

Урапидил Канон

Регистрационный номер: ЛПН-008131

Торговое наименование: Урапидил Канон

Международное непатентованное или группировочное наименование: урапидил

Лекарственная форма: раствор для внутривенного введения

Состав:

1 мл препарата содержит:

действующее вещество: урапидила гидрохлорид 5,47 мг, в пересчете на урапидил 5,00 мг;

вспомогательные вещества: динатрия гидрофосфат дигидрат 0,42 мг, натрия дигидрофосфат дигидрат 2,22 мг, пропиленгликоль 100,00 мг, вода для инъекций до 1 мл.

Описание: прозрачный бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор.

Код АТХ: C02CA06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Урапидил относится к препаратам, блокирующим постсинаптические альфа-1-адренорецепторы, благодаря чему снижается периферическое сопротивление. Кроме того, урапидил регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса и обладает слабым бета-адреноблокирующим действием. Частота сердечных сокращений (ЧСС) остается неизменной или рефлекторно незначительно увеличивается, сердечный выброс не меняется. Сердечный выброс, сниженный в результате увеличенной постнагрузки, может повышаться. Ортостатических явлений, как правило, урапидил не вызывает. Урапидил блокирует вазоконстрикцию, вызываемую альфа-2-адренорецепторами, и не вызывает рефлекторной тахикардии, обусловленной вазодилатацией.

Урапидил сбалансированно снижает систолическое и диастолическое артериальное давление (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.

Механизм действия

Урапидил имеет центральный и периферический механизмы действия. Преимущественно блокирует периферические постсинаптические альфа-1-адренорецепторы, таким образом, препарат блокирует сосудосуживающее действие катехоламинов.

В центральной нервной системе (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 внутривенного введения 25 мг урапидила наблюдается двухфазное снижение концентрации препарата (фаза начального распределения и терминального выведения).

Период распределения препарата имеет период полувыведения около 35 минут.

Объем распределения 0,8 л/кг (0,6 - 1,2 л/кг). Связь с белками плазмы крови *in vitro* - 80 %.

Метаболизм

Большая часть урапидила метаболизируется в печени.

Основной метаболит - гидроксированное 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.

Урапидил проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры.

Выведение

50-70% урапидила и его метаболитов (15% в виде фармакологически активного урапидила) выводится почками, остальное выводится через кишечник.

Период полувыведения после внутривенного болюсного введения составляет 2,7 ч. (1,8-3,9 ч.).

Особые группы пациентов

У пожилых пациентов, а также у пациентов с тяжелой печеночной и/или почечной недостаточностью объем распределения и клиренс урапидила снижены, а период полувыведения увеличен.

Показания к применению

Гипертонический криз, очень тяжелая и тяжелая степень артериальной гипертензии/рефрактерной гипертензии. Управляемая артериальная гипотензия в случае повышения артериального давления и гипертонического криза во время и/или после хирургической операции.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или вспомогательным компонентам препарата, аортальный стеноз, артериовенозная фистула (за исключением гемодинамически неактивного диализного шунта), возраст до 18 лет, беременность, период грудного вскармливания, применение у женщин с сохраненным детородным потенциалом, не использующую эффективную контрацепцию.

С осторожностью

- пожилой возраст;
- нарушение функции печени;
- гиповолемия (в связи с усилением гипотензивного эффекта урапидила);
- у пациентов с сердечной недостаточностью, причиной которой является нарушение механической функции (например, стеноз аортального или митрального клапана), при эмболии легочной артерии или нарушениях сердечной деятельности в результате заболеваний перикарда;

- одновременное применение с циметидином (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- одновременное применение с ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) (клинические данные одновременного применения с урапидилом ограничены);
- умеренная и тяжелая почечная недостаточность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Данные о влиянии применения препарата во время беременности отсутствуют или ограничены. Исследования на животных показали репродуктивную токсичность.

Урапидил Канон, раствор для внутривенного введения, не рекомендуется применять во время беременности. Урапидил не рекомендуется принимать женщинам с детородным потенциалом, не использующим эффективную контрацепцию.

Грудное вскармливание

Не известно, поступает ли урапидил или его метаболиты в грудное молоко. Риск для новорожденного/ ребенка не может быть исключен, поэтому препарат Урапидил Канон противопоказан в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические испытания по влиянию на мужскую и женскую фертильность не проводились. Исследования на животных показали, что урапидил влияет на фертильность, но применимость этих данных для человека не известна.

Способ применения и дозы

Для внутривенного применения.

Урапидил Канон вводят внутривенно струйно или путем длительной инфузии - лега.

Гипертонический криз, тяжелая или очень тяжелая степень артериальной гипертензии, рефрактерная гипертензия

1) Внутривенно: 10-50 мг препарата Урапидил Канон медленно вводят внутривенно под контролем артериального давления (АД). Снижение АД ожидается в течение 2-5 минут после введения. В зависимости от терапевтического эффекта возможно повторное введение препарата Урапидил Канон.

2) Внутривенная капельная или непрерывная инфузия с помощью перфузионного насоса. Поддерживающая доза: в среднем 9 мг/ч, т.е. 250 мг препарата Урапидил Канон (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) разводят в 500 мл раствора для инфузий (например, физиологический раствор, 5 или 10% раствор глюкозы).

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

Максимальное допустимое соотношение - 4 мг препарата Урапидил Канон на 1 мл раствора для инфузий (8 ампул по 5 мл или 4 ампулы по 10 мл разводят в 50 мл инфузионного раствора).

Скорость капельного введения зависит от показателей АД пациента. Рекомендуемая максимальная начальная скорость: 2 мг/мин.

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) Урапидил Канон добавляют к 500 мл раствора для инфузий, 1 мг соответствует 2,2 мл.

или

100 мг препарата (4 ампулы по 5 мл или 2 ампулы по 10 мл) Урапидил Канон добавляют к 30 мл раствора для инфузий в перфузионный шприц объемом 50 мл, 1 мг соответствует 0,5 мл.

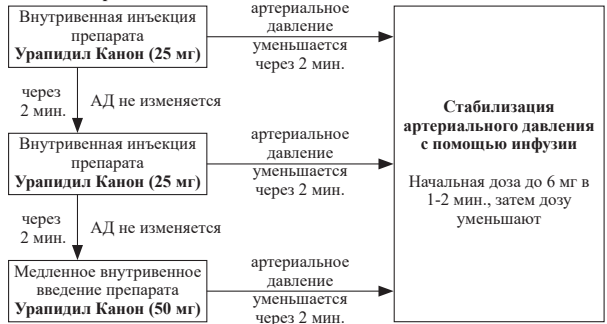
На снижение артериального давления влияет инфузионная доза первых 15 минут. Впоследствии отрегулированное кровяное давление может поддерживаться значительно меньшей дозой.

Поддерживающая доза: в среднем 9 мг/ч.

Управляемое (контролируемое) снижение артериального давления при его повышении во время и/или после хирургической операции.

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

Схема дозирования



Примечания

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

Пожилые пациенты

При применении 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.

Пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью и/или печеночной недостаточностью может возникнуть необходимость снижения дозы урапидила.

Дети

Безопасность и эффективность препарата у детей и подростков в возрасте до 18 лет не установлены.

Введение препарата может быть однократным или многократным. Возможны однократные или повторные инъекции и внутривенные капельные вливания. Инъекционное введение препарата можно сочетать с последующей капельной инфузией.

Период лечения 7 дней считается безопасным с токсикологической точки зрения и как правило, не превышает во время парентеральной гипотензивной терапии. Парентеральную терапию можно повторить при новом повышении артериального давления.

Лекарственный препарат нельзя смешивать с другими лекарственными препаратами.

Урапидил Канон можно смешивать только с физиологическим раствором или с раствором глюкозы 5 % или 10 %.

Побочное действие

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

Частота нежелательных реакций определялась в соответствии со следующей классификацией: очень часто ($\geq 1/10$); часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1/1,000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10,000$ до $< 1/1,000$); очень редко ($< 1/10,000$); частота неизвестна (не может быть подсчитана на основании имеющихся данных).

Очень часто	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы					
				тромбоцитопения	
Нарушения психики:					
		нарушения сна		беспокойство	
Нарушения со стороны нервной системы:					
	головокружение, головная боль				
Нарушения со стороны сердца:					
		ощущение сердцебиения, тахикардия, брадикардия, перебои в работе сердца, боль за грудиной (сходная со стенокардией), одышка			
Нарушения со стороны сосудов:					
		ортостатическая гипотензия			
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:					
			заложенность носа		
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:					
	тошнота	рвота, рвотные позывы, диарея, сухость во рту			
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей					
		повышенное потоотделение (гипергидроз)	гиперчувствительность, такие как кожный зуд, покраснение кожи, экзантема, ангио-невротический отек, крапивница		
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:					
				учащенное мочеиспускание и учащение случаев недержания мочи	
Нарушения со стороны половых органов и молочной железы:					
			приапизм		
Общие расстройства и нарушения в месте введения:					
		повышенная утомляемость			

Передозировка

Симптомы:

головокружение, ортостатическое снижение АД, коллапс, утомляемость, заторможенность.

Лечение:

При резком падении артериального давления необходимо пациенту придать горизонтальное положение, ноги приподнять и начать инфузионную терапию для увеличения объема циркулирующей крови. При неэффективности этих мер можно начать инфузию вазоконстрикторов, под контролем артериального давления. В очень редких случаях необходимо внутривенное введение катехоламинов (0,5 - 1,0 мг эпинефрина (адреналина), разведенного в 10 мл физиологического раствора).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Антигипертензивное действие урапидила может усиливаться при совместном приеме с альфа-адреноблокаторами, вазодилаторами или другими гипотензивными средствами (в т.ч. бета-адреноблокаторы и диуретики), а также при состояниях, связанных со снижением объема жидкости в организме (диарее, рвоте) и при приеме этанола (алкоголя).

При одновременном приеме циметидина концентрация урапидила в плазме крови может увеличиваться на 15%.

Не рекомендовано применение с ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента, поскольку данных о такой комбинации пока недостаточно. Не допускается смешивание урапидила для внутривенного введения с щелочными растворами для инъекций и инфузий, так как это может привести к помутнению раствора или образованию хлопьев вследствие кислотных свойств растворов для инъекций.

Особые указания

Если ранее назначались гипотензивные препараты, препарат Урапидил Канон следует принимать с осторожностью. Препарат не должен применяться до тех пор, пока не прошло достаточно времени для развития эффекта от приема предыдущего(-их) лекарственного(-ых) препарата(-ов). Дозировка препарата Урапидил Канон должна быть соответствующим образом снижена.

Чрезмерно быстрое падение артериального давления может вызвать брадикардию или остановку сердца.

«Интраоперационный синдром атоничной радужки» (Intraoperative floppy iris syndrome [IFIS], разновидность синдрома узкого зрачка) наблюдался во время операции по удалению катаракты у некоторых пациентов, принимавших тамсулозин. Отдельные отчеты также были получены с другими альфа-1-адреноблокаторами, и нельзя исключать возможность эффекта класса. Поскольку IFIS может привести к усилению процедурных осложнений во время операции по удалению катаракты, офтальмологу следует сообщить о текущем или прошлом применении альфа-1-адреноблокаторов перед операцией.

Препарат Урапидил Канон, 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, то есть, по сути, «без натрия».

Урапидил Канон 25 мг - ампулы содержат 0,5 г пропиленгликоля на ампулу. Урапидил Канон 50 мг - ампула содержит 1 г пропиленгликоля на ампулу. Это соответствует 100 мг пропиленгликоля в 1 мл.

Доза пропиленгликоля более 1 мг / кг / день. Совместное применение с любым субстратом для алкогольдегидрогеназы, таким как этанол, может вызывать серьезные побочные эффекты у новорожденных.

Доза пропиленгликоля составляет более 50 мг / кг / день: требуется медицинский контроль у пациентов с нарушениями функции почек или печени, поскольку сообщалось о различных нежелательных явлениях, связанных с пропиленгликолем, таких как почечная дисфункция (острый тубулярный некроз), острая почечная недостаточность и дисфункция печени. Совместное введение с любым субстратом для алкогольдегидрогеназы, таким как этанол, может вызывать побочные эффекты у детей в возрасте до 5 лет. Несмотря на то, что пропиленгликоль, как было показано, не вызывает нарушения репродуктивной функции или пороков развития у животных или людей, он может достигать плода и обнаруживается в молоке. Как следствие, введение пропиленгликоля беременным женщинам следует рассматривать отдельно в каждом конкретном случае.

Доза пропиленгликоля составляет более 500 мг / кг / день: пропиленгликоль может оказывать те же эффекты, что и употребление алкоголя, и может увеличить вероятность возникновения нежелательных явлений.

Различные нежелательные явления, такие как гиперсомнольность, лактоацидоз; нарушение функции почек (острый тубулярный некроз), острая почечная недостаточность; кардиотоксичность (аритмия, гипотония); расстройства центральной нервной системы (депрессия, кома, судороги); угнетение дыхания, одышка; дисфункция печени; гемолитическая реакция (внутрисосудистый гемолиз) и гемоглобинурия; или системная дисфункция органов, наблюдались при приеме высоких доз или длительном применении пропиленгликоля. Таким образом, дозы более 500 мг / кг / сутки могут назначаться детям старше 5 лет, но их следует рассматривать отдельно в каждом конкретном случае. Нежелательные явления обычно исчезают после прекращения приема пропиленгликоля и в более тяжелых случаях после гемодиализа. Требуется медицинский контроль.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Препарат может влиять на способность управления автотранспортом или работу с различными механизмами. Это особенно актуально в начале лечения, при повышении дозы препарата или замене препарата, а также при употреблении алкоголя в период лечения.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного введения, 5 мг/мл.

По 5 или 10 мл в ампулы для лекарственных средств, изготовленные из бесцветного медицинского стекла 1-го гидролитического класса.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или полиэтиленерефталата.

По 1 или 2 контурных ячейковых упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С во вторичной упаковке (пачке картонной). Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/

Организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия
141100, Московская обл., Щелковский район, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

Получить дополнительные данные о препарате, направить претензию на его качество, безопасность, сообщить о нежелательных лекарственных реакциях можно по телефону: 8 (800) 700-59-99 (бесплатная линия 24 часа) или на сайте www.canonpharma.ru в разделе «Политика в области качества» - «Безопасность препаратов».

Производитель

ООО «Гротекс», Россия.

195279, г. Санкт-Петербург, Индустриальный проспект, д. 71, корп. 2, лит. А.