

Metildopa

Ethical

COMPOSICION

Cada comprimido contiene:

Metildopa anhidra 250 mg y 500 mg, respectivamente
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Reduce la presión arterial tanto en decúbito como de pie. Usualmente produce importantes reducciones de la presión arterial en decúbito con raros casos de hipotensión sintomática postural. La hipotensión durante el ejercicio y las variaciones de la presión arterial diurna ocurren raramente.

La disminución máxima de la presión arterial ocurre cuatro a seis horas después de la administración por vía oral.

Una vez que se ha llegado a una dosificación eficaz, la mayoría de los pacientes presentan una respuesta suave de la presión en 12 a 24 horas. Al suspender la administración, la presión arterial suele volver a sus valores anteriores al tratamiento en 24 a 48 horas.

No tiene ningún efecto directo sobre la función cardíaca y generalmente no reduce el índice de filtración glomerular, el flujo sanguíneo renal ni la fracción de filtración.

Usualmente se mantiene el gasto cardíaco sin aceleración del corazón y en algunos pacientes disminuye la frecuencia cardíaca.

Durante el tratamiento puede disminuir la actividad normal o elevada de la renina plasmática.

FARMACOCINETICA

Su absorción muestra amplias variaciones individuales. En dos estudios, su biodisponibilidad varió entre 8% y 62%. Es metabolizada extensamente.

Sus metabolitos urinarios conocidos son: mono-0-sulfato de alfa-metildopa, 3-0-metil-alfa-metildopa, 3,4-dihidroxifenil-acetona, alfa-metildopamina, 3-0-metil-alfa-metildopamina y sus conjugados.

Aproximadamente, 70% del medicamento absorbido en forma oral es excretado en la orina como metildopa y su conjugado mono-0-sulfato. Su depuración renal es de alrededor de 130 mL/minuto en las personas sanas, y está disminuida en la insuficiencia renal. La semivida plasmática es de 105 minutos. Después de su administración por vía oral, su excreción es prácticamente completa en 36 horas.

TOXICOLOGIA

No se observaron efectos tumorigénicos ni mutagénicos.

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Hipertensión arterial (leve, moderada o intensa).

CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en pacientes:

Con enfermedad hepática activa, como hepatitis aguda o cirrosis activa.

Con hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de este producto, incluyendo trastornos hepáticos asociados con la administración previa de esta sustancia (ver PRECAUCIONES).

Bajo terapia con inhibidores de la monoaminoxidasa (MAO).

EFFECTOS INDESEABLES

Al principio del tratamiento o cuando se aumenta la dosificación puede ocurrir sedación, generalmente transitoria. También pueden aparecer cefalea, astenia o debilidad como síntomas tempranos, pero pasajeros.

Los efectos colaterales importantes han sido poco frecuentes; generalmente este producto es bien tolerado.

PRECAUCIONES

En raros casos, durante el tratamiento ha aparecido anemia hemolítica adquirida. Si los síntomas indican la posibilidad de una anemia, se deben medir la hemoglobina y/o el hematocrito. Si hay anemia, se deben hacer los estudios de laboratorio apropiados para determinar si existe hemólisis. La presencia de anemia hemolítica es una indicación para interrumpir la administración del medicamento. La sola suspensión del tratamiento o la administración de corticosteroides produce generalmente una rápida remisión de la anemia. En raros casos, sin embargo, ha fallecido el paciente.

En algunos pacientes bajo tratamiento prolongado con ese medicamento se vuelve positiva la prueba de Coombs directa. La frecuencia con que diferentes investigadores han encontrado positiva la prueba de Coombs ha sido, en promedio, del 10 al 20%. Raramente se encuentra una prueba de Coombs positiva durante los seis primeros meses de tratamiento, y si no aparece en un término de 12 meses es improbable que lo haga al seguir administrando el medicamento.

En raras ocasiones se ha observado una reducción reversible del número de leucocitos, que afecta principalmente a los granulocitos.

Ocasionalmente, ha aparecido fiebre dentro de las tres primeras semanas de la administración. En algunos casos la fiebre se ha acompañado de eosinofilia o de anomalías en una o más de las pruebas de funcionamiento hepático. También puede aparecer ictericia con o sin fiebre, generalmente en los primeros dos o tres meses de tratamiento. En algunos pacientes, los datos anormales concuerdan con los de una colestasis. Ha habido raros casos de necrosis hepática mortal. La biopsia de hígado practicada en varios de los pacientes con disfunción hepática mostró una necrosis focal microscópica compatible con hipersensibilidad al medicamento. Se deben hacer pruebas de funcionamiento hepático, recuento de leucocitos y cuenta diferencial de éstos periódicamente durante las primeras seis a doce semanas de tratamiento, o cuando aparezca fiebre sin causa aparente. Si aparecen fiebre, anomalías de las pruebas de funcionamiento hepático o ictericia, se debe suspender el tratamiento. Cuando han estado relacionadas con ésta, la fiebre y las anomalías del funcionamiento hepático han desaparecido al interrumpir la administración del medicamento. No se debe volver a administrar a esos pacientes. Se debe usar con precaución en pacientes con antecedentes de enfermedad o disfunción hepática.

USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA

Ha sido empleado bajo estrecha supervisión médica y obstétrica en el tratamiento de la hipertensión durante el embarazo, y no hubo ningún indicio clínico de que causara anomalías fetales o afectara al recién nacido.

COMPRIMIDOS

ANTIHIPERTENSIVO

Los reportes publicados sobre su uso durante todos los trimestres del embarazo, indican que si este medicamento se administra durante el embarazo, es remota la posibilidad de daño fetal. En los estudios clínicos, el tratamiento con este medicamento no se ha asociado con daño al desarrollo fetal. La mayoría de las mujeres de estos estudios se encontraban en el tercer trimestre de su embarazo cuando la terapia fue iniciada.

Atraviesa la barrera placentaria y aparece en la sangre del cordón umbilical.

Aunque no se ha registrado ningún efecto teratogéno evidente, no se puede excluir la posibilidad de causar algún daño al feto. Su empleo en mujeres que pueden embarazarse o que están amamantando, requiere comparar los beneficios que se piensa obtener con los posibles riesgos. Aparece en la leche materna. Por ello, se recomienda precaución si se administra a una madre lactante.

INTERACCIONES

Litio: Si se administran al mismo tiempo con litio, se debe vigilar cuidadosamente la aparición de síntomas de toxicidad del litio.

Otros medicamentos antihipertensivos: Cuando se emplea en combinación con otros fármacos antihipertensivos se puede potenciar la acción antihipertensiva. Se debe vigilar cuidadosamente a esos pacientes para detectar reacciones colaterales o manifestaciones poco comunes de idiosincrasia medicamentosa.

Hierro: Varios estudios han demostrado que disminuye la biodisponibilidad de esta sustancia cuando se ingiere con sulfato ferroso o gluconato de hierro. Esto puede afectar el control de la presión arterial en los pacientes tratados con esta sustancia.

Inhibidores de la monoaminoxidasa (ver CONTRAINDICACIONES).

SOBREDOSIS

La sobredosificación aguda puede producir hipotensión aguda y otras respuestas atribuibles a disfunción cerebral y gastrointestinal (sedación excesiva, debilidad, bradicardia, mareo, aturdimiento, estreñimiento, distensión abdominal, meteorismo, diarrea, náusea, vómito).

En caso de sobredosificación se deben aplicar medidas sintomáticas y de sostén. Si la ingestión ha sido reciente, el lavado gástrico o el vómito pueden disminuir la absorción.

Si ha pasado más tiempo desde la ingestión, la administración de soluciones intravenosas puede ayudar a aumentar la excreción urinaria. El tratamiento incluye también la atención especial de la frecuencia y el gasto cardíaco, el volumen sanguíneo, el balance de electrolitos, el íleo paralítico, la función urinaria y la actividad cerebral.

Puede estar indicada la administración de medicamentos simpaticomiméticos, como levarterenol, epinefrina. Es dializable.

USO Y DOSIS

Adultos: La dosis inicial usual es de 250 mg dos o tres veces al día, durante las primeras 48 horas. Después, se puede aumentar o disminuir la dosis diaria, de preferencia a intervalos no menores de dos días, hasta obtener una respuesta adecuada. La dosis diaria máxima recomendada es de 3 g. Muchos pacientes experimentan sedación durante dos o tres días al iniciar el tratamiento o al aumentar la dosificación. Por consiguiente, al aumentar la dosis, puede ser recomendable aumentar primero la dosis de la noche.

Niños: La dosis inicial es de 10 mg/kg de peso corporal al día, distribuidos en dos a cuatro dosis. Después se aumenta o se disminuye la dosis diaria hasta obtener una respuesta adecuada. La dosis máxima es de 65 mg/kg o de 3.0 g al día (la que resulte menor).

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C, proteger de la luz.

PRESENTACION

Caja conteniendo 5 tirillas de 6 comprimidos.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

NUMEROS DE REGISTRO SANITARIO

Comprimidos de 250 mg: 2012-0087

Comprimidos de 500 mg: 2012-0088

Registro Industrial No. 14109

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana.