

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

УРАПИДИЛ Дж

Регистрационный номер:**Торговое наименование:** УРАПИДИЛ Дж**Международное непатентованное наименование:** урапидил**Лекарственная форма:** раствор для внутривенного введения**Состав на 1 мл:***Действующее вещество:* урапидил 5 мг;*вспомогательные вещества:* хлористоводородная кислота раствор 37 % 1,272 мг, натрия дигидрофосфата дигидрат 2,22 мг, натрия гидрофосфата дигидрат 0,42 мг, пропиленгликоль 100,0 мг, натрия гидроксид раствор 4 % до pH 6,1 ± 0,1, хлористоводородная кислота раствор 3,7 % до pH 6,1 ± 0,1, вода для инъекций до 1 мл.**Описание:** прозрачный, бесцветный или слегка коричневатого цвета раствор**Фармакотерапевтическая группа:** антигипертензивные средства; антиадренергические средства периферического действия; альфа-адреноблокаторы.**Код АТХ:** C02CA06**Фармакологическое действие****Фармакодинамика**

Урапидил Дж снижает систолическое и диастолическое артериальное давление (АД), снижая периферическое сопротивление.

Урапидил Дж относится к препаратам, блокирующим постсинаптические альфа₁-адренорецепторы, благодаря чему снижается общее периферическое сосудистое сопротивление. Кроме того, Урапидил Дж 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 Дж не вызывает. Урапидил Дж блокирует вазоконстрикцию, вызываемую альфа₂-адренорецепторами, и не вызывает рефлекторной тахикардии, обусловленной вазодилатацией.

Урапидил Дж сбалансированно снижает систолическое и диастолическое артериальное давление (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 Дж 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.

Фармакокинетика

Распределение

После внутривенного введения (в/в) 25 мг урапидила наблюдается двухфазное снижение концентрации урапидила 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) выводятся почками; остальное выводится через кишечник.

Период полувыведения после в/в 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 снижены, а период полувыведения увеличен.

Показания к применению

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

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

Противопоказания

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

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

Грудное вскармливание

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

Риск для новорожденного/ребенка не может быть исключен, поэтому применение препарата Урапидил Дж противопоказано 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 Дж вводят внутривенно струйно или путем длительной инфузии - лежа.

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

- Внутривенное струйное введение

10-50 мг препарата Урапидил Дж 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 Урапидил Дж.

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

Поддерживающая доза (в среднем) - 9 мг/ч, т.е. 250 мг препарата Урапидил Дж (10 флаконов по 5 мл или 5 флаконов по 10 мл) разводят в 500 мл раствора для инфузий (например, 0,9 % раствором натрия хлорида, 5 или 10 % раствор декстрозы (глюкозы)).

Максимальное допустимое соотношение – 4 мг препарата Урапидил Дж 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 флакона по 5 мл, или 2 флакона по 10 мл, или 1 флакон по 20 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 флаконов по 5 мл или 5 флаконов по 10 мл) добавляют к 500 мл раствора для инфузий, 1 мг соответствует 2,2 мл.

Или

100 мг препарата (4 флакона по 5 мл, или 2 флакона по 10 мл, или 1 флакон по 20 мл) добавляют к 30 мл раствора для инфузий в перфузионный шприц объемом 50 мл, 1 мг соответствует 0,5 мл.

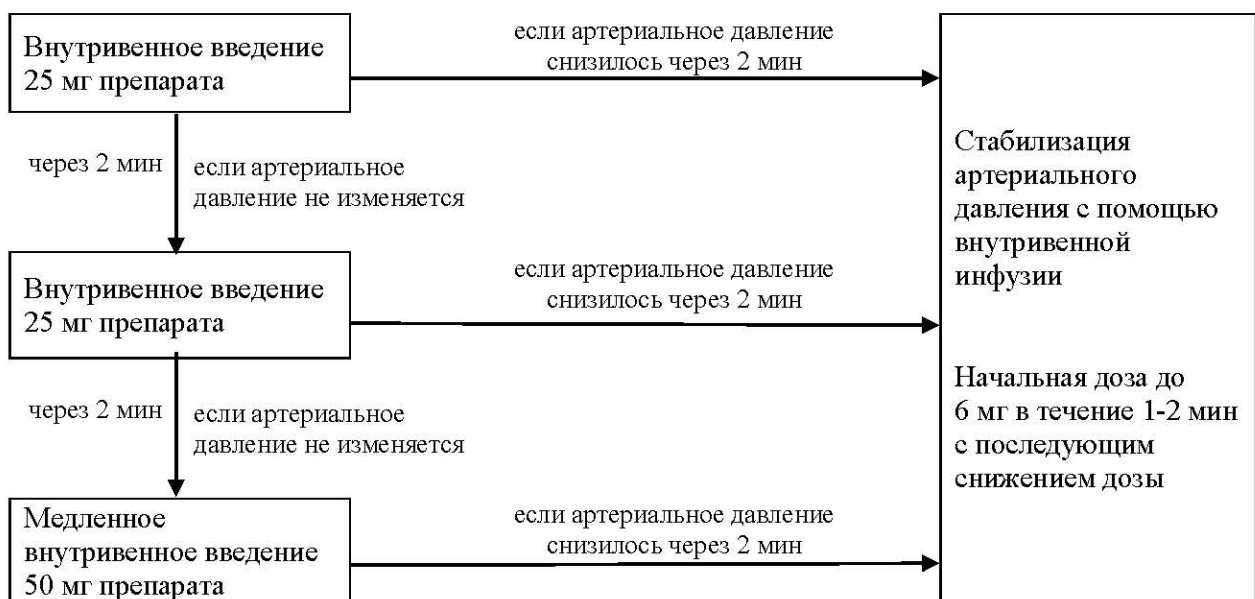
На снижение артериального давления влияет инфузионная доза первых 15 минут. Впоследствии отрегулированное кровяное давление может поддерживаться значительно меньшей дозой.

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



Примечание

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

Пожилые пациенты

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.

Пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью

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.

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 АД.

Лекарственный препарат нельзя смешивать с другими лекарственными препаратами.

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

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 препарата Урапидил Дж. 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
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы</i>					
				Тромбоцитопения	
<i>Нарушения психики</i>					
		Нарушения сна		Беспокойство	
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>					
	Головокружение, головная боль				
<i>Нарушения со стороны сердца</i>					
		Ощущение сердцебиения, тахикардия, брадикардия, перебои в работе сердца, боль за грудиной (сходная со стенокардией), одышка.			
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>					
		Оргостатическая			

Очень часто	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
		гипотензия			
<i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения</i>					
			Заложенность носа		
<i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта</i>					
	Тошнота	Рвота, рвотные позывы, диарея, сухость во рту			
<i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i>					
		Повышенное потоотделение (гипергидроз)	Гиперчувствительность, такие как кожный зуд, покраснение кожи, экзантема, ангионевротический отек, крапивница		
<i>Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей</i>					
				Учащенное мочеиспускание, и учащение случаев недержания мочи	
<i>Нарушения со стороны половых органов и молочной железы</i>					
			Приапизм		
<i>Общие расстройства и нарушения в месте введения</i>					
		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 эpineфрина (адреналина), разведённого в 10 мл физиологического раствора).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Антигипертензивное действие урапидила может усиливаться при совместном приеме с альфа-адреноблокаторами, вазодилататорами 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 увеличивается на 15 %.

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

Препарат Урапидил Дж не следует смешивать со щелочными растворами для инъекций и инфузий, так как это может привести к помутнению раствора или образованию хлопьев вследствие кислотных свойств раствора препарата.

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 Урапидил Дж, 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 Урапидил Дж 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.

Гиповолемиа

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

Ограниченность клинических данных

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

Пропиленгликоль

Вследствие наличия пропиленгликоля в составе препарата Урапидил Дж, раствор для внутривенного введения, при его применении могут возникнуть симптомы, аналогичные таковым при приеме алкоголя.

Содержание натрия

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на один флакон, то есть по сути не содержит натрия.

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 мл, 10 мл, 20 мл препарата во флаконы из бесцветного прозрачного стекла (гидролитический тип I), укупоренные резиновой пробкой, обжатые алюминиевым колпачком, закрытые сверху защитной пластмассовой крышечкой или без крышечки.

По 1 флакону на пластиковом поддоне или без него вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную пачку.

По 5 флаконов на пластиковых поддонах или без них вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную пачку с разделительными перегородками или без них.

Для стационаров: По 5 и 10 флаконов на пластиковых поддонах или без них вместе с соответствующим количеством инструкций по медицинскому применению в коробку картонную с разделительными перегородками или без них.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Джодас Экспоим Pvt. Лтд., Индия

Участок 55, Фаза-3, Биотек Парк, Каркапатла (Вилладж), Маркук (М), Сиддипет (Дистрикт), Телангана, 502 279, Индия

Владелец РУ/Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Джодас Экспоим», Россия

140200, Московская обл., Воскресенский р-он, г. Воскресенск, ул. Московская, д. 45м, офис 4.

Телефон: 8 (499) 503-01-92

E-mail: info@jodas.ru