

Дапсон-Фатол



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Дапсон](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской для разлома на одной стороне.

	1 таб.
дапсон	50 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, коповидон, кросповидон, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат (растительный).

25 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

25 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

500 шт. - контейнеры полипропиленовые (100) - коробки картонные.

1000 шт. - контейнеры полипропиленовые (48) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противолепрозное средство группы сульфонов. Оказывает бактериостатическое действие. Активен в отношении широкого спектра микроорганизмов, особенно эффективен против *Mycobacterium leprae* (минимальная эффективная концентрация находится в пределах наногرامмов, поэтому лечебного эффекта при лепре удается добиться при дозе 25 мг в день), *Plasmodium*, *Pneumocystis carinii*. Механизм действия предположительно имеет, по крайней мере, 2 точки приложения: с одной стороны, образуется аналог дигидроптеринозой кислоты (дапсон всасывается вместо п-аминобензойной кислоты), а с другой стороны, происходит угнетение фермента дигидроптероатсинтетазы. В результате этих процессов могут возникать нарушения функций других систем, например, дигидрофолатредуктазы, функция которой заключается в преобразовании неиспользуемой микроорганизмами дигидрофолиевой кислоты в тетрагидрофолиевую кислоту. Предположительно, кроме антибактериального эффекта, действие дапсона определяется и другими факторами. В частности, дапсон способен угнетать продукцию цитотоксических радикалов в цепи миелопероксидаза - пероксид водорода - галогенсодержащие соединения. Были описаны также другие эффекты дапсона: ингибирование реакции Артуса, системы комплемента при его активации по альтернативному пути, ингибирование некоторых лизосомальных ферментных систем, реакции эритроцитов на фитогемагглютинин и, наконец, угнетение связывания лейкотриена В₄ с его специфическими рецепторами. Влияние на иммунную систему, очевидно, также является важным свойством дапсона, наряду с его анальгезирующим и противовоспалительным действием, выявленным в эксперименте.

Фармакокинетика

Дапсон практически полностью всасывается (70-80%) после перорального приема. C_{max} препарата в плазме достигается через 2-6 ч. При дозе 100 мг в день концентрация дапсона в плазме крови достигает 1.7 мг/л при однократном приеме, 3.3 мг/л в состоянии равновесия и падает до 0.7 мг/л через 24 ч. 70-90% дапсона связывается с белками плазмы. Он хорошо проникает в различные ткани и органы, и полученные значения примерно соответствуют концентрациям в плазме. Дапсон также может проникать в во внутриклеточное пространство фагоцитов.

$T_{1/2}$ дапсона относительно долгий, в среднем около 30 ч. Около 90% от введенной перорально дозы 100 мг полностью выводится примерно через 9 дней, но при длительном лечении дапсоном активный ингредиент обнаруживается в организме в течение до 35 дней после введения последней дозы. Однако относительной кумуляции препарата в организме не происходит.

Дапсон подвергается ацетилированию в печени. Другим важным путем метаболизма дапсона является его гидроксильрование. Предполагается, что моногидроксиламин дапсона отвечает за побочные эффекты дапсона со стороны крови. Для препарата характерна гепатоэнтеральная циркуляция. Дапсон выводится примерно на 90% почками, в значительной степени в виде метаболитов, и на 10% с калом.

Показания к применению:

Для лечения лепры - в комбинации с другими препаратами, эффективными против лепры.

Герпетиформный дерматит (Дюринга), буллезный пемфигоид (в комбинации с кортикостероидами и иммуносупрессорами или монотерапия при легком течении).

В отдельных случаях - лечение васкулитов (в комплексной терапии).

Относится к болезням:

- [Васкулит](#)
- [Дерматит](#)
- [Пемфигус](#)

Противопоказания:

— гиперчувствительность к дапсону или другим компонентам препарата, к сульфонидам и сульфонам;

— тяжелая анемия (содержание гемоглобина менее 10г%). В чрезвычайной ситуации (например, при синдроме Дюринга-Брокка) может возникнуть необходимость проведения лечения дапсоном при строгом контроле, в первую очередь, формулы красной крови;

— тяжелые заболевания печени;

— детский возраст до 18 лет.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Лучше всего принимать после еды, запивая большим количеством воды. Используется, как правило, в комплексной терапии. Один день в неделю препарат не принимают (например, по воскресеньям).

Дозы и длительность применения

Режим дозирования индивидуальный. Средняя доза препарата составляет 50-100 мг дапсона, т.е. 1-2 таблетки в день, 6 дней в неделю.

Если не прописано иное, действуют следующие указания по дозировке:

Лепра: средняя суточная доза составляет 50-100 мг (1-2 таблетки) в день. Прием препарата длительный в течение ряда лет.

Герпетиформный дерматит (Дюринга): лечение следует начинать с 2 таблеток в день (100 мг дапсона) в течение 1 недели. Затем доза может быть увеличена до 4 таблеток (200 мг дапсона) до достижения эффекта. Однако в каждом конкретном случае необходимо стремиться к наименьшей дозе - 50 мг. В отдельных случаях в течение короткого периода времени можно принимать 300 мг дапсона (6 таблеток) в день, хотя необходимо стремиться к поддерживающей дозе по 50 мг дапсона в день, чего можно достигнуть путем комбинации препарата с кортикостероидами.

В случае, если клиническая картина заболевания сопровождается симптомами со стороны желудочно-кишечного тракта, назначение аглутеновой диеты может способствовать снижению дозы препарата.

Продолжительность лечения при дерматите Дюринга - длительная, в течение многих лет. Длительность перерыва между курсами увеличивается при применении кортикостероидов. Возможность и длительность перерывов определяются в зависимости от конкретного случая.

Буллезный пемфигоид - 100-150 мг/сут.

Васкулит - 50-150 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны кровеносной системы: гемолитическая анемия, метгемоглобинемия, эозинофилия, агранулоцитоз.

Реакции гиперчувствительности: в виде так называемого дапсонового синдрома: наблюдаются лихорадка, плохое самочувствие, кожная сыпь, желтуха, набухание лимфатических узлов, мононуклеоз, метгемоглобинемия и анемия, в тяжелых случаях - мультиформная эритема или эксфолиативный дерматит.

Со стороны нервной системы: периферические нейропатии, головокружение, нарушение зрения, психоз, бессонница.

Прочие: в начале лечения возможны головные боли, боли в животе и тошнота, рвота, панкреатит, лихорадка, фототоксичность, тахикардия, альбуминурия, гипоальбуминурия без протеинурии, нефротический синдром, папиллярный некроз, инфиртильность у мужчин, системная красная волчанка, синдром, подобный инфекционному мононуклеозу, обычно проходящие при дальнейшем приеме препарата.

В очень редких случаях возможны агранулоцитоз, периферическая моторная нейропатия и гипоальбуминемия.

Передозировка:

Симптомы интоксикации: диспноэ, тошнота и рвота, головные боли, цианоз, тахикардия, метгемоглобинемия, гемолиз, гематурия, почечная недостаточность, неврологические и психиатрические нарушения, потеря зрения и кома.

Точных данных о смертельных дозах нет. В одном случае прием 1.4 г привело к летальному исходу, а в другом пациент выжил после приема 15 г дапсона.

Терапия при передозировке.

Необходимо сделать промывание желудка (проводить всегда). После чего следует принять активированный уголь и возможно слабительное в течение нескольких дней (40 мл 20-40% раствора сорбитола).

Для усиления выведения сульфона и профилактики почечной недостаточности проводят инфузионную терапию (введение достаточных количеств жидкости с диуретиками и натрия гидрокарбонатом для подщелачивания мочи).

Лечение метгемоглобинемии проводят введением метиленового синего 1% 0.2 мл/кг в/в и/или витамина С (2 г/д).

В случае сильной передозировки показан ранний гемодиализ, вливание эритроцитарной массы или переливание крови. Кислородотерапия или искусственное дыхание при контроле рО₂. Симптоматическая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При необходимости применения дапсона при беременности следует соотнести предполагаемую пользу для матери и возможный риск для плода. В первые 4 месяца беременности и в период лактации препарат следует назначать только в случае крайней необходимости с соблюдением особой осторожности. Поскольку дапсон секретируется в грудное молоко, женщинам, принимающим препарат, следует отказаться от кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Дапсон увеличивает эффективность изониазида, протионамида и рифампицина, что позволяет снизить их дозы, особенно протионамида. Рифампицин увеличивает плазменный клиренс дапсона и понижает уровень дапсона в 7-10 раз.

При одновременном использовании с пробенецидом отмечается уменьшение экскреции дапсона и увеличение его

концентрации в крови.

Пириметамин может изменять некоторые фармакокинетические параметры дапсона (V_d , C_{max} препарата в плазме и слюне).

Прием циметидина и умеренное употребление алкоголя не оказывают влияние на всасывание дапсона.

Триметаприм влияет на уровень дапсона и наоборот.

Особые указания и меры предосторожности:

Если при приеме препарата наблюдается появление кожной сыпи, прием препарата следует немедленно прекратить и тотчас же обратиться к врачу. С осторожностью применять дапсон у пациентов с недостаточностью глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы (Г6ФДГ), так как в этом случае существенно возрастает риск развития побочных эффектов. В чрезвычайном случае необходимо попытаться ограничиться половиной обычной рекомендованной дозы.

Необходимо регулярно проводить динамический контроль за состоянием крови (клинические анализы крови в начале терапии еженедельно, а через несколько месяцев ежемесячно). В случае значительного снижения уровня лейкоцитов, тромбоцитов или гемопоеза лечение дапсоном следует прервать. Следует учитывать, что побочные эффекты со стороны крови обычно более выражены у пожилых пациентов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Влияние препарата на способность водить автомобиль и управлять механизмами маловероятно.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых заболеваниях печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте

Препарат нельзя применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Dapson-Fatol>