Урапидил Карино



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство. Обладает центральным и периферическим действием. Блокирует постсинаптические α_1-адренорецепторы, благодаря чему снижается ОПСС. Регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса за счет стимуляции серотониновых 5-НТ1А-рецепторов сосудодвигательного центра (предотвращает рефлекторное увеличение тонуса симпатической нервной системы). ЧСС, сердечный выброс не меняются. Низкий сердечный выброс может повышаться за счет снижения ОПСС. Ортостатических явлений не вызывает. Стимулирует пресинаптические α_2-адренорецепторы.

Снижает систолическое и диастолическое АД, уменьшая ОПСС, не вызывает рефлекторной тахикардии. Снижает пред- и постнагрузку на сердце, повышает эффективность сердечного сокращения, таким образом (при отсутствии аритмии) увеличивает сниженный минутный объем сердца.

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

Фармакокинетика

После в/в введения 25 мг наблюдается двухфазное снижение концентрации: сначала - быстрое (α-фаза), затем - медленное (β-фаза) снижение. Период распределения урапидила составляет 35 мин, V_d - 0.8 л/кг (0.6-1.2 л/кг). Связывание с белками плазмы - 80%. Метаболизируется в печени. Основной метаболит - гидроксилированное производное (в 4 положении бензольного кольца), не обладает гипотензивной активностью. О-деметилированный метаболит образуется в очень малых количествах и также активен, как урапидил. $T_{1/2}$ (после в/в болюсного введения) - 2.7 ч (1.8-3.9 ч). Выводится почками - 50-70% в виде неизмененного вещества и 15% - в виде метаболитов; через кишечник - в виде метаболитов (в основном в виде неактивного n-гидроксилированного урапидила). У пациентов пожилого возраста и при тяжелой печеночной и/или почечной недостаточности V_d и клиренс снижены, а $T_{1/2}$ увеличен. Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер.

Показания к применению:

Гипертонический криз, рефрактерная артериальная гипертензия, артериальная гипертензия III степени, управляемая артериальная гипотензия во время и/или после хирургической операции.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипотензия

Противопоказания:

Аортальный стеноз, открытый артериальный проток, беременность, период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к урапидилу.

Способ применения и дозы:

Вводят в/в струйно или капельно (длительно, в положении лежа).

При гипертоническом кризе, артериальной гипертензии III степени, рефрактерной артериальной гипертензии: в/в медленно 10-50 мг (под контролем АД; ожидаемое снижение АД в течение 5 мин), возможно повторное введение. В/в путем инфузии (капельно или непрерывно) с помощью перфузионного насоса. Поддерживающая доза (в среднем) - 9 мг/ч, т.е. 250 мг урапидила в 500 мл раствора для инфузий (1 мг = 44 капель = 2.2 мл). Максимально допустимое соотношение - 4 мг урапидила на 1 мл раствора для инфузий. Максимальная начальная скорость - 2 мг/мин (в зависимости от АД).

При управляемой артериальной гипотензии (во время и/или после хирургической операции): инфузия непрерывная (с помощью перфузионного насоса) или капельная для поддержания АД, достигнутого с помощью в/в введения. При в/в введении 25 мг: если АД снижается через 2 мин - переводят на инфузию (6 мг за 1-2 мин, затем дозу снижают); если АД не изменяется через 2 мин - повторно в/в 25 мг и при снижении АД через 2 мин - переводят на инфузию (6 мг за 1-2 мин, затем дозу снижают); если АД после повторной инъекции через 2 мин не меняется - в/в медленно 50 мг и затем, при снижении АД через 2 мин, переводят на инфузию (6 мг за 1-2 мин, затем дозу снижают). Если ранее применяли другие гипотензивные средства, то урапидил вводят спустя время, в течение которого должно подействовать ранее введенное средство. Дозу урапидила следует скорректировать.

У пациентов пожилого возраста начальную дозу следует уменьшить, по сравнению с рекомендуемой. Введение может быть однократным или многократным. Инъекции можно сочетать с последующей капельной инфузией. Терапию повторяют при повторном повышении АД.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - сердцебиение, тахикардия, брадикардия, чувство сдавления за грудиной, одышка, аритмии.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, иногда - рвота.

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

Дерматологические реакции: иногда - повышенное потоотделение.

Аллергические реакции: редко - кожный зуд, покраснение кожи, экзантема.

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

Со стороны половой системы: редко - приапизм.

Лабораторные показатели: очень редко - тромбоцитопения.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Другие гипотензивные средства, в т.ч. альфа-адреноблокаторы, этанол усиливают гипотензивный эффект урапидила.

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

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушением функции печени и/или почек, при гиповолемии, пожилого возраста.

Резкое падение АД исчезает в течение нескольких минут после прекращения введения урапидила.

Возможно одновременное применение с антигипертензивными средствами для приема внутрь.

При гиповолемии гипотензивный эффект урапидила усиливается.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушением функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушением функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста.

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