Метилдопа

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки от белого до серовато-белого цвета, круглые, двояковыпуклые; допускается наличие мраморности.

	1 таб.
метилдопы сесквигидрат	282 мг
что соответствует содержанию метилдопы	250 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 40 мг, коповидон - 10.5 мг, повидон K - 5.25 мг, тальк - 5.25 мг, стеариновая кислота - 3.5 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1.75 мг, магния стеарат - 1.75 мг.

50 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство центрального действия. Образующийся в ЦНС метаболит метилдопы альфа-метилнорадреналин стимулирует постсинаптические α-адренорецепторы нейронов продолговатого мозга, что приводит к торможению сосудодвигательного центра и уменьшению нисходящей симпатической импульсации. Оказывает гипотензивное действие главным образом вследствие снижения ОПСС и, в определенной степени, уменьшения сердечного выброса и ЧСС. Увеличивает СКФ и почечный кровоток. Вызывает седативный эффект.

Фармакокинетика

При приеме внутрь всасывание из ЖКТ характеризуется вариабельностью и в среднем составляет 50%. Связывание с белками низкое, менее 20%. В центральных адренергических нейронах превращается в альфа-метилнорадреналин. В печени метаболизируется с образованием сульфатного конъюгата.

$T_{1/2}$ альфа-метилнорадреналина составляет 1.7 ч, при анурии - 3.6 ч. Выводится почками. Около 70% всосавшегося активного вещества выводится с мочой в виде моно-О-сульфатного метаболита и в неизмененном виде. Невсосавшаяся часть активного вещества выводится через кишечник.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Гипертензия

Противопоказания:

Острые заболевания печени, нарушения функции печени, выраженные нарушения функции почек, коллагеновые и аллергические заболевания, паркинсонизм, депрессия, феохромоцитома, выраженный коронарный и церебральный атеросклероз, одновременный прием этанола и средств, вызывающих угнетение ЦНС, повышенная чувствительность к метилдопе.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь для взрослых начальная доза - по 250 мг 2-3 раза/сут. Каждые 2-3 дня разовую дозу увеличивают на 125 мг до достижения оптимального гипотензивного эффекта, который обычно наблюдается при суточной дозе 1 г. Для уменьшения выраженности седативного эффекта сначала увеличивают вечернюю дозу. При достижении стабильного гипотензивного эффекта дозу постепенно уменьшают до минимально эффективной. При нарушениях функции почек необходимо уменьшить разовую дозу.

Для детей начальная доза 10 мг/кг/сут в 2-4 приема.

Максимальные суточные дозы: при приеме внутрь для взрослых - 2 г, для детей - 65 мг/кг.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, брадикардия, периферические отеки, покраснение верхней половины туловища; редко - миокардит, перикардит.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, рвота, диарея, нарушения функции печени, повышение активности печеночных трансаминаз, желтуха.

Со стороны ЦНС: сонливость, вялость, заторможенность, синдром паркинсонизма, пошатывание при ходьбе, головная боль, головокружение.

Со стороны системы кроветворения: редко - гемолитическая анемия, лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, артралгия.

Со стороны эндокринной системы: гинекомастия, гиперпролактинемия, галакторея.

Аллергические реакции: лихорадка, кожная сыпь, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны репродуктивной системы: аменорея, импотенция, снижение либидо.

Прочие: заложенность носа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и хорошо контролируемых исследований безопасности применения метилдопы при беременности не проводилось. Метилдопа проникает через плацентарный барьер.

Метилдопа выделяется с грудным молоком, в связи с этим при необходимости применения в период лактации следует тщательно взвесить соотношение предполагаемой пользы терапии для матери и потенциального риска для ребенка.

В *экспериментальных исследованиях* не выявлено неблагоприятного действия на плод.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами возможна ортостатическая гипотензия.

Существует вероятность развития артериальной гипертензии, которую вызывает образующийся из метилдопы альфа-метилнорадреналин при воздействии на неблокированные альфа-адренорецепторы сосудов и сердца.

При одновременном применении с гормональными контрацептивами для приема внутрь возможно уменьшение антигипертензивного действия метилдопы.

При одновременном применении с ингибиторами МАО возможны как артериальная гипотензия, так и выраженная гипертензия с психомоторным возбуждением.

При одновременном применении со средствами для наркоза (в т.ч. с фторотаном, тиопенталом натрия, эфиром для наркоза) возможен коллапс.

При одновременном применении с транквилизаторами возможно усиление антигипертензивного действия.

При одновременном применении с трициклическими антидепрессантами возможно уменьшение антигипертензивного действия и появление тахикардии, возбуждения, головных болей.

При одновременном применении с индометацином, другими НПВС, анорексигенными препаратами (за исключением фенфлурамина), симпатомиметиками уменьшается антигипертензивное действие метилдопы.

При одновременном применении с галоперидолом возможны седативное действие, депрессия, деменция, спутанность сознания, головокружение.

При одновременном применении с дигоксином возможна брадикардия.

При одновременном применении с железа сульфатом, железа глюконатом уменьшается эффективность метилдопы.

При одновременном применении с леводопой возможно усиление противопаркинсонического действия, обусловленное торможением периферической допа-декарбоксилазы в результате действия метилдопы, что приводит к повышению концентрации леводопы в ЦНС. Кроме того, наблюдается аддитивный гипотензивный эффект.

Имеются сообщения о развитии интоксикации литием при одновременном применении с лития карбонатом.

При одновременном применении с трифлуоперазином описан случай парадоксального повышения АД.

При одновременном применении с фенфлурамином усиливается антигипертензивное действие метилдопы.

При одновременном применении с хлорпромазином усиливается антигипертензивное действие.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при гепатите, острой левожелудочковой недостаточности в анамнезе, диэнцефальном синдроме. Метилдопу не следует применять одновременно с ингибиторами МАО и с леводопой.

У больных с нарушениями функции почек суточную дозу метилдопы уменьшают. При применении у больных пожилого и старческого возраста суточную дозу следует повышать строго постепенно, т.к. возможно резкое снижение АД.

Необходимо учитывать, что после отмены метилдопы гипотензивный эффект относительно быстро прекращается, повышение АД происходит обычно в течение 48 ч.

В процессе лечения необходимо контролировать функцию печени и картину периферической крови. Моча больных, получающих метилдопу, при стоянии приобретает темный цвет. При длительном (более 6 мес) приеме метилдопы в суточной дозе более 1 г возможен положительный прямой тест Кумбса. При появлении положительного прямого теста Кумбса необходимо сначала определить, имеет ли место гемолитическая анемия. При анемии метилдопу следует отменить. Картина крови может нормализоваться самостоятельно, иногда требуется применение ГКС.

В период лечения не рекомендуется употребление алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, принимающим метилдопу, следует воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания, быстрых психомоторных реакций.

Источник: http://drugs.thead.ru/Metildopa