Эбрантил (раствор)



Код АТХ:

- C02CA06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Урапидил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
урапидила гидрохлорид	5.47 мг	27.35 мг,
что соответствует содержанию урапидила	5 мг	25 мг

Вспомогательные вещества: пропиленгликоль, натрия гидрофосфата дигидрат, натрия дигидрофосфата дигидрат, вода д/и.

5 мл - ампулы (5) - упаковки контурные ячейковые пластиковые (1) - пачки картонные.

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
урапидила гидрохлорид	5.47 мг	54.7 мг,
что соответствует содержанию урапидила	5 мг	50 мг

Вспомогательные вещества: пропиленгликоль, натрия гидрофосфата дигидрат, натрия дигидрофосфата дигидрат, вода д/и.

10 мл - ампулы (5) - упаковки контурные ячейковые пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат. Альфа$_1$-адреноблокатор. Эбрантил блокирует постсинаптические α_1-адренорецепторы, благодаря чему снижается периферическое сопротивление. Кроме того, Эбрантил регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса и обладает слабым бета-адреноблокирующим действием. ЧСС, сердечный выброс при его введении не меняются. Низкий сердечный выброс может повышаться за счет снижения сосудистого сопротивления. Ортостатических явлений, как правило, Эбрантил не вызывает. Эбрантил блокирует вазоконстрикцию, вызываемую α_2-адренорецепторами, и не вызывает рефлекторной тахикардии, обусловленной вазодилатацией.

Эбрантил сбалансированно снижает систолическое и диастолическое АД, уменьшая периферическое сопротивление и не вызывает рефлекторной тахикардии.

Урапидил снижает пред- и постнагрузку на сердце, повышает эффективность сердечного сокращения, тем самым, при отсутствии аритмии, препарат увеличивает сниженный минутный объем сердца.

Эбрантил имеет центральный и периферический механизмы действия. Преимущественно блокирует периферические постсинаптические α_1-адренорецепторы, таким образом, препарат блокирует сосудосуживающее действие катехоламинов. В ЦНС урапидил влияет на активность сосудодвигательного центра, что проявляется в предотвращении рефлекторного увеличения (или снижения) тонуса симпатической нервной системы.

Урапидил не влияет на показатели углеводного обмена, обмен мочевой кислоты и не вызывает задержки жидкости в организме.

Фармакокинетика

Распределение

После в/в введения 25 мг урапидила наблюдается двухфазное снижение концентрации препарата: сначала - быстрое снижение (α-фаза), а затем - медленное (β-фаза).

Период распределения препарата составляет около 35 мин. V_d - 0.8 л/кг (0.6-1.2 л/кг).

Связывание с белками плазмы крови - 80%. Относительно низкая степень связывания с белками плазмы крови объясняет то, что неизвестно возможное взаимодействие урапидила с лекарственными средствами, сильно связывающимися с белками плазмы крови.

Урапидил проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры.

Метаболизм

Большая часть урапидила метаболизируется в печени. Основной метаболит - гидроксилированное производное в 4-м положении бензольного кольца, которое практически не обладает антигипертензивной активностью.

О-деметилированный метаболит образуется в очень малых количествах и практически так же активен, как урапидил.

Выведение

50-70% урапидила и его метаболитов (15% в виде активного препарата) выводится почками, остальное выводится через кишечник в виде метаболитов (в основном в виде неактивного п-гидроксилированного урапидила).

$T_{1/2}$ после в/в болюсного введения составляет 2.7 ч (1.8-3.9 ч).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов, а также у пациентов с тяжелой печеночной и/или почечной недостаточностью V_d и клиренс урапидила снижены, а $T_{1/2}$ увеличен.

Показания к применению:

— гипертонический криз;

— рефрактерная артериальная гипертензия;

— тяжелая степень артериальной гипертензии;

— управляемая артериальная гипотензия во время и/или после хирургической операции.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипертонический криз
- Гипертония
- Гипотензия

Противопоказания:

— аортальный стеноз;

— открытый боталлов проток;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— беременность (эффективность и безопасность не установлены);

— период лактации (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста, а также при нарушении функции печени и/или почек, гиповолемии.

Способ применения и дозы:

Эбрантил вводят в/в струйно или путем длительной инфузии (пациент должен находиться в положении лежа).

При *гипертоническом кризе, тяжелой степени артериальной гипертензии, рефрактерной гипертензии* препарат вводят в дозе 10-50 мг в/в медленно под контролем АД. Снижение АД ожидается в течение 5 мин после введения. В зависимости от терапевтического эффекта возможно повторное введение препарата Эбрантил.

В/в капельная или непрерывная инфузия проводится с помощью перфузионного насоса. Поддерживающая доза - в среднем 9 мг/ч, т.е. 250 мг препарата Эбрантил (10 амп. по 5 мл или 5 амп. по 10 мл) в 500 мл раствора для инфузий (1 мг = 44 капли = 2.2 мл). Максимальное допустимое соотношение - 4 мг препарата Эбрантил на 1 мл раствора для инфузий. Рекомендуемая максимальная начальная скорость - 2 мг/мин. Скорость капельного введения зависит от показателей АД пациента.

Раствор для капельной инфузий, предназначенный для поддержания АД, готовится следующим образом: 250 мг препарата (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) добавляют к 500 мл раствора для инфузий, например, физиологического раствора, 5% или 10% раствора декстрозы (глюкозы).

Если для введения поддерживающей дозы используется перфузионный насос, то 100 мг препарата (4 ампулы по 5 мл или 2 ампулы по 10 мл) вводят в шприц перфузионного насоса и разводят до 50 мл физиологическим раствором, 5% или 10% раствором декстрозы (глюкозы).

Для *управляемого (контролируемого) снижения АД при его повышении во время и/или после хирургической операции* препарат Эбрантил вводят в/в в дозе 25 мг. Снижение АД ожидается в течение 2 мин после введения. Далее проводят стабилизацию АД с помощью инфузии (начальная доза до 6 мг в 1-2 мин, затем дозу уменьшают).

Если этого не происходит, т.е. АД не изменяется, то через 2 мин проводят повторную в/в инъекцию препарата Эбрантил в дозе 25 мг. Снижение АД ожидается в течение 2 мин после введения. Далее проводят стабилизацию АД с помощью инфузии (начальная доза до 6 мг в 1-2 мин, затем дозу уменьшают).

Если этого не происходит, т.е. АД не изменяется, то через 2 мин осуществляют медленное в/в введение препарата Эбрантил в дозе 50 мг. АД уменьшается через 2 мин. Далее проводят стабилизацию АД с помощью инфузии (начальная доза до 6 мг в 1-2 мин, затем дозу уменьшают).

Непрерывная инфузия с помощью перфузионного насоса или капельная инфузия используется для поддержания АД на достигнутом с помощью в/в введения уровне.

Если ранее использовались другие гипотензивные средства, то Эбрантил, можно вводить только через промежуток времени, достаточный, чтобы подействовал(и) ранее введенный(е) препарат(ы). Дозу препарата Эбрантил следует соответственно скорректировать.

При использовании гипотензивных средств у **пожилых пациентов** необходимо соблюдать осторожность. Начальная доза должна быть снижена по сравнению с рекомендуемой, поскольку чувствительность у пожилых пациентов к препаратам такого ряда часто изменена (V_d снижен, а $T_{1/2}$ увеличен).

Введение препарата может быть однократным или многократным. Инъекционное введение препарата можно сочетать с последующей капельной инфузией. Парентеральную терапию можно повторить при новом повышении АД.

Побочное действие:

Большинство из следующих побочных эффектов обусловлены резким уменьшением АД, однако, опыт клинического применения показывает, что они исчезают в течение нескольких минут, даже после проведения капельной инфузии препарата Эбрантил. При тяжелых побочных эффектах может потребоваться прекращение лечения.

Оценка частоты побочных эффектов проводится по следующей шкале: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - сердцебиение, тахикардия, брадикардия, чувство сдавления в груди, одышка, аритмии.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота; нечасто - рвота.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - тромбоцитопения*.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, головная боль, утомляемость; очень редко - чувство беспокойства.

Со стороны половой системы: редко - приапизм.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - протеинурия; редко - нефропатия, нефротический синдром.

Дерматологические реакции: нечасто - повышенное потоотделение; редко - кожный зуд, гиперемия, экзантема.

* - в очень редких, отдельных случаях, наблюдалось уменьшение количества тромбоцитов при применении урапидила. Частота тромбоцитопении зависела от применения препарата. Однако невозможно было установить какую-либо причинную связь с терапией препаратом Эбрантил, например, посредством иммуногематологических исследований.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, ортостатический коллапс, утомляемость, заторможенность.

Лечение: при резком уменьшении АД необходимо поднять пациенту ноги и начать инфузионную терапию для увеличения ОЦК. При неэффективности этих мер можно начать инфузию вазоконстрикторов, под контролем АД. В очень редких случаях необходимо в/в введение катехоламинов (0.5-1.0 мг эпинефрина (адреналина), разведенного в 10 мл физиологического раствора).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации, т.к. эффективность и безопасность его применения в эти периоды не установлены.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Гипотензивное действие урапидила может усиливаться при совместном приеме с альфа-адреноблокаторами или другими антигипертензивными средствами, а также при гиповолемии (тошнота, рвота) и при приеме этанола.

При одновременном приеме циметидина C_{max} урапидила в плазме крови может увеличиваться на 15%.

Особые указания и меры предосторожности:

Возможно одновременное применение с другими применяемыми внутрь антигипертензивными средствами.

Использование в педиатрии

Нет клинических данных о применении препарата у **детей и подростков до 18 лет**.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушении функции почек.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам при нарушении функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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