

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Эрастил солофарм

Регистрационный номер: ЛП-007764

Торговое наименование: Эрастил солофарм

Международное непатентованное наименование: Урапидил

Лекарственная форма: раствор для внутривенного введения

Состав препарата на 1 мл:

Действующее вещество: Урапидила гидрохлорид	5,47 мг
Вспомогательные вещества: Пропиленгликоль	5,0 мг
Натрия гидрофосфата дигидрат	100,0 мг
Натрия дигидрофосфата дигидрат	0,42 мг
Вода для инъекций	2,22 мг до 1,0 мл

Описание
Прозрачный бесцветный или слегка желтоватый, или коричневатый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор

Код АТХ: С02СА06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Урапидил имеет центральный и периферический механизмы действия. Блокирует постсинаптические альфа-адренорецепторы, благодаря чему снижается общее периферическое сосудистое сопротивление (ОПСС). Регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса за счет стимуляции серотониновых 5-HT_{1A}-рецепторов сосудодвигательного центра (предотвращает рефлекторное увеличение тонуса симпатической нервной системы). Частота сердечных сокращений (ЧСС) и сердечный выброс не меняются. Низкий сердечный выброс может повышаться за счет снижения ОПСС.

Как правило урапидил не вызывает ортостатических реакций. Урапидил блокирует вазоконстрикцию, вызываемую альфа₂-адренорецепторами, и не вызывает рефлекторную тахикардию, обусловленную вазодилатацией. Преимущественно блокирует периферические постсинаптические альфа₂-адренорецепторы, таким образом, блокирует сосудосуживающее действие катехоламинов.

Кроме того, урапидил регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса и обладает слабым бета-адреноблокирующим действием.

Сбалансированно снижает систолическое и диастолическое артериальное давление (АД), уменьшая ОПСС, не вызывает рефлекторной тахикардии. Урапидил 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

Абсорбция и распределение

После внутривенного введения 25 мг урапидила наблюдается двухфазное снижение концентрации урапидила: сначала – быстрое снижение (альфа-фаза), затем – медленное (бета-фаза). Период распределения составляет 35 мин; объем распределения – 0,8 л/кг (0,6-1,2 л/кг). Связь с белками плазмы крови – 80%. Урапидил проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер.

Метаболизм

Урапидил в основном метаболизируется в печени. Его основной метаболит – гидроксильрованное производное (в 4-м положении бензольного кольца), не обладающее 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 количество – через кишечник в виде метаболитов (в основном в виде неактивного п-гидроксильрованного урапидила). Период полувыведения (T_{1/2}) после внутривенного введения болюсного введения составляет 2,7 ч (1,8-3,9 ч).

Особые группы пациентов

У пожилых пациентов и у пациентов с тяжелой печеночной и/или почечной недостаточностью объем распределения и клиренс снижены, а T_{1/2} – увеличен.

Показания к применению

Гипертензивный криз, рефрактерная и тяжелая степень артериальной гипертензии.

Управляемая артериальная гипотензия во время и/или после хирургической операции.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к урапидилу или любому из компонентов препарата;
- аортальный стеноз;
- коарктация аорты;
- артериовенозная фистула (за исключением гемодинамически неэффективного диализного анастомоза);
- открытый Боталлов проток;
- беременность и период грудного вскармливания;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью

- Нарушение функции печени и/или почек;

- сердечная недостаточность, вызванная нарушением механической функции сердца, (например, при стенозе аортального или митрального клапана, эмболии легочной артерии или нарушениях сердечной деятельности вследствие заболеваний перикарда (тампонада сердца, констриктивный перикардит));
- гиповолемия;
- одновременное применение с циметидином (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- одновременное применение с ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- пожилой возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата Эрастил солофарм противопоказано во время беременности и в период грудного вскармливания.

В экспериментальных исследованиях была продемонстрирована репродуктивная токсичность в отсутствие признаков тератогенности. В силу малочисленности данных исследований возможный риск для человека неизвестен.

Беременность

Клинические данные по применению во время первого и второго триместра беременности отсутствуют, данные о применении препарата в третьем триместре беременности ограничены. Урапидил проникает через плацентарный барьер.

Применение препарата Эрастил солофарм во время беременности противопоказано в связи с отсутствием адекватных данных о применении урапидила у беременных женщин.

Период грудного вскармливания

Отсутствуют сведения о том, выделяется ли урапидил в грудное молоко. Применение препарата Эрастил солофарм противопоказано в период грудного вскармливания. При необходимости применения препарата Эрастил солофарм в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Урапидил вводят внутривенно струйно или путем длительной внутривенной инфузии – в положении лежа.

Гипертензивный криз, рефрактерная и тяжелая степень артериальной гипертензии

Внутривенное струйное введение

Препарат Эрастил солофарм в дозе 10-50 мг вводят внутривенно, медленно, под постоянным контролем АД. Снижение АД ожидается в течение 5 минут после введения. В зависимости от терапевтического эффекта возможно повторное введение препарата.

Внутривенная капельная инфузия или непрерывная инфузия с помощью перфузионного насоса

Поддерживающая доза (в среднем) – 9 мг/ч, т. е. 250 мг препарата (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) растворяют в 500 мл раствора для инфузий (1 мг = 44 капли = 2,2 мл). Максимальное допустимое соотношение – 4 мг препарата Эрастил солофарм на 1 мл раствора для инфузий. Максимальная начальная скорость введения – 2 мг/мин (в зависимости от АД). Скорость капельного введения зависит от показателей АД пациента.

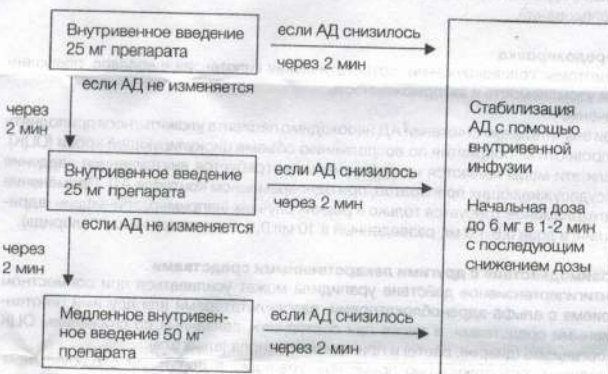
Раствор для капельной инфузии, предназначенный для поддержания АД, готовится следующим образом: обычно 250 мг препарата (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) добавляют к 500 мл раствора для инфузий, например, 0,9% раствора натрия хлорида, 5% или 10% раствора декстрозы (глюкозы).

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 0,9% раствором натрия хлорида, 5% или 10% раствором декстрозы (глюкозы).

Управляемая артериальная гипотензия во время и/или после хирургического вмешательства

Непрерывная инфузия с помощью перфузионного насоса или капельная инфузия применяется для поддержания АД на уровне, достигнутом с помощью внутривенного введения.

Схема дозирования



Примечания

Если ранее применялись другие гипотензивные лекарственные средства, то препарат Эрастил солофарм можно вводить только через промежуток вре-

мени, достаточный для того, чтобы действовал(и) ранее введенный(е) препарат(ы). Дозу препарата Эрастил солофарм следует соответственно скорректировать.

Препарат вводят внутривенно в виде инъекций или инфузий в положении пациента лежа на спине. Введение препарата может быть однократным или многократным. Инъекционное введение препарата можно сочетать с последующей капельной инфузией. Парентеральную терапию можно повторить при новом повышении АД.

Пожилые пациенты

При применении гипотензивных препаратов у пожилых пациентов необходимо соблюдать осторожность. Начальная доза должна быть снижена по сравнению с рекомендуемой, поскольку у пожилых пациентов часто наблюдается изменение чувствительности к препаратам данного фармакологического класса (объем распределения снижен, а $T_{1/2}$ увеличен).

Пациенты с нарушением функции печени и/или почек

У пациентов с нарушениями функции печени и/или почек может потребоваться снижение начальной дозы препарата по сравнению с рекомендованными дозами.

Длительность терапии

Терапия в течение 7 дней безопасна, но как правило, при парентеральном введении гипотензивных препаратов данный период превышать не следует.

При повторном повышении артериального давления возможно возобновление парентеральной терапии. Возможно начинать постоянную терапию гипотензивными препаратами для приема внутрь одновременно с неотложной парентеральной терапией.

Особые меры предосторожности при обращении

Препарат Эрастил солофарм нельзя смешивать со щелочными растворами для инъекций и инфузий (может привести к помутнению и образованию хлопьевидного осадка).

Препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами за исключением: 0,9 % раствора натрия хлорида для инфузий, 5 % или 10 % раствора декстрозы (глюкозы).

После вскрытия ампулы раствор препарата должен быть введен незамедлительно.

Побочное действие

Побочные действия систематизированы относительно каждой из систем органов в зависимости от частоты встречаемости с использованием классификации Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $<1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$); очень редко ($<1/10000$, включая единичные случаи), частота неизвестна (недостаточно данных для оценки частоты развития).

Большинство из перечисленных ниже побочных эффектов обусловлены резким падением АД, однако, опыт клинического применения показывает, что они исчезают в течение нескольких минут, даже после проведения капельной инфузии. При возникновении тяжелых побочных эффектов может потребоваться прекращение терапии.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко – тромбоцитопения*.

Нарушения со стороны психики: очень редко – возбужденное состояние (ощущение беспокойства).

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головокружение, головная боль, утомляемость.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто – ощущение сердцебиения, тахикардия, брадикардия, чувство сдавления или боли в груди (жалобы ангинозного характера), одышка, аритмия, снижение артериального давления при изменении положения тела, например, при переходе в вертикальное положение из положения лежа (ортостатическая гипотензия).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и среднего уха: нечасто – одышка, респираторный дистресс-синдром; редко – заложенность носа.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота; нечасто – рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – повышенное потоотделение; редко – аллергические реакции (кожный зуд, покраснение кожи, экзантема); частота неизвестна – ангионевротический отек, крапивница.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: часто – протеинурия; редко – нефропатия, нефротический синдром.

Нарушения со стороны половых органов и молочных желез: редко – приапизм. **Общие расстройства и реакции в месте введения препарата:** нечасто – повышенная утомляемость.

* Очень редко наблюдалось снижение количества тромбоцитов во время применения урапидила. Однако невозможно установить какую-либо причинную связь с терапией препаратом, например, посредством иммуногематологических исследований.

Передозировка

Симптомы: головокружение, ортостатическая гипотензия и коллапс, повышенная утомляемость и заторможенность.

Лечение

При значительном снижении АД необходимо пациента уложить, ноги приподнять и провести мероприятия по восполнению объема циркулирующей крови (ОЦК). Если эти меры являются неэффективными, требуется внутривенное введение сосудосуживающих препаратов, при одновременном контроле АД. Применение катехоламинов требуется только в редких случаях (например, эпинефрин (адреналин) в дозе 0,5-1,0 мг, разведенный в 10 мл 0,9 % раствора натрия хлорида).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Антигипертензивное действие урапидила может усиливаться при совместном приеме с альфа-адреноблокаторами, вазодилататорами или другими гипотензивными средствами, а также при состояниях, связанных со снижением ОЦК в организме (диарея, рвота) и при приеме этанола (алкоголя).

Следует с осторожностью применять урапидил в сочетании с баклофеном, поскольку баклофен может усилить антигипертензивное действие урапидила. При одновременном приеме циметидина максимальная концентрация урапидила в плазме крови может увеличиваться на 15 %, в связи с чем, необходимо рассмотреть возможность уменьшения дозы.

Не рекомендовано применение с ингибиторами АПФ, поскольку данных о такой комбинации пока недостаточно.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении урапидила с имипрамином и нейролептиками (антигипертензивное действие и риск ортостатической гипотензии), кортикостероидами (снижение антигипертензивного действия урапидила за счет задержки натрия и воды).

Особые указания

Возможно одновременное применение с другими гипотензивными средствами для приема внутрь.

Отсутствуют клинические данные о применении препарата у детей до 18 лет.

Если ранее применялись гипотензивные препараты, препарат Эрастил солофарм не должен применяться до тех пор, пока не прошло достаточно времени для развития эффекта от приема предыдущего(их) лекарственного(ых) препарата(-ов). Дозировка препарата Эрастил солофарм должна быть соответствующим образом снижена.

Повышение АД, которое часто наблюдается при нарушении мозгового кровообращения, не является показанием для экстренной гипотензивной терапии. Решение о применении препарата должно быть принято с учетом возможных острых угрожающих жизни осложнений из-за повреждения внутренних органов. Чрезмерно быстрое падение АД может вызвать брадикардию или остановку сердца.

У пациентов пожилого возраста применять с осторожностью и первоначально вводить в меньших дозах, так как чувствительность у пожилых пациентов выше или изменена к таким препаратам.

Пациентам, находящимся на контролируемой диете натрия, необходимо принимать во внимание, что препарат Эрастил солофарм, раствор для внутривенного введения, содержит натрий в количестве, не превышающем 1 ммоль (23 мг) в 5 мл препарата, и 2 ммоль (46 мг) в 10 мл препарата.

Возможны случаи развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4-х часов следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не была проведена незамедлительно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции.

Обезвоживание организма (гиповолемия), которое может быть вызвано обильной рвотой или диареей, приводит к усилению антигипертензивного действия препарата.

Вследствие наличия пропиленгликоля в составе препарата при его применении могут возникнуть симптомы, аналогичные таковым при приеме алкоголя.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Препарат может влиять на способность управления транспортными средствами и работать с механизмами, а также на занятия другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстрой психомоторных реакций. Это особенно актуально в начале лечения, при повышении дозы препарата или замене препарата. При появлении описанных нежелательных явлений следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного введения 5 мг/мл.

По 5 или 10 мл в ампулы из бесцветного стекла 1-го гидролитического класса с цветным кольцом разлома или с цветной точкой и насечкой. На ампулы может дополнительно наноситься одно, два или три цветных идентификационных кольца и/или двухмерный штриховой код, и/или буквенно-цифровая кодировка.

По 5 ампул в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или полиэтилентерефталатной с пленкой полимерной или фольгой алюминиевой лакированной, или без пленки полимерной и фольги алюминиевой лакированной, или в форме из картона с ячейками для укладки ампул.

По 1 контурной ячейковой упаковке или форме из картона вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным или без него в пачке из картона.

Условия хранения

В оригинальной упаковке (пачке картонной) при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по окончании срока годности!

Условия отпуска

Отпускается по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, г. Санкт-Петербург

Индустриальный проспект, д. 71, корп. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

Производитель/Организация, принимающая претензии

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, г. Санкт-Петербург

Индустриальный проспект, д. 71, корп. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

www.solopharm.com