

Состав и форма выпуска

Капсулы пролонгированного действия твердые желатиновые, №4, с непрозрачным корпусом и крышечкой желтого цвета, с нанесенной на корпус надписью черного цвета "Ebr 30"; содержимое капсул - гранулы желтого цвета.

1 капсула содержит *активное вещество*: урапидил 30 мг.

Вспомогательные вещества: сахарная крупка (сахароза, патока крахмальная) - 62.43 мг, метакриловой кислоты и метилметакрилата сополимер (1:2) - 0.62 мг, тальк - 1.18 мг, диэтилфталат - 0.06 мг, фумаровая кислота - 8.88 мг, гипромеллоза - 11.28 мг, этилцеллюлоза - 1.75 мг, стеариновая кислота - 0.47 мг, гипромеллозы фталат - 0.72 мг.

Состав оболочки капсулы: желатин - 32.707 мг, титана диоксид - 1.2 мг, краситель железа оксид желтый - 0.293 мг, вода - 5.8 мг.

Состав чернил черных: (шеллак, краситель железа оксид черный, пропиленгликоль, аммиак водный) - не более 0.19 мг.

Состав сахарной крупки (сахароза, патока крахмальная): сахароза - 80-91.5%, крахмал кукурузный - 8.5-20%, вода - макс. 1.5%.

Фармакологическое действие

Антигипертензивный препарат. Урапидил имеет центральный и периферический механизм действия. Блокирует постсинаптические α_1 -адренорецепторы, благодаря чему снижается ОПСС.

Регулирует центральный механизм поддержания сосудистого тонуса за счет стимуляции серотониновых 5-НТ1А-рецепторов сосудодвигательного центра (предотвращает рефлекторное увеличение тонуса симпатической нервной системы). ЧСС, сердечный выброс не меняются. Низкий сердечный выброс может повышаться за счет снижения ОПСС.

Стимулирует пресинаптические α_2 -адренорецепторы.

Снижает систолическое и диастолическое АД, не вызывает рефлекторной тахикардии.

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 задержку жидкости в организме.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь 80-90% урапидила всасывается из ЖКТ. C_{\max} в плазме крови достигается через 4-6 ч после приема препарата внутрь.

Относительная биодоступность капсул пролонгированного действия, по сравнению с раствором урапидила для приема внутрь, составляет 92 (83-103)%.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови составляет примерно 80%. V_d - 0.77 л/кг массы тела.

Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер.

Метаболизм

Метаболизируется преимущественно 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.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет примерно 4.7 ч (3.3-7.6 ч). 50-70% урапидила и его метаболитов (15% в виде активного вещества) выводится почками, остальная часть выводится через кишечник в виде метаболитов (в основном в виде неактивного п-гидроксированного урапидила).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста и у пациентов с тяжелой печеночной и/или почечной недостаточностью V_d и клиренс снижены, а $T_{1/2}$ увеличен.

Показания препарата Эбрантил®

- артериальная гипертензия тяжелой степени (в составе комбинированной терапии).

Режим дозирования

Препарат принимают внутрь, утром и вечером, одновременно с приемом пищи, запивая небольшим количеством воды.

Дозу препарата необходимо подбирать индивидуально.

Назначают по 30 мг 2 раза/сут. При необходимости доза препарата Эбрантил® может быть увеличена до 120 мг (по 2 капсулы 30 мг или по 1 капсуле 60 мг 2 раза/сут).

Максимальная суточная доза составляет 180 мг в 2 приема.

У пациентов пожилого возраста, а также пациентов с нарушением функции печени и/или с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени при применении препарата Эбрантил® может потребоваться уменьшение дозы в зависимости от показателей АД и лабораторных показателей функции печени и/или почек.

Побочное действие

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>1/10), часто (>1/100 и <1/10), нечасто (>1/1000 и <1/100), редко (>1/10 000 и <1/1000), очень редко (<1/10 000), частота неизвестна (частоту невозможно определить на основании имеющихся данных).

	Часто	Нечасто	Очень редко	Частота неизвестна
Со стороны сердечно-сосудистой системы		Ощущение сердцебиения, тахикардия, брадикардия, чувство сдавления или боли в груди (симптомы, типичные для приступа стенокардии), ортостатическая гипотензия		
Со стороны пищеварительной системы		Рвота, диарея, сухость слизистой оболочки полости рта		
Лабораторные показатели			Обратимое повышение активности печеночных ферментов, тромбоцитопения*	

Со стороны нервной системы	Головокружение, головная боль	Повышенная утомляемость, нарушения сна	Дисфория	
Со стороны репродуктивной системы			Приапизм	
Со стороны мочевыделительной системы			Учащенное мочеиспускание и учащение случаев недержания мочи	
Со стороны кожи		Сухость кожи		
Аллергические реакции тканей		Кожный зуд, экзантема, покраснение кожи		Ангинебротический отек, крапивница
Со стороны дыхательной системы		Заложенность носа		
Общие реакции		Генерализованные отеки		

* В очень редких случаях наблюдалось тромбоцитопения в период применения препарата Эбрантил[®], хотя причинная связь с проводимым лечением препаратом путем проведения, например, иммунологических проб, не установлена.

Пациент должен сообщить врачу об усилении любых из указанных выше побочных эффектов или появлении любых других побочных эффектов.

Противопоказания к применению

- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- беременность;
- период лактации (грудного вскармливания);
- непереносимость фруктозы и синдром нарушения всасывания глюкозы/галактозы или дефицит сахаразы/изомальтазы;
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: нарушение функции печени, пациенты с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени, хроническая сердечная недостаточность, стеноз аортального и митрального клапана, эмболия легочной артерии, нарушение сократимости миокарда вследствие заболевания перикарда (например, тампонада, хронический перикардит), при одновременном применении с циметидином, пожилой возраст.

Применение при беременности и кормлении грудью

Эбрантил® не следует применять при беременности и в период грудного вскармливания в связи с отсутствием клинических данных по применению.

Применение при нарушениях функции печени

У пациентов с нарушением функции печени средней и тяжелой степени при применении препарата Эбрантил® может потребоваться уменьшение дозы в зависимости от показателей АД и лабораторных показателей функции печени и/или почек.

Применение при нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени при применении препарата Эбрантил® может потребоваться уменьшение дозы в зависимости от показателей АД и лабораторных показателей функции печени и/или почек.

Применение у детей

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Применение у пожилых пациентов

У пациентов пожилого возраста при применении препарата Эбрантил® может потребоваться уменьшение дозы в зависимости от показателей АД и лабораторных показателей функции печени и/или почек.

Особые указания

Возможны случаи развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа₁-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4 ч 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.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период терапии препаратом Эбрантил® необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии 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, а также употреблении алкоголя в период лечения.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, головокружение, повышенная утомляемость, заторможенность, коллапс.

Лечение: в течение первых 4 ч после передозировки возможно промывание желудка и применение активированного угля. При выраженном снижении АД пациенту следует придать горизонтальное положение, ноги приподнять; проводить мероприятия по увеличению ОЦК, симптоматическую терапию.

Лекарственное взаимодействие

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

При одновременном приеме циметидина C_{\max} урапидила в плазме крови может увеличиваться на 15%.

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

Условия хранения

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия реализации

Препарат отпускается по рецепту.