các bệnh nhân bệnh tim mạch (ví dụ, tắc nghẽn dòng chảy, bệnh van tim, hẹp động mạch vành và bệnh về động mạch vành). Không đủ dữ liệu để xác định xem nguy cơ gia tăng này kéo dài gây ngất (bất tỉnh) ở những bệnh nhân tiềm ẩn có bệnh tim mạch.

Dùng cùng với các thuốc hướng thần

Bệnh nhân cần được khuyên không dùng Dumax cùng với các thuốc hướng thần như ketamin, methylenedioxymethamphetamin (MDMA) và Diethylamide, acid lysergic (LSD) vì có thể dẫn tới những phản ứng nghiêm trọng. Những phản ứng này bao gồm, sự không giới hạn, loạn nhịp, tăng thân nhiệt, hội chứng serotonin. Sử dụng Dumax cùng với các thuốc hướng thần có tính chất an thần gây nghiện và các benzodiazepin có thể làm tăng thêm buồn ngủ và chóng mặt.

Ethanol

Bệnh nhân nên được khuyên không dùng Dumax kết hợp với rượu.

Kết hợp rượu với dapoxetine có thể làm tăng tác dụng lên thần kinh của rượu và cũng có thể làm tăng tác dụng không mong muốn như bất tỉnh, do đó làm tăng nguy cơ chấn thương do tai nạn; vì vậy bệnh nhân nên được khuyên tránh uống rượu trong khi đang dùng Dumax.

Thuốc gây giãn mạch

Nên thận trọng khi dùng Dumax cùng với các thuốc gây giãn mạch (như đối kháng thụ thể adrenergic và nitrat) có thể do làm giảm khả năng chịu áp (huyết áp) thể đứng.

Ức chế vừa phải CYP3A4

Cần thận trọng khi dùng cùng với các thuốc ức chế CYP3A4 mức vừa phải, cần hạn chế liều ở 30mg.

Ức chế CYP2D6

Cần thận trọng khi tăng liều lên 60mg đối với những bệnh nhân đang dùng thuốc ức chế mạnh CYP2D6 hoặc nếu tăng liều lên 60mg ở những bệnh nhân được biết là có chuyển hóa kém qua CYP2D6 do sẽ làm tăng mức độ phơi nhiễm và có thể dẫn đến tăng mức độ của các tác dụng không mong muốn phụ thuộc liều.

Hưng cảm

Không nên dùng Dumax ở những bệnh nhân có tiền sử hưng cảm/ hưng cảm nhẹ hoặc rối loạn lưỡng cực và cần ngưng dùng thuốc ngay khi bệnh nhân có triệu chứng của những rối loạn này.

Co giật

Do tiềm năng ảnh hưởng của SSRIs làm giảm ngưỡng co giật, Ngưng dùng Dumax ở bất kỳ bệnh nhân nào đang phát triển cơn co giật và tránh dùng ở những bệnh nhân động kinh không ổn định. Bệnh nhân bị động kinh cần được theo dõi cẩn trọng.

Trẻ em

Không dùng Dumax ở người dưới 18 tuổi.

Trầm cảm và/ hoặc tâm thần

Nam giới có dấu hiệu và triệu chứng của bệnh trầm cảm tiềm ẩn cần được đánh giá trước khi điều trị với Dumax để loại trừ các rối loạn tâm thần chưa được phát hiện. Không dùng Dumax đồng thời với các thuốc chống trầm cảm, bao gồm các thuốc SSRI và SNRI.

Không nên ngừng điều trị trầm cảm để bắt đầu điều trị PE bằng Dumax. Dumax không được chỉ định khi bệnh nhân có các rối loạn tâm thần và không sử dụng Dumax cho người mắc các bệnh như: tâm thần phân liệt, hoặc người bị trầm cảm do chưa loại trừ được việc làm trầm trọng thêm các triệu chứng của trầm cảm. Đây có thể là kết quả của các rối loạn tâm thần tiềm ẩn hoặc là hệ quả của thuốc. Bác sĩ nên khuyến cáo bệnh nhân báo cáo các biểu hiện của ý nghĩ đau buồn hay biểu hiện trầm trọng thêm của bệnh trầm cảm trong thời gian điều trị. Nên ngừng dùng Dumax trong trường hợp này.

Xuất huyết

Đã có báo cáo về hiện tượng chảy máu bất thường với các SSRI. Cẩn thận trọng với các bệnh nhân sử dụng Dumax, đặc biệt là khi dùng đồng thời với các thuốc được biết là có ảnh hưởng đến chức năng tiểu cầu (ví dụ, thuốc chống loạn thần không điển hình và các phenothiazin, acid acetylsalicylic, các thuốc chống viêm Non-steroid [NSAID], thuốc chống kết tập tiểu cầu) hoặc thuốc chống đông máu (ví dụ, warfarin), cũng như ở những bệnh nhân có tiền sử rối loạn chảy máu hoặc rối loạn đông máu.

Suy thận

Khuyến cáo không dùng Dumax cho bệnh nhân suy thận nặng và cẩn thận trọng khi dùng thuốc với các bệnh nhân suy thận vừa và nhẹ.

Hội chứng cai thuốc

Ngừng sử dụng đột ngột các SSRI để điều trị trầm cảm mãn tính đã ghi lại các biểu hiện sau: tâm trạng bồn chồn, dễ cáu gắt, lo âu, chóng mặt, rối loạn cảm giác (ví dụ, dị cảm như cảm giác bị điện giật), lo lắng, hoang mang, đau đầu, thờ ơ, rối loạn cảm xúc, mất ngủ và hưng cảm nhẹ.

Trong một thử nghiệm lâm sàng mù đôi trên các đối tượng bị xuất tinh sớm (PE) được thiết kế để đánh giá hội chứng cai thuốc trong vòng 62 ngày dùng thuốc mỗi ngày hoặc dùng liều 60mg khi cần cho thấy các triệu chứng cai thuốc nhẹ với các biểu hiện mất ngủ và chóng mặt ở các đối tượng chuyển sang dùng giả dược.

Rối loạn mắt

Sử dụng Dumax có liên quan đến tác dụng giãn đồng tử và đau mắt. Nên thận trọng khi sử dụng Dumax cho các bệnh nhân tăng nhãn áp hoặc những người có nguy cơ mắc bệnh glaucoma góc đóng.

Không dung nạp lactose

Những bệnh nhân có vấn đề về di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu hụt men Lapp lactase hoặc kém hấp thu glucose-galactose thì không nên dùng thuốc này.

TƯƠNG TÁC THUỐC VÀ CÁC DẠNG TƯƠNG TÁC KHÁC

Với các thuốc ức chế monoamine oxidase:

không nên dùng Dumax phối hợp với các thuốc thuộc nhóm này hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với MAOI. Tương tự vậy, một MAOI không nên dùng trong vòng 7 kể từ ngày ngừng dùng Dumax.

Tương tác tiềm ẩn khi kết hợp với thioridazine

không nên dùng Dumax phối hợp với các thuốc thuộc nhóm này hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với thioridazine. Tương tự vậy, không nên dùng thioridazin trong vòng 7 kể từ ngày ngừng dùng Dumax.

Sản phẩm thảo dược/ thuốc có tác dụng serotonin

Không dùng đồng thời với các thuốc ức chế tái hấp thu serotonin [ức chế chọn lọc serotonin (SSRI), thuốc ức chế tái hấp thu serotonin-norepinephrine (SNRIs), thuốc chống trầm cảm ba vòng (TCAs)] hoặc các sản phẩm thảo dược/ thuốc khác có tác dụng serotonin [ví dụ, L-tryptophan, triptans, tramadol, linezolid, lithium, St. John Wort (*Hypericum perforatum*)] hoặc trong vòng 14 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với các sản phẩm thuốc/ thảo dược. Tương tự như vậy, các sản phẩm thuốc/ thảo dược không nên dùng trong vòng 7 ngày kể từ ngày ngưng điều trị với Dumax.

Các thuốc có tác dụng CNS

Sử dụng đồng thời Dumax với các thuốc tác dụng lên thần kinh trung ương (ví dụ, antiepileptic, thuốc chống trầm cảm, thuốc chống loạn thần, anxiolytics, thuốc an thần gây ngủ) chưa được đánh giá ở các bệnh nhân xuất tinh sớm. Do đó cần thận trọng khi dùng đồng thời Dumax với các thuốc này.

Các tương tác dược lý

Tác dụng của việc phối hợp các thuốc lên được động học của dapoxetine.

Trong các nghiên cứu in vitro trên gan người, thận và ruột thì dapoxetine được chuyển hóa chủ yếu bởi CYP2D6, CYP3A4 và flavin monooxygenase 1 (FMO1). Vì vậy các thuốc ức chế các enzym này có thể làm giảm độ thanh thải dapoxetine; chống chỉ định dùng Dumax đồng thời với các chất ức chế mạnh CYP3A4 như ketoconazol, itraconazol, ritonavir, saquinavir, telithromycin, nefazodone, nelfinavir và atazanavir.

Các thuốc ức chế vừa phải CYP3A4: dùng dapoxetine với liều tối đa là 30mg.

Các thuốc có tiềm năng ức chế CYP2D6: làm Cmax và AUC của dapoxetine (liều đơn 60mg) tăng 50% và 88%.

Các chất ức chế PDE5: không nên dùng Dumax ở các bệnh nhân đang dùng thuốc ức chế PDE5 do có thể làm giảm khả năng chịu được huyết áp thể đứng. Hiệu quả và an toàn của Dumax trên bệnh nhân có cả xuất tinh sớm và rối loạn chức năng cương dương phải điều trị bằng PDE5 là chưa được xác định.

Thận trọng khi dùng Dumax cho những bệnh nhân đang sử dụng thuốc đối kháng thụ thể alpha adrenergic do có thể làm giảm khả năng chịu được huyết áp thể đứng.

KHẢ NĂNG SINH SẢN, PHỤ NỮ MANG THAI VÀ CHO CON BÚ

Dumax không dùng cho phụ nữ

Nghiên cứu trên động vật không cho thấy tác hại trực tiếp hoặc gián tiếp liên quan đến khả năng sinh sản, mang thai hoặc phôi/ phát triển của thai nhi.

ẢNH HƯỞNG ĐẾN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Dumax có ảnh hưởng nhỏ hoặc vừa lên khả năng lái xe và vận hành máy móc. Chóng mặt, rối loạn tập chung, ngất, mờ mắt và buồn ngủ đã được ghi nhận trong các thử nghiệm lâm sàng. Vì vậy, bệnh nhân cần được cảnh báo để tránh tình trạng chấn thương có thể xảy ra, bao gồm cả lái xe hoặc vận hành máy móc nguy hiểm.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Bất tỉnh và hạ huyết áp thể đứng đã ghi nhận được trong các thử nghiệm lâm sàng.

Các tác dụng không mong muốn của thuốc sau đây đã được báo cáo trong giai đoạn 3 của thử nghiệm lâm sàng thường gặp nhất và có liên quan đến liều: buồn nôn (11% và 22% khi dùng 30mg và 60mg dapoxetine), chóng mặt (5,8% và 10,9%), đau đầu (5,6% và 8,8%), tiêu chảy (3,5% và 6,9%), mất ngủ (2,1% và 3,9%), mệt mỏi (2% và 4,1%). Các tác dụng không mong muốn thường gặp nhất dẫn đến ngưng dùng thuốc là buồn nôn (2,2% đối tượng dùng Dumax) và chóng mặt (1,2% đối tượng được điều trị).

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Chưa ghi nhận được trường hợp quá liều nào

Trong các nghiên cứu lâm sàng thì không thấy có biến cố bất lợi nào khi dùng liều hàng ngày lên đến 240mg (2 liều 120mg cho 3 giờ đồng hồ). Nói chung, các biểu hiện của quá liều với SSRIs bao gồm các phản ứng bất lợi kiểu serotonin như buồn ngủ, rối loạn tiêu hóa như buồn nôn và nôn, nhịp tim nhanh, run, kích động và chóng mặt.

Trong trường hợp quá liều, áp dụng các biện pháp hỗ trợ tiêu chuẩn. Do thuốc gắn mạnh với protein và mức phân bố lớn nên gây lợi tiểu bắt buộc, lọc máu, lọc máu hấp phụ và truyền đổi máu có khả năng mang lại lợi ích. Không có thuốc giải độc đặc hiệu.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LÝ

Nhóm dược lý: nhóm tiết niệu khác,

ATC code: G04BX14

Cơ chế tác dụng

Dapoxetine thuộc nhóm chọn lọc serotonin (SSRI) với IC₅₀ 1.12 nM, còn chất chuyển hóa chính của nó là desmethyl dapoxetine (IC₅₀ <1.0 nM) và didesmethyl dapoxetine (IC₅₀ = 2.0 nM) (dapoxetine-N-oxide (IC₅₀ 282 nM)).

Sự xuất tinh chủ yếu qua trung gian của hệ thống thần kinh giao cảm. Con đường xuất tinh có nguồn gốc từ trung tâm phản xạ tủy sống, qua trung gian của thân não, ảnh hưởng đầu tiên bởi một số hạt nhân trong não (preoptic trung gian và các hạt nhân paraventricular).

Cơ chế tác động của dapoxetine trong xuất tinh sớm được cho là có liên quan đến sự ức chế tái hấp thu tế bào thần kinh serotonin và tác động của thần kinh tại thụ thể trước và sau synap.

DƯỢC LỰC HỌC

Hấp thu

Dapoxetine hấp thu nhanh đạt được nồng độ tối đa trong huyết tương (C_{max}) khoảng 1-2 giờ sau khi uống thuốc. Sinh khả dụng tuyệt đối 42% (khoảng dao động 15-76 %) ảnh hưởng phụ thuộc liều (AUC và C_{max}) được quan sát giữa các liều 30 và 60 mg. Sau khi dùng đa liều, giá trị AUC cho cả dapoxetine và chất chuyển hóa desmethyldapoxetine (DEP) tăng lên khoảng 50% khi so sánh với liều đơn. Khi uống cùng với bữa ăn có lượng chất béo ít sẽ làm giảm C_{max} (10%) và tăng AUC (khoảng 12%) của dapoxetin và làm chậm nhẹ thời gian đạt được nồng độ đỉnh.

Những thay đổi này không ảnh hưởng đáng kể về lâm sàng. Dumax có thể uống cùng hoặc không cùng bữa ăn.

Phân bố

Trong nghiên cứu in vitro với huyết thanh người thì trên 99% dapoxetin gắn với protein. Các chất chuyển hóa của dapoxetin là desmethyl dapoxetine (DAD) gắn 98,5% với protein. Nồng độ phân bố ổn định của dapoxetine là 162 L.

Chuyển hóa

Trong các nghiên cứu in vitro dapoxetin được chuyển hóa bởi hệ thống enzym trong gan và thận, chuyển hóa ban đầu qua CYP2D6, CYP3A4, và flavin monooxygenase (FMO1). Sau khi uống dapoxetin đánh dấu, dapoxetin được chuyển hóa chủ yếu qua con đường chuyển hóa sinh học sau đây: N-oxy hóa, N-demethyl hóa, naphthyl hydroxylation, glucuronid hóa và sulfon hóa. Sau khi uống thuốc có tham gia chuyển hóa gan-ruột.

Dapoxetin và dapoxetine-N-oxide là hai dạng tồn tại trong huyết tương. Trong các nghiên cứu in vitro về sự gắn và vận chuyển cho thấy dapoxetine-N-oxide là không hoạt động. Các chất chuyển hóa khác như desmethyldapoxetine và didesmethyl dapoxetine là ít hơn 3% so với tổng liều lưu hành trong huyết tương.

Thải trừ

Các chất chuyển hóa của dapoxetin được thải trừ chủ yếu qua nước tiểu dưới dạng phối hợp. Dạng hoạt chất không chuyển hóa cũng được tìm thấy trong nước tiểu. Sau khi uống, bắt đầu hấp thu vào máu sau khoảng 1,5 giờ, nồng độ trong huyết tương giảm 5% so với nồng độ đỉnh sau 24 giờ và thời gian bán thải là khoảng 19 giờ. Thời gian bán thải của DEP cũng là khoảng 19 giờ.

HẠN DÙNG

2 năm kể từ ngày sản xuất

BẢO QUẢN

Bảo quản tránh ánh sáng ở nơi khô ráo, nhiệt độ dưới 30°C

ĐÓNG GÓI

Dumax 60mg:

Hộp 1 vỉ x 4 viên hoặc hộp 3 vỉ x 4 viên

Dumax 30mg:

Hộp 2 vỉ x 4 viên hoặc hộp 5 vỉ x 4 viên

SẢN XUẤT BỞI Eskayef Bangladesh Limited

Văn phòng: Taneem Squire, 158 Kamal Ataturk Avenue, Block-E, Banani, Dhaka-1213, Bangladesh.

Nhà máy I: 2/C, North East Darus Salam Road, Industrial Plot, Mirpur-1, Dhaka-1216, Bangladesh

Nhà máy II: 400 Tongi Industrial Area, Squibb Road, Tongi, Gazipur, Bangladesh

Phone: +880-2-9802127-8 Fax: +880-2-900833

e-mail: atahar@skf.transcom.com

Web: www.skfbd.com