Вазапростан



Код АТХ:

- C01EA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Алпростадил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий в виде гигроскопичной массы белого цвета.

	1 амп.
алпростадил (клатратный комплекс с альфадексом)	20 мкг

Вспомогательные вещества: альфадекс (α-циклодекстрин), лактоза безводная.

Ампулы стеклянные (10) - пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий в виде гигроскопичной массы белого цвета.

	1 амп.
алпростадил (клатратный комплекс с альфадексом)	60 мкг

Вспомогательные вещества: альфадекс (α-циклодекстрин), лактоза безводная.

Ампулы стеклянные (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат простагландина E_1 (PG E_1). Улучшает микроциркуляцию и периферическое кровообращение, оказывает вазопротекторное действие.

При системном введении вызывает расслабление гладкомышечных волокон, оказывает сосудорасширяющее действие, уменьшает ОПСС без изменения АД. При этом отмечается рефлекторное увеличение сердечного выброса и ЧСС.

Способствует повышению эластичности эритроцитов, уменьшает агрегацию тромбоцитов и активность нейтрофилов, повышает фибринолитическую активность крови.

Оказывает стимулирующее действие на гладкую мускулатуру кишечника, мочевого пузыря, матки; подавляет секрецию желудочного сока.

Фармакокинетика

Применяется в комплексе с альфациклодекстрином в/в или в/а. Во время приготовления раствора комплекс препарата распадается на составные части - PG E_1 и альфациклодекстрин.

Всасывание

При в/в введении терапевтически значимая концентрация активного вещества достигается вскоре после начала введения препарата, а C_{max} в плазме крови достигается в течение 2 ч от начала введения.

Распределение

PG E_1 связывается с белками плазмы на 93%.

Метаболизм

Процесс биотрансформации PG E_1 происходит главным образом в легких, при "первом прохождении" через легкие метаболизируется 60-90% активного вещества с образованием основных метаболитов - 15-кето-PG E_1, 15-кето-PG E_0 и PG E_0.

Выведение

PG E_1 является эндогенным веществом с исключительно коротким $T_{1/2}$. Концентрация в плазме крови возвращается к исходному уровню через 10 сек после прекращения введения. Выводится в виде метаболитов с мочой (88%) и через ЖКТ (12%) в течение 72 ч.

$T_{1/2}$ альфациклодекстрина составляет около 7 мин, выводится с мочой в неизмененном виде.

Показания к применению:

— хронические облитерирующие заболевания артерий III и IV стадий (по классификации Фонтейна).

Противопоказания:

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— выраженные нарушения ритма сердца;

— обострение ИБС;

— перенесенный в последние 6 мес инфаркт миокарда;

— отек легких;

— инфильтративные заболевания легких;

— хронические обструктивные заболевания легких;

— дисфункция печени (повышение уровня АСТ, АЛТ, ГГТ);

— заболевания печени в анамнезе;

— заболевания, сопровождающиеся повышенным риском возникновения кровотечений (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, тяжелое поражение сосудов головного мозга, пролиферативная ретинопатия со склонностью к кровотечениям, обширная травма);

— сопутствующая терапия сосудорасширяющими и антикоагулянтными препаратами;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

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

— повышенная чувствительность к алпростадилу и другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать Вазапростан при артериальной гипотензии, сердечно-сосудистой недостаточности (обязателен контроль нагрузки объема раствора-носителя), пациентам, находящимся на гемодиализе (лечение следует проводить в постдиализном периоде), пациентам с сахарным диабетом 1 типа, особенно при обширных поражениях сосудов.

Способ применения и дозы:

Готовить раствор необходимо непосредственно перед выполнением инфузии. Лиофилизат растворяется сразу после добавления физиологического раствора. Вначале раствор может получиться молочно-мутным. Этот эффект создается за счет пузырьков воздуха и не имеет значения. Через короткое время раствор становится прозрачным.

Не допускается использование раствора, приготовленного более 12 ч назад.

Внутриартериальное введение

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий: 1 амп./20 мкг алпростадила

Для получения раствора для в/а введения содержимое 1 ампулы лиофилизата (соответствует 20 мкг алпростадила) следует растворить в 50 мл физиологического раствора. При отсутствии других предписаний половину ампулы Вазапростана (соответствует 10 мкг алпростадила) следует вводить в/а в течение 60-120 мин при помощи устройства для инфузии. При необходимости, особенно при наличии некрозов, под строгим контролем переносимости, дозу можно увеличить до 1 ампулы (20 мкг алпростадила). Эта доза обычно применяется для однократной ежедневной инфузии.

Если в/а введение препарата осуществляется через установленный катетер, в зависимости от переносимости и степени тяжести заболевания, рекомендуется доза 0.1-0.6 нг/кг/мин с введением препарата в течение 12 ч при использовании устройства для инфузий (соответствует $^{1}/_{4}$-$1^{1}/_{2}$ ампулам Вазапростана).

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий:1 амп./60 мкг алпростадила

Для получения раствора для в/а введения содержимое 1 ампулы лиофилизата (соответствует 60 мкг алпростадила) следует растворить в 50-250 мл физиологического раствора. При отсутствии других предписаний 1/6 ампулы Вазапростана (соответствует 10 мкг алпростадила) следует вводить в/а в течение 60-120 мин при помощи устройства для инфузии. При необходимости, особенно при наличии некрозов, под строгим контролем переносимости, дозу можно увеличить до 1/3 ампулы (20 мкг алпростадила). Эта доза обычно применяется для однократной ежедневной инфузии.

Если в/а введение препарата осуществляется через установленный катетер, в зависимости от переносимости и степени тяжести заболевания, рекомендуется доза 0.1-0.6 нг/кг/мин с введением препарата в течение 12 ч при использовании устройства для инфузий (соответствует $^{1}/_{12}$-$^{1}/_{2}$ ампулам Вазапростана).

Внутривенное введение

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий: 1 амп./20 мкг алпростадила

Для получения раствора для в/в введения содержимое 2 ампул лиофилизата (соответствует 40 мкг алпростадила) следует растворить в 50-250 мл физиологического раствора и вводить полученный раствор в/в в течение 2 ч. Эта доза применяется 2 раза/сут.

Либо содержимое 3 ампул (соответствует 60 мкг алпростадила) растворяют в 50-250 мл физиологического раствора и вводят в/в инфузионно в течение 3 ч 1 раз/сут.

Продолжительность лечения в среднем составляет 14 дней, при положительном эффекте лечение препаратом можно продолжить еще в течение 7-14 дней. При отсутствии положительного эффекта в течение 2 недель от начала лечения дальнейшее применение препарата следует прекратить.

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий:1 амп./60 мкг алпростадила

Для получения раствора для в/в введения содержимое 1 ампулы лиофилизата (соответствует 60 мкг алпростадила) следует растворить в 50-250 мл физиологического раствора и вводить полученный раствор в/в в течение 3 ч 1 раз/сут.

Продолжительность лечения в среднем составляет 14 дней, при положительном эффекте лечение препаратом можно продолжить еще в течение 7-14 дней. При отсутствии положительного эффекта в течение 2 недель от начала лечения дальнейшее применение препарата следует прекратить.

У **пациентов с почечной недостаточностью (сывороточный креатинин более 1.5 мг/дл)** в/в введение

Вазапростана необходимо начинать с 20 мкг (1 амп. 20 мкг или 1/3 амп. по 60 мкг) в течение 2 ч. При необходимости через 2-3 дня разовую дозу увеличивают до 40-60 мкг.

Для **пациентов с почечной и сердечной недостаточностью** максимальный объем вводимой жидкости - 50-100 мл/сут. Курс лечения - 4 недели.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, судорожный синдром, повышенная усталость, чувство недомогания, нарушение чувствительности кожи и слизистых оболочек.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, боли за грудиной, нарушения сердечного ритма, AV-блокада.

Со стороны пищеварительной системы: чувство дискомфорта в эпигастрии, тошнота, рвота, диарея.

Со стороны костно-мышечной системы: гиперостоз длинных трубчатых костей (при терапии более 4 недель).

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Местные реакции: эритема, отек, боль, нарушение чувствительности, флебит (проксимальнее места в/в введения).

Прочие: повышенное потоотделение, гипертермия, отечность конечности, в вену которой проводится инфузия.

*Лабораторные показатели: л*ейкоцитоз, лейкопения, увеличение титра С-реактивного белка, повышение уровня трансаминаз.

Редко: артралгии, спутанность сознания, судороги центрального генеза, лихорадка, озноб, брадипноэ, психоз, почечная недостаточность, анурия. Сообщалось о нескольких случаях развития отека легких и острой левожелудочковой недостаточности.

Крайне редко (до 1% случаев): шок, острая сердечная недостаточность, гипербилирубинемия, кровотечение, сонливость, брадипноэ, снижение функции дыхания, тахипноэ, анурия, нарушение функции почек, гипогликемия, фибрилляция желудочков, AV-блокада II степени, наджелудочковая аритмия, напряжение мышц шеи, повышенная раздражительность, гипотермия, гиперкапния, гиперемия кожных покровов, гематурия, перитонеальные симптомы, тахифилаксия, гиперкалиемия, тромбоцитопения, анемия.

Побочные эффекты, связанные с применением препарата или с самой процедурой катетеризации, обратимы после снижения дозы или прекращения инфузии.

Передозировка:

Симптомы: снижение АД, увеличение ЧСС, возможно развитие вазо-вагальных реакций (бледность кожных покровов, повышенное потоотделение, тошнота, рвота), что может сопровождаться ишемией миокарда и симптомами сердечной недостаточности; возможны боль, отек и покраснение ткани в месте инфузии.

Лечение: необходимо уменьшить дозу препарата или прекратить инфузию. При выраженном снижении АД больному в положении лежа необходимо приподнять ноги. При сохранении симптомов необходимо использовать симпатомиметики.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Вазапростана при беременности противопоказано.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Вазапростан может усиливать эффект гипотензивных средств, периферических вазодилататоров, антиангинальных препаратов.

При сочетанном применении Вазапростана с антикоагулянтами, ингибиторами агрегации тромбоцитов, цефамандолом, цефоперазоном, цефотетаном, тромболитиками повышается риск развития кровотечений.

При одновременном применении Вазапростана с эпинефрином (адреналином), норэпинефрином (норадреналином)

снижается вазодилатирующий эффект.

Необходимо учитывать, что взаимодействие возможно в том случае, если вышеперечисленные препараты применялись незадолго до того, как была начата терапия Вазапростаном.

Особые указания и меры предосторожности:

Вазапростан могут применять только врачи, имеющие опыт в ангиологии, знакомые с современными методами непрерывного контроля сердечно-сосудистой системы и имеющие для этого соответствующее оборудование.

При проведении терапии Вазапростаном следует контролировать АД, ЧСС, биохимические показатели крови, показатели свертываемости крови (при нарушениях свертывающей системы крови или при одновременной терапии препаратами, которые влияют на свертывающую систему).

В период лечения Вазапростаном во избежание появления симптомов гипергидратации у пациентов с почечной недостаточностью объем вводимой жидкости следует ограничить до 50-100 мл/сут. Необходимо динамическое наблюдение за состоянием пациента (контроль АД и ЧСС), при необходимости – контроль массы тела, баланса жидкости, измерение центрального венозного давления или проведение эхокардиографического исследования.

Пациенты с ИБС, периферическими отеками и нарушениями функции почек (сывороточный креатинин более 1.5 мг/дл) во время лечения Вазапростаном и в течение 1 дня после прекращения применения препарата должны находиться под наблюдением в стационаре.

Флебит (проксимальнее места введения), как правило, не является причиной для прекращения терапии, симптомы воспаления исчезают через несколько часов после прекращения инфузии или изменения места введения препарата. Специфического лечения в подобных случаях не требуется. Катетеризация центральной вены позволяет снизить частоту проявления данного побочного действия препарата.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Вазапростан может влиять на способность к активному участию в уличном движении, к вождению автотранспорта или управлению механизмами, особенно в начале лечения, при увеличении дозы и отмене препарата, а также при одновременном приеме алкоголя.

При нарушениях функции почек

У **пациентов с нарушениями функции почек (сывороточный креатинин более 1.5 мг/дл)** в/в введение Вазапростана необходимо начинать с 20 мкг в течение 2 ч. При необходимости через 2-3 дня дозу можно увеличить до 40-60 мкг.

Для пациентов с почечной и сердечной недостаточностью максимальный объем вводимой жидкости - 50-100 мл/сут. Продолжительность курса лечения - 4 недели.

В период лечения Вазапростаном во избежание появления симптомов гипергидратации у пациентов с почечной недостаточностью объем вводимой жидкости следует ограничить до 50-100 мл/сут. Необходимо динамическое наблюдение за состоянием пациента (контроль АД и ЧСС), при необходимости – контроль массы тела, баланса жидкости, измерение центрального венозного давления или проведение эхокардиографического исследования.

Пациенты с ИБС, периферическими отеками и нарушениями функции почек (сывороточный креатинин более 1.5 мг/дл) во время лечения Вазапростаном и в течение 1 дня после прекращения применения препарата должны находиться под наблюдением в стационаре.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при нарушениях функции печени (повышение уровня АСТ, АЛТ, ГГТ), заболеваниях печени в анамнезе.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

При повреждении ампулы лиофилизат становится влажным и клейким, сильно уменьшается в объеме. В этом случае использовать препарат нельзя.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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