Инструкция по применению
Допегит Таблетки 250 мг 50 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Венгрия
Производитель: Эгис
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Метилдопа
Количество в упаковке: 50
Дозировка действующего вещества: 250 мг
Срок годности: 60.0

Описание

Белые или серовато-белые, круглые плоские таблетки с фаской, с гравировкой DOPEGYT на одной стороне таблетки, без или почти без запаха.

Действующее вещество

Метилдопа

Состав

На 1 таблетку: действующее вещество: метилдопы сесквигидрат 282 мг (соответствует 250 мг метилдопы), вспомогательные вещества: крахмал кукурузный 45,7 мг, этилцеллюлоза 8,8 мг, тальк 6 мг, карбоксиметилкрахмал натрия 3,5 мг, стеариновая кислота 3 мг, магния стеарат 1 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание метилдопы из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) составляет примерно 50%. После приема внутрь биодоступность метилдопы составляет около 25%. Максимальная концентрация препарата в плазме крови (Cmax) определяется через 2-3 ч. Связь с белками плазмы крови - менее 20%. Метаболизм действующего вещества происходит интенсивно. Метилдопа метаболизируется преимущественно в печени. Активный метаболит метилдопы – альфа-метилнорадреналин - образуется в адренергических нейронах ЦНС. Также существуют некоторые другие производные метилдопы, которые выводятся из организма почками. Приблизительно две трети всосавшейся метилдопы выводится из организма почками в неизмененном виде, а также в форме сульфатных соединений. Остальная часть препарата выводится через кишечник в неизмененном виде. Выведение метилдопы имеет двухфазный характер. При сохранной функции почек период полувыведения препарата (T½) составляет 1,8 + 0,2 ч. Действующее вещество полностью выводится из организма в течение 36 ч. Метилдопа удаляется из организма с помощью диализа. Шестичасовой сеанс гемодиализа приводит к выведению приблизительно 60% всосавшейся дозы, тогда как в результате 20-30-часового перитонеального диализа удаляется ориентировочно 22-39% препарата. Метилдопа проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком. После приема разовой пероральной дозы максимальный эффект метилдопы развивается в течение 4-6 ч и продолжается приблизительно 12-24 ч. При многократном применении препарата максимальное снижение АД достигается на 2-3 сутки. После прекращения терапии уровень АД возвращается к исходным значениям в течение 1-2 дней. Пациенты с нарушенной функцией почек При нарушении функции почек выведение метилдопы замедляется пропорционально тяжести почечной недостаточности. При тяжелой почечной недостаточности (без гемодиализа) T½ препарата увеличивается приблизительно в 10 раз.

Показания

Артериальная гипертензия.

Способ применения и дозы

Для приема внутрь. Терапия препаратом Допегит® требует индивидуального подбора дозы. Препарат можно принимать как до, так и после еды. Взрослые пациенты Рекомендованная начальная доза препарата Допегит® в первые 2 дня терапии составляет 250 мг 2-3 раза в сутки. Затем дозу можно постепенно увеличить или уменьшить (в зависимости от степени снижения АД). Продолжительность интервалов между повышением и снижением дозы препарата Допегит® должна составлять не менее 2 дней. Поскольку в течение 2-3 дней после начала терапии, а также при

последующем увеличении дозы может наблюдаться побочное седативное влияние препарата, рекомендуется сначала увеличивать вечернюю дозу препарата. Стандартная поддерживающая доза препарата Допегит® составляет 500-2000 мг /сутки. Эта доза делится на 2-4 приема. Максимальная суточная доза препарата не должна превышать 3000 мг. В случаях, когда на фоне приема препарата в дозе 2000 мг/сутки отмечается недостаточно эффективное снижение уровня АД, рекомендуется комбинировать Допегит® с другими антигипертензивными препаратами. Спустя 2-3 месяца терапии к метилдопе может выработаться толерантность. Эффективное снижение уровня АД может быть достигнуто за счет увеличения дозы препарата или сопутствующего применения диуретиков. Спустя 48 ч после прекращения терапии препаратом Допегит®, АД обыкновенно возвращается к исходному уровню. «Эффект рикошета» при этом не наблюдается. Препарат Допегит® можно назначать пациентам, которые уже получают терапию другими антигипертензивными препаратами, при условии постепенной отмены этих препаратов. В таких случаях начальная доза препарата Допегит® не должна превышать 500 мг в сутки. Увеличение дозы осуществляется по мере необходимости с интервалами не менее 2 дней. При применении препарата Допегит® в дополнение к ранее назначенной антигипертензивной терапии, для того чтобы гарантировать плавный переход может потребоваться коррекция доз гипотензивных препаратов. Пожилые пациенты Пожилым пациентам препарат назначается в минимальной начальной дозе, которая не должна превышать 250 мг в сутки. При необходимости дозу можно постепенно увеличивать. Продолжительность интервалов между повышением дозы препарата составляет не менее 2 дней. Максимальная суточная доза препарата Допегит® не должна превышать 2000 мг. У пожилых пациентов чаще наблюдаются обмороки. Это может быть связано с повышенной восприимчивостью к препарату и выраженным атеросклеротическим поражением сосудов. Развития обмороков можно избежать за счет снижения дозы препарата Допегит®. Дети старше 3 лет Для детей начальная доза препарата составляет 10 мг/кг массы тела в сутки. Суточная доза делится на 2-4 приема. При необходимости дозу можно постепенно увеличивать, пока не будет достигнут желаемый эффект. Между повышением дозы препарата необходимо соблюдать интервал не менее 2 дней. Максимальная суточная доза препарата Допегит® составляет 65 мг/кг массы тела в сутки, но не более 3 г/сутки. Нарушения функции почек Метилдопа выводится преимущественно почками, поэтому при лечении пациентов с нарушенной функцией почек дозу препарата Допегит® необходимо снижать. При легкой почечной недостаточности (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) – 60-89 мл/мин/1,73 м2 площади поверхности тела) интервал между приемами препарата рекомендуется увеличить до 8 ч, при почечной недостаточности средней тяжести – до 8-12 ч (СКФ – 30-59 мл/мин/1,73 м2), а при тяжелой почечной недостаточности – до 12-24 ч (СКФ - <,30 мл/мин/1,73 м2).

Метилдопа удаляется из организма при диализе, поэтому рекомендуется использовать добавочную дозу препарата 250 мг для профилактики увеличения уровня АД после сеанса гемодиализа.Побочное действие В начале терапии препаратом Допегит®, а также при увеличении дозы препарата могут наблюдаться преходящие седативные эффекты, головная боль, общая слабость и повышенная утомляемость. Классификация нежелательных реакций в зависимости от частоты встречаемости: очень часто(>,1 /10), часто (от >,1/100 до <,1/10), нечасто (от >,1/1000 до <,1/100), редко (от >,1/10000 до <, 1/1000), очень редко (<,1/10000), частота неизвестна (на основании имеющихся данных частоту определить невозможно). В каждой из указанных категорий нежелательные эффекты представлены в порядке убывания серьезности. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: Очень часто: положительный тест Кумбса. Редко: гемолитическая анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения. Частота неизвестна: угнетение костного мозга, положительный тест на антиядерные антитела, клетки красной волчанки (LE), положительная реакция на ревматоидный фактор. Нарушения со стороны иммунной системы Частота неизвестна: васкулит, волчаночный синдром, медикаментозная лихорадка, эозинофилия. Нарушения со стороны эндокринной системы Частота неизвестна: гиперпролактинемия, гинекомастия, галакторея, аменорея. Нарушения психики Частота неизвестна: кошмарные сны, обычно невыраженный, преходящий психоз или депрессия, понижение либидо. Нарушения со стороны нервной системы Очень редко: паркинсонизм. Частота неизвестна: периферический паралич лицевого нерва (паралич Белла), снижение интеллекта, непроизвольная хореоатетотическая двигательная активность, симптомы недостаточности мозгового кровообращения (возможно, как следствие гипотензии), головная боль, седативный эффект (обыкновенно преходящий), общая слабость или повышенная утомляемость, головокружение, парестезии. Нарушения со стороны сердца Очень редко: прогрессирование стенокардии, миокардит, перикардит Частота неизвестна: застойная сердечная недостаточность (СН), периферические отеки, увеличение массы тела, синусовая брадикардия. Периферические отеки и увеличение массы тела обыкновенно регрессируют на фоне терапии диуретиками. Если отеки нарастают или появляются признаки СН, прием препарата следует прекратить. Нарушения со стороны сосудов Частота неизвестна: повышение чувствительности каротидного синуса, ортостатическая гипотензия (рекомендуется снижение дозы препарата). Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостенья Частота неизвестна: заложенность носа. Нарушения со стороны ЖКТ Очень редко: панкреатит. Частота неизвестна: колит, рвота, диарея, воспаление слюнных желез, боль или темное окрашивание языка, тошнота, запор, вздутие живота, метеоризм, сухость слизистой оболочки рта. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей Очень редко: гепатит, некроз печени. Частота неизвестна: холестаз, желтуха,

изменение функциональных проб печени. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей Частота неизвестна: токсический эпидермальный некролиз, экзема или сыпь, напоминающая лишай. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани Частота неизвестна: легкая боль в суставах с отеком или без него, миалгия. Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочной железы Частота неизвестна: импотенция, нарушения эякуляции. Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований Частота неизвестна: повышение активности «печеночных» трансаминаз, повышенная концентрация мочевины в крови.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата, острый гепатит, цирроз печени, заболевания печени в анамнезе (на фоне приема метилдопы), сопутствующая терапия ингибиторами моноаминооксидазы (МАО), депрессия, гемолитическая анемия, феохромоцитома, детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы).

Применение при беременности и кормлении грудью

Клинические исследования: после применения метилдопы во время второго и третьего триместров беременности не выявлено признаков повреждения плода или новорожденного. Опубликованные результаты исследований, проведенных с метилдопой во всех триместрах беременности, указывают на то, что вероятность повреждения плода минимальна.

Побочные действия

В начале терапии препаратом Допегит®, а также при увеличении дозы препарата могут наблюдаться преходящие седативные эффекты, головная боль, общая слабость и повышенная утомляемость. Классификация нежелательных реакций в зависимости от частоты встречаемости: очень часто(>,1/10), часто (от >,1/100 до <,1/10), нечасто (от >,1/1000 до <,1/100), редко (от >,1/10000 до <, 1/1000), очень редко (<,1/10000), частота неизвестна (на основании имеющихся данных частоту определить невозможно). В каждой из указанных категорий нежелательные эффекты представлены в порядке убывания серьезности. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: Очень часто: положительный тест Кумбса. Редко: гемолитическая анемия, лейкопения, гранулоцитопения, тромбоцитопения. Частота неизвестна: угнетение костного мозга, положительный тест на антиядерные антитела, клетки красной волчанки (LE), положительная реакция на ревматоидный фактор. Нарушения со стороны иммунной системы Частота неизвестна: васкулит, волчаночный синдром, медикаментозная лихорадка, эозинофилия. Нарушения со стороны

эндокринной системы Частота неизвестна: гиперпролактинемия, гинекомастия, галакторея, аменорея. Нарушения психики Частота неизвестна: кошмарные сны, обычно невыраженный, преходящий психоз или депрессия, понижение либидо. Нарушения со стороны нервной системы Очень редко: паркинсонизм. Частота неизвестна: периферический паралич лицевого нерва (паралич Белла), снижение интеллекта, непроизвольная хореоатетотическая двигательная активность, симптомы недостаточности мозгового кровообращения (возможно, как следствие гипотензии), головная боль, седативный эффект (обыкновенно преходящий), общая слабость или повышенная утомляемость, головокружение, парестезии. Нарушения со стороны сердца Очень редко: прогрессирование стенокардии, миокардит, перикардит Частота неизвестна: застойная сердечная недостаточность (СН), периферические отеки, увеличение массы тела, синусовая брадикардия. Периферические отеки и увеличение массы тела обыкновенно регрессируют на фоне терапии диуретиками. Если отеки нарастают или появляются признаки СН, прием препарата следует прекратить. Нарушения со стороны сосудов Частота неизвестна: повышение чувствительности каротидного синуса, ортостатическая гипотензия (рекомендуется снижение дозы препарата). Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостенья Частота неизвестна: заложенность носа. Нарушения со стороны ЖКТ Очень редко: панкреатит. Частота неизвестна: колит, рвота, диарея, воспаление слюнных желез, боль или темное окрашивание языка, тошнота, запор, вздутие живота, метеоризм, сухость слизистой оболочки рта. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей Очень редко: гепатит, некроз печени. Частота неизвестна: холестаз, желтуха, изменение функциональных проб печени. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей Частота неизвестна: токсический эпидермальный некролиз, экзема или сыпь, напоминающая лишай. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани Частота неизвестна: легкая боль в суставах с отеком или без него, миалгия. Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочной железы Частота неизвестна: импотенция, нарушения эякуляции. Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований Частота неизвестна: повышение активности «печеночных» трансаминаз, повышенная концентрация мочевины в крови.

Передозировка

Симптомы острой передозировки: выраженное снижение АД, головокружение, выраженная сонливость, слабость, брадикардия, заторможенность, тремор, атония кишечника, запор, вздутие живота, метеоризм, диарея, тошнота, рвота. Лечение: вскоре после передозировки - промывание желудка, стимуляция рвоты - могут снизить количество всосавшегося препарата. После того, как препарат всосется, можно стимулировать его выведение почками с помощью введения жидкости. Необходим контроль ЧСС, объема циркулирующей крови, водно-электролитного баланса, функции кишечника и почек, а также головного мозга. При необходимости можно вводить симпатомиметики (например, эпинефрин). Метилдопа выводится из организма с помощью гемодиализа. Специфического антидота не существует. При подозрении на хроническую передозировку, препарат Допегит® следует отменить.

Взаимодействие с другими препаратами

Допегит® нельзя применять одновременно со следующими лекарственными средствами (ЛС): • Ингибиторы МАО. Одновременное применение со следующими ЛС требует особой осторожности: Препараты, снижающие антигипертензивный эффект препарата Допегит®: • Симпатомиметики (усиливают прессорный эффект), • трициклические антидепрессанты, фенотиазины (в то же время они могут обладать аддитивным антигипертензивным действием), • препараты железа для приема внутрь (они могут снизить биодоступность метилдопы), • нестероидные противовоспалительные препараты, • эстрогенные препараты. Препараты, усиливающие антигипертензивный эффект препарата Допегит®: • другие гипотензивные средства, (усиление антигипертензивного эффекта), • общие анестетики Препараты, способные изменять эффекты друг друга • леводопа + карбидопа (возможно развитие ортостатической гипотензии, в этом случае пациенты после приема препаратов должны находиться в горизонтальном положении в течение 1-2 часов), анксиолитические ЛС (транквилизаторы) • литий (опасность усиления токсичности лития), • леводопа (снижение антипаркинсонического эффекта и усиление нежелательного действия на ЦНС), • этанол и другие препараты, угнетающие ЦНС (усиление депрессии), • антикоагулянты (усиление антикоагулянтного эффекта, опасность кровотечения), • бромокриптин (возможно нежелательное влияние на концентрацию пролактина), • галоперидол (возможно нарушение когнитивных функций - дезориентация и спутанное состояние сознания).

Особые указания

В редких случаях у пациентов, принимавших метилдопу, развивалась гемолитическая анемия. При появлении признаков анемии необходимо определить концентрацию

гемоглобина и гематокрит. Если анемия подтверждается, следует дополнительно оценить степень гемолиза. В случае развития гемолитической анемии терапию препаратом Допегит® необходимо прекратить. После прекращения терапии (с назначением кортикостероидов или без них) обыкновенно удается быстро достигнуть ремиссии. Тем не менее, в редких случаях наблюдались летальные исходы. Прием препарата Допегит® противопоказан пациентам с гемолитической анемией, развившейся на фоне терапии этим препаратом. У некоторых пациентов, длительное время принимающих препарат Допегит®, определяется положительная проба Кумбса. Согласно сообщениям различных исследователей распространенность этой реакции варьирует от 10 до 20%. Положительная проба Кумбса редко наблюдается в течение первых шести месяцев терапии. Если это явление не развилось в течение первых 12 месяцев терапии, то в дальнейшем его выявление маловероятно. Распространенность положительной пробы Кумбса носит дозозависимый характер. Реже всего это явление наблюдается у пациентов, принимающих препарат в дозе 1000 мг/сутки или менее. Проба Кумбса, положительная на фоне приема метилдопа, становится отрицательной спустя несколько недель или месяцев после прекращения терапии препаратом. Перед началом лечения, а также на 6 и 12 месяце терапии рекомендуется выполнять общий анализ крови (ОАК) и прямую пробу Кумбса. Выявление положительной пробы Кумбса в прошлом или на фоне проводимой терапии само по себе не является противопоказанием к приему препарата Допегит®. В случаях, когда положительная прямая проба Кумбса выявляется на фоне приема препарата, необходимо исключить наличие у пациента гемолитической анемии и определить клиническую значимость этого явления. Сведения о предшествующих положительных результатах пробы Кумбса помогают при оценке крови на перекрестную совместимость перед трансфузией. Если при лечении пациента, принимающего препарат Допегит®, возникает необходимость в проведении трансфузии, то перед переливанием крови необходимо выполнить как прямую, так и непрямую пробу Кумбса. При отсутствии гемолитической анемии обыкновенно положительной бывает только прямая проба Кумбса. Положительная прямая проба Кумбса не оказывает влияния на определение группы крови и результат пробы на перекрестную совместимость. Если непрямая проба Кумбса тоже положительна, то могут возникнуть трудности при оценке перекрестной совместимости. В таких случаях необходима консультация гематолога или трансфузиолога. В редких случаях на фоне терапии метилдопой наблюдалось развитие обратимой лейкопении и гранулоцитопении. После прекращения терапии количество гранулоцитов возвращалось к норме. Кроме того, у пациентов, принимавших метилдопу, регистрировались редкие случаи обратимой тромбоцитопении. У некоторых пациентов в течение первых трех недель терапии препаратом наблюдалась лихорадка, которая иногда сопровождалась эозинофилией или повышением активности «печеночных» трансаминаз. Кроме того, прием

метилдопы может сопровождаться развитием желтухи. Желтуха обычно появляется в течение первых 2-3 месяцев терапии. В некоторых случаях на фоне желтухи подтверждался холестаз. Очень редко у пациентов развивался фатальный некротический гепатит. Биопсия печени, произведенная у нескольких пациентов с нарушениями функции этого органа, показала микроскопический фокальный некроз, характерный для лекарственной гиперчувствительности. Перед началом приема препарата Допегит®, на 6 и 12 неделях лечения, а также в любое время при появлении необъяснимой лихорадки рекомендуется определять активность «печеночных» трансаминаз и ОАК с лейкоформулой. При появлении лихорадки, желтухи или повышении активности «печеночных» трансаминаз, прием препарата Допегит® необходимо сразу же прекратить. Если появление этих признаков связано с гиперчувствительностью к метилдопе, то после отмены препарата лихорадка исчезнет, а функциональные печеночные пробы возвратятся к нормальным значениям. Возобновлять прием препарата таким пациентам не рекомендуется. Пациентам с патологией печени в анамнезе терапию препаратом Допегит® следует проводить с особой осторожностью. Пациентам, принимающим Допегит®, может потребоваться снижение доз анестетиков. При развитии гипотонии во время проведения общей анестезии рекомендуется использовать терапию вазопрессорами. Адренергические рецепторы не теряют свою чувствительность на фоне терапии метилдопой. У некоторых пациентов, принимающих метилдопу, появляются периферические отеки и увеличивается масса тела. Эти побочные явления легко устранить с помощью диуретиков. При нарастании отеков и появлении симптомов СН терапию препаратом Допегит® необходимо прекратить. Поскольку метилдопа удаляется из организма при помощи диализа, после завершения сеанса может наблюдаться рост АД. У пациентов с двусторонним поражением сосудов головного мозга (цереброваскулярная болезнь) прием метилдопа может сопровождаться непроизвольными хореоатетотическими движениями. В таких случаях терапию препаратом необходимо прекратить. Препарат Допегит® необходимо с большой осторожностью применять при лечении пациентов с печеночной порфирией и их близких родственников. Терапия препаратом Допегит® может оказывать влияние на результаты измерения концентрации мочевой кислоты (с применением фосфорно-вольфрамового реактива), креатинина (с помощью щелочного пикрата) и аспартатаминотрансферазы (АСТ) (колориметрическим методом) в сыворотке крови. О влиянии терапии метилдопы на спектрофотометрический анализ активности АСТ не сообщалось. На фоне терапии метилдопы могут быть получены ложноположительные результаты определения содержания катехоламинов в моче флуоресцентным методом, что осложняет диагностику феохромоцитомы. В то же время, метилдопа не оказывает влияния на оценку концентрации ванилилминдальной кислоты в моче. В редких случаях на воздухе моча пациентов, принимающих метилдопу, может темнеть.

Этот эффект связан с разложением метилдопы и ее метаболитов. Во время приема препарата Допегит® запрещается употреблять алкогольные напитки.

Условия хранения

Беречь от детей