

## **Состав**

*действующее вещество:* urapidil;

1 мл раствора содержит 5 мг урапидила, что соответствует 5,47 мг урапидила гидрохлорида;

*вспомогательные вещества:* пропиленгликоль; натрия фосфат, дигидрат; натрия дигидрофосфат, дигидрат; вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Раствор для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный, бесцветный раствор.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Антигипертензивное средство. Блокаторы альфа-адренорецепторов. Код АТХ C02C A06.

## **Фармакодинамика**

Урапидил приводит к снижению систолического и диастолического давления путем снижения периферического сопротивления.

Частота сердечных сокращений остается практически неизменной. Сердечный выброс тоже остается неизменным; сердечный выброс, уменьшается в результате увеличения постнагрузки, может увеличиться.

*Механизм действия.* Урапидил имеет центральный и периферический механизмы действия.

На периферическом уровне урапидил блокирует в основном постсинаптические альфа-1-адренорецепторы, таким образом подавляя сосудосуживающее действие катехоламинов.

На центральном уровне урапидил модулирует активность центра регуляции кровообращения, предотвращает рефлекторное увеличение тонуса симпатической нервной системы или снижение симпатического тонуса.

### **Фармакокинетика**

*Абсорбция.* После введения 25 мг урапидила наблюдается двухфазное снижение концентрации препарата в крови (начальная фаза распределения, терминальная фаза элиминации). Период полураспределения составляет примерно 35 минут. Период полувыведения препарата из сыворотки крови после болюсного введения составляет 2,7 часа (1,8-3,9 часа).

Связывание урапидила с белками плазмы крови (сыворотка человека) *in vitro* составляет 80%. Это относительно низкое связывание урапидила с белками плазмы крови может объяснить, почему до сих пор неизвестны взаимодействия урапидила и лекарственных средств с сильным связыванием с белками плазмы крови.

*Распределение.* Объем распределения - 0,77 л / кг массы тела. Вещество проникает через гематоэнцефалический барьер и проникает в плаценту.

*Метаболизм.* Урапидил метаболизируется в печени. Основной метаболит - гидроксированный урапидил в 4-м положении фенольного кольца, который не имеет существенной антигипертензивной активности. В-диметилированный метаболит урапидила практически имеет такую же биологическую активность и урапидила, но образуется в очень небольших количествах.

*Экскреция и элиминация.* Выведение урапидила и его метаболитов в организме человека до 50-70% почечно, из которых около 15% дозы - фармакологически активный урапидил; остальные, в первую очередь парагидроксированный урапидил, не имеет антигипертензивного эффекта и выводится с калом.

Особые группы. У пациентов пожилого возраста, а также пациентов с прогрессирующей печеночной и / или почечной недостаточностью объем распределения и клиренс урапидила уменьшается, а период полувыведения из плазмы - увеличивается.

### **Показания**

- Гипертонический криз.
- Тяжелая или очень тяжелая степень артериальной гипертензии.
- Рефрактерная артериальная гипертензия.
- Для контролируемого снижения артериального давления в случае его повышения во время / или после хирургической операции.

### **Противопоказания**

- Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата.
- Аортальный стеноз.
- Артериовенозный шунт (за исключением пациентов с гемодинамическим незначительным диализным шунтом).

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Гипотензивное действие препарата Эбрантил может усиливаться при одновременном применении с блокаторами альфа-адренорецепторов, вазодилататорами и другими антигипертензивными препаратами, а также при гиповолемии (например, диарея, рвота) и употреблении алкоголя.

Одновременное применение циметидина может повысить максимальный уровень урапидила в сыворотке крови на 15%.

На сегодня информация о комбинированной терапии ингибиторами АПФ не является достаточным, поэтому такое лечение не рекомендуется.

### **Особенности применения**

С особой осторожностью следует применять препарат Эбрантил:

- при сердечной недостаточности, вызванной механическими функциональными нарушениями (например, стеноз аортального или митрального клапана), при легочной эмболии или нарушении сердечной деятельности вследствие перикардальных расстройств;
- детям, поскольку исследования не проводились для этой возрастной группы пациентов;
- пациентам с печеночной недостаточностью
- пациентам с умеренным или тяжелой степенью почечной недостаточности
- пациентам пожилого возраста;
- пациентам, которые одновременно применяют циметидин (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

В случае предшествующего применения других антигипертензивных препаратов инъекции урапидила не следует применять, пока не пройдет достаточно времени, необходимого для выявления терапевтического эффекта ранее примененного препарата. Доза препарата Эбрантил должна быть соответственно уменьшена. Чрезмерное быстрое падение артериального давления может привести к брадикардии или остановки сердца.

5 мл раствора для инъекций Эбрантил содержит 500 мг пропиленгликоля, что соответствует 100 мг пропиленгликоля в 1 мл раствора для инъекций.

10 мл раствора для инъекций Эбрантил содержит 1000 мг пропиленгликоля, что соответствует 100 мг пропиленгликоля в 1 мл раствора для инъекций.

Это лекарственное средство не следует применять во время беременности или кормления грудью, если это не рекомендуется врачом. Во время приема этого препарата по указанию врача могут проводиться дополнительные исследования.

Это лекарственное средство не следует применять, если есть заболевания печени или почек, если это не рекомендуется врачом. Во время приема этого препарата по указанию врача могут проводиться дополнительные исследования.

Пропиленгликоль, содержащийся в этом препарате, может иметь такой же эффект, как и употребление алкоголя, и увеличивать вероятность возникновения побочных эффектов.

Препарат не следует применять детям до 5 лет.

Препарат следует применять только по рекомендации врача. Во время приема этого препарата по указанию врача могут проводиться дополнительные исследования.

Эбрантил содержит натрий, но менее 1 ммоль (23 мг) натрия на 5 мл раствора для инъекций, что делает его почти свободным от натрия.

Эбрантил содержит натрий, но менее 1 ммоль (23 мг) натрия на 10 мл раствора для инъекций, что делает его почти свободным от натрия.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

В индивидуальных случаях некоторые побочные реакции со стороны центральной нервной системы (головокружение) могут влиять на способность управлять автотранспортом или работать с механизмами. Это особенно важно в начале лечения, при увеличении дозы / замене лекарственного средства или в случае применения с алкоголем.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

#### Жінки дітородного віку.

Жінкам дітородного віку, які не використовують контрацепцію, Ебрантил не рекомендується.

#### Вагітність.

Дані відсутні або їх кількість обмежена щодо застосування урапідилу у вагітних жінок.

Дослідження на тваринах показали репродуктивну токсичність.

Урапідил проникає через плаценту.

Ебрантил не слід застосовувати під час вагітності, якщо тільки лікування урапідилом необхідне через клінічний стан жінки.

#### Лактація.

Невідомо чи потрапляє урапідил у грудне молоко.

Не можна виключити ризик для новонародженого / дитини.

Ебрантил не слід застосовувати під час лактації.

#### Фертильність.

Клінічних випробувань щодо впливу на фертильність у чоловіків та жінок не проводилось. Дослідження на тваринах показали, що урапідил впливає на фертильність.

#### **Способ применения и дозы**

Гипертонический криз, тяжелая или очень тяжелая форма артериальной гипертензии, рефрактерная гипертензия.

1) *инъекция*: 10-50 мг урапидила вводиться медленно внутривенно под постоянным мониторингом артериального давления. Снижение артериального давления наблюдается в течение 5 минут после инъекции. Парентеральная терапия может быть многократной при повторном повышении артериального давления.

2) Медленная внутривенная капельная инфузия или непрерывная инфузия с помощью перфузатора.

Раствор для капельной инфузии, предназначенный для поддержания артериального давления на уровне, достигнутом с помощью инъекции, готовить так:

250 мг Эбрантил добавить до 500 мл совместимого раствора для инфузий (например, 0,9% раствора натрия хлорида или раствора глюкозы 5% или 10%).

Если для ввода поддерживающей дозы применять Перфузор, 20 мл раствора для инъекций (100 мг Эбрантил) вводить в шприц перфузора и разводить до объема 50 мл совместимым раствором для инфузий (см. Выше).

Максимально допустимое соотношение - 4 мг урапидила на 1 мл раствора для инфузий.

Скорость капельного введения зависит от индивидуальной реакции артериального давления.

Рекомендуемая максимальная начальная скорость - 2 мг / мин.

Поддерживающая доза - в среднем 9 мг / ч, то есть 250 мг урапидила при добавлении к 500 мл раствора для инфузий (1 мг = 44 капли = 2,2 мл).

Контролируемое снижение артериального давления для регулирования гипертонических эпизодов во время / или после хирургической операции.

Непрерывную инфузию с помощью перфузора или капельную инфузию использовать для поддержания артериального давления на уровне, достигнутом с помощью инъекции.

Схема дозировки

Внутривенная инъекция урапидила 25 мг ( = 5 мл раствора для инъекций)		снижение артериального давления через 2 минуты	
через 2 минуты	артериальное давление не меняется		<u>Стабилизация артериального давления с помощью инфузии</u>
Внутривенная инъекция урапидила 25 мг ( = 5 мл раствора для инъекций)		снижение артериального давления через 2 минуты	Начинающая доза 1-2 мин, потом дозировать и уменьшить
через 2 минуты	артериальное давление не меняется		



Медленное внутривенное введения урапидила 50 мг  ( = 10 мл раствора для инъекций)	снижение артериального давления  через 2 минуты

Эбрантил, внутривенный раствор, вводить пациенту в положении лежа на спине инъекционно или путем инфузии.

Возможны одноразовые или повторные инъекции и внутривенные капельные инфузии.

Инъекционное введение препарата совместно с последующей капельной инфузией.

Можно продолжить экстренную парентеральную терапию переходом на долгосрочное лечение Эбрантил, капсулы с модифицированным высвобождением (начальная рекомендуемая доза 2 x 60 мг) или другими пероральными гипотензивными средствами.

Период лечения 7 дней считается безопасным с токсикологической точки зрения и, как правило, не превышает во время парентеральной АД.

Парентеральная терапия может быть многократной при повторном повышении артериального давления.

### Особые группы пациентов.

*Печеночная недостаточность.* Пациентам с печеночной недостаточностью может потребоваться уменьшение дозы Эбрантил.

*Почечная недостаточность.* Пациентам с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью может потребоваться уменьшение дозы Эбрантил при длительном лечении.

*Пациенты пожилого возраста.* Пациентам пожилого возраста необходимо с осторожностью применять гипотензивные средства и начинать терапию с низких доз, поскольку чувствительность у пациентов пожилого возраста к препаратам такого ряда часто изменена.

### **Дети**

Клинические данные об эффективности и безопасности применения препарата у детей отсутствуют.

### **Передозировка**

*Симптомы:*

- со стороны сердечно-сосудистой системы: головокружение, ортостатическое снижение артериального давления, коллапс;
- со стороны центральной нервной системы: повышенная утомляемость и нарушение скорости реакций.

*Лечение.* Чрезмерное снижение артериального давления может быть облегчено за счет поднятия нижних конечностей в положении лежа и замещения объема крови.

Если эти меры окажутся недостаточными, можно вводить медленно вазоконстрикторы под мониторингом АД.

В очень редких случаях необходима внутривенная инъекция катехоламинов (например, 0,5-1,0 мг адреналина, разведенного в 10 мл 0,9% раствора натрия хлорида).

### **Побочные реакции**

Большинство нижеуказанных побочных явлений обусловлены резким снижением артериального давления, однако опыт клинического применения показывает, что они исчезают в течение нескольких минут, даже после проведения капельной инфузии. При тяжелых побочных эффектах следует прекратить применение препарата.

Побочные эффекты по частоте возникновения классифицируют по таким категориям:

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 ( $<1/10000$ ), неизвестно (доступные данные не позволяют оценить частоту).

*Со стороны сердечно-сосудистой системы.*

Нечасто: сердцебиение, тахикардия, брадикардия, ощущение давления или боли за грудиной (симптомы, аналогичные стенокардии), затрудненное дыхание, снижение артериального давления при изменении положения тела, например,

при вставании из положения лежа (ортостатическая дисрегуляция).

*Со стороны пищеварительного тракта.*

Часто: тошнота.

Нечасто: рвота.

*Общие расстройства.*

Нечасто повышенная утомляемость, изменения в месте введения.

*Исследования.*

Нечасто: нерегулярный сердечный ритм.

Очень редко тромбоцитопения \*.

*Со стороны нервной системы.*

Часто: головокружение, головная боль.

*Со стороны психики.*

Очень редко: ощущение беспокойства.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез.

Очень редко приапизм.

*Со стороны дыхательной системы.*

Редко: заложенность носа.

*Со стороны кожи и подкожных тканей.*

Нечасто: повышенное потоотделение.

Редко: гиперчувствительность, включая зуд, покраснение кожи, сыпь.

Неизвестно: ангионевротический отек, крапивница.

\* - В отдельных случаях отмечалось снижение количества тромбоцитов во временной связи с применением препарата Эбрантил, хотя причинно-следственная связь с применением урапидила не может быть установлена, например, с помощью иммунологических исследований.

В случае возникновения любых нежелательных реакций следует проконсультироваться с врачом.

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 30 ° C. Хранить в недоступном для детей месте!

### **Упаковка**

Ампулы по 5 мл или 10 мл. По 5 или 10, или 50 ампул в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

Такеда Австрия ГмбХ, Австрия / Takeda Austria GmbH, Austria

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Ст. Петер-Штрассе 25, 4020 Линц, Австрия / St. Peter-Strasse 25, 4020 Linz, Austria

## **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).