

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Эрастил солофарм, 5 мг/мл, раствор для внутривенного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: урапидил.

Каждый мл раствора содержит 5,47 мг урапидила гидрохлорида в пересчете на урапидил – 5,0 мг.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий, пропиленгликоль (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного введения.

Прозрачный бесцветный или слегка желтоватый, или коричневатый раствор.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Эрастил солофарм показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет.

Гипертонический криз, рефрактерная и тяжелая степень артериальной гипертензии.

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

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

Гипертонический криз, очень тяжелая и тяжелая степень артериальной гипертензии / рефрактерная артериальная гипертензия у взрослых пациентов.

- Внутривенное струйное введение

10–50 мг препарата Эрастил солофарм вводят внутривенно, медленно, под контролем артериального давления (АД). Снижение АД ожидается в течение 2–5 мин после введения.

В зависимости от терапевтического эффекта возможно повторное введение препарата Эрастил солофарм.

- Внутривенная капельная инфузия или непрерывная инфузия с помощью инфузионного шприцевого насоса

Поддерживающая доза (в среднем) – 9 мг/ч, т.е. 250 мг препарата Эрастил солофарм (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) разводят в 500 мл раствора для инфузий (например, 0,9 % раствором натрия хлорида, 5 % или 10 % раствором декстрозы (глюкозы)).

Максимальное допустимое соотношение – 4 мг препарата Эрастил солофарм на 1 мл раствора для инфузий. Рекомендуемая максимальная начальная скорость введения: 2 мг/мин.

Скорость капельного введения зависит от показателей АД пациента.

Если для введения поддерживающей дозы используется инфузионный шприцевой насос, то 100 мг препарата (4 ампулы по 5 мл или 2 ампулы по 10 мл) вводят в шприц инфузионного шприцевого насоса и разводят до 50 мл 0,9 % раствором натрия хлорида, 5 % или 10 % раствором декстрозы (глюкозы).

Раствор для капельной инфузии, предназначенной для поддержания АД, готовится следующим образом:

250 мг препарата (10 ампул по 5 мл или 5 ампул по 10 мл) 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) добавляют к 30 мл раствора для инфузий в перфузионный шприц объемом 50 мл, 1 мг соответствует 0,5 мл.

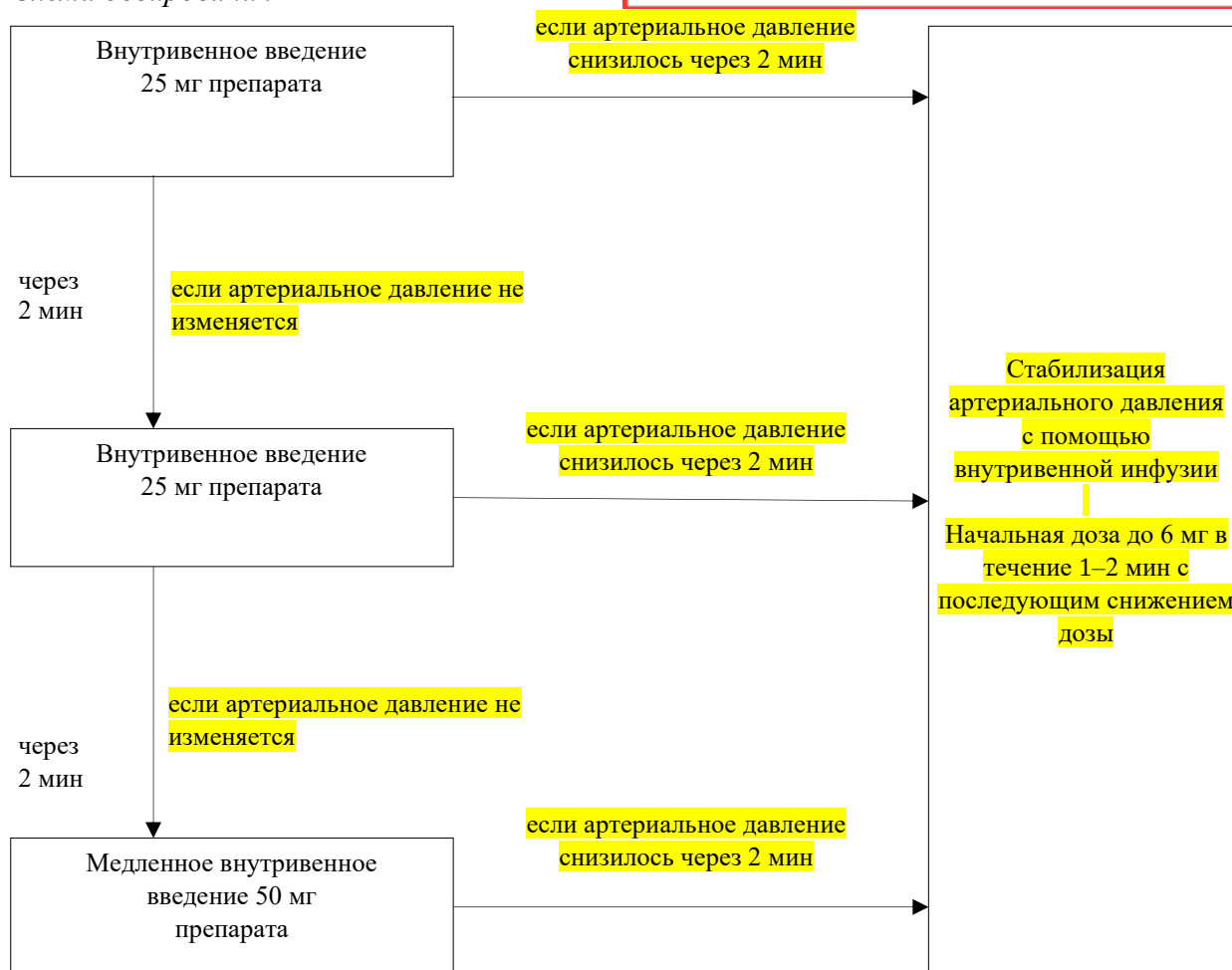
На снижение артериального давления влияет инфузионная доза первых 15 минут. Впоследствии отрегулированное кровяное давление может поддерживаться значительно меньшей дозой.

Поддерживающая доза: в среднем, 9 мг/ч.

Управляемая артериальная гипотензия в случае повышения артериального давления или гипертонического криза во время и/или после хирургического вмешательства у взрослых пациентов

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

Схема дозирования



Если ранее применялись другие гипотензивные лекарственные средства, то препарат Эрастил солофарм можно вводить только через промежуток времени, достаточный для того, чтобы подействовал(-и) ранее введенный(-е) препарат(-ы). Дозу препарата Эрастил солофарм следует соответственно скорректировать.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

При применении гипотензивных препаратов 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 (см. раздел 4.4.).

Пациенты с нарушением функции печени и/или почек

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

Дети

Эффективность и безопасность урапидила у детей и подростков в возрасте до 18 лет не

установлены.

Способ применения

Для внутривенного применения.

Эрастил солофарм вводят внутривенно струйно или путем длительной инфузии – лежа.

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.

Эрастил солофарм можно смешивать только с 0,9 % раствором натрия хлорида или с 5 % или 10 % раствором декстрозы (глюкозы).

Инструкции по разведению лекарственного препарата перед введением, а также меры предосторожности, которые необходимо принимать во внимание при обращении с препаратом или при его введении см. в разделе 6.6.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к урапидилу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- аортальный стеноз;
- возраст до 18 лет;
- артериовенозная фистула (за исключением гемодинамически неэффективного диализного шунта);
- беременность, период лактации, применение у женщин с сохраненным детородным потенциалом, не использующих эффективную контрацепцию.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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 4.5.);
- одновременное применение с ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) (см. раздел 4.5.);
- пожилой возраст.

Особые указания

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 альфа₁-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 альфа₁-адреноблокаторов перед операцией.

Другие гипотензивные препараты

Возможно одновременное применение с другими гипотензивными препаратами для приема внутрь.

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

Нарушение мозгового кровообращения

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 и остановку сердца.

Пожилые пациенты

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

Длительная эрекция и приапизм

Есть сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа₁-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4 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.

Гиповолемия

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

Вспомогательные вещества

Данный препарат содержит менее 1 ммоль натрия в 1 ампуле, то есть по сути не содержит натрия.

Вследствие наличия пропиленгликоля в составе препарата может вызвать симптомы, схожие с приемом алкоголя.

Дети

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Антигипертензивное действие урапидила может усиливаться при совместном приеме с альфа-адреноблокаторами, вазодилататорами или другими гипотензивными средствами, а также при состояниях, связанных со снижением объема циркулирующей крови (ОЦК) в организме (диарее, рвоте) 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).

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

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

Препарат Эрастил солофарм не рекомендуется применять во время беременности.
Урапидил не рекомендуется принимать женщинам с детородным потенциалом, не использующим эффективную контрацепцию.

Лактация

Неизвестно, проникает ли урапидил или его метаболиты в грудное молоко.

Риск для новорожденного/ребенка не может быть исключен, поэтому применение препарата Эрастил солофарм противопоказано в период грудного вскармливания (см. раздел 4.3.).

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 неизвестна.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с 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 быстроты 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.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции распределены в зависимости от частоты их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

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

Нарушения психики: нечасто – нарушение сна; очень редко – беспокойство.

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

Нарушения со стороны сердца: нечасто – ощущение сердцебиения, тахикардия, брадикардия, перебои в работе сердца, боль за грудиной (сходная со стенокардией), одышка.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто – ортостатическая гипотензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – заложенность носа.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота; нечасто – рвота, рвотные позывы, диарея, сухость во рту.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – повышенное потоотделение (гипергидроз); редко – гиперчувствительность, такие как кожный зуд, покраснение кожи, экзантема, ангионевротический отек, крапивница.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко – учащенное мочеиспускание и учащение случаев недержания мочи.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: редко – приапизм.

Общие нарушения и реакции в месте введения: нечасто – повышенная утомляемость.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

<http://roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. 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 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).

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: антигипертензивные средства; антиадренергические средства периферического действия; альфа-адреноблокаторы.

Код АТХ: C02CA06.

Урапидил снижает систолическое и диастолическое АД, снижая периферическое сопротивление.

Урапидил относится к препаратам, блокирующим постсинаптические альфа₁-адренорецепторы, благодаря чему снижается общее периферическое сосудистое сопротивление. Кроме того, урапидил регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса и обладает слабым бета-адреноблокирующим действием. Частота сердечных сокращений 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 альфа₂-адренорецепторами, и не вызывает рефлекторной тахикардии, обусловленной вазодилатацией.

Урапидил сбалансированно снижает систолическое и диастолическое АД, уменьшая общее периферическое сосудистое 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 альфа₁-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.

5.2. Фармакокинетические свойства

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.

Биотрансформация

Урапидил в основном метаболизируется в печени. Его основной метаболит – гидроксированное производное (в 4-м положении бензольного кольца), не обладающее антигипертензивной активностью. О-деметилованный метаболит образуется в очень малых количествах и практически так же активен, как урапидил.

Элиминация

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-гидроксированного урапидила). $T_{1/2}$ 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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Пропиленгликоль

Натрия гидрофосфата дигидрат

Натрия дигидрофосфата дигидрат

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

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

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.6.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (пачке картонной).

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые меры предосторожности отсутствуют.

Раствор для капельной инфузии, предназначенной для поддержания АД, готовится следующим образом:

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).

Или

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

Если для введения поддерживающей дозы используется инфузионный шприцевой насос, то 100 мг препарата (4 ампулы по 5 мл или 2 ампулы по 10 мл) вводят в шприц инфузионного шприцевого насоса и разводят до 50 мл 0,9 % раствором натрия хлорида, 5 % или 10 % раствором декстрозы (глюкозы).

Как и все препараты для парентерального введения, перед введением раствор должен быть проверен визуально, чтобы убедиться, что он не содержит видимых частиц и какого-либо изменения цвета, а также должна быть проверена целостность упаковки.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «Гротекс»

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

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

grtx@grotexmed.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «Гротекс»

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

Тел.: +7 800 700 04 73

ccc@grotexmed.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Эрастил солофарм доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org>.