

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау және
әлеуметтік даму министрлігі
Медициналық және
фармацевтикалық қызметті
бақылау комитеті Төрағасының
2016 ж. “16” тамыз
№ 3406, 3407 бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік затты медициналық қолдану
жөніндегі нұсқаулық
ЭБРАНТИЛ®**

Саудалық атауы
Эбрантил®

Халықаралық патенттелмеген атауы
Урапидил

Дәрілік түрі
Бөлініп шығуы өзгертілген капсулалар 30 мг, 60 мг

Құрамы

Бір капсуланың құрамында

белсенді зат – 30 мг, 60 мг урапидил,

қосымша заттар: қант түйіршігі; метакрил қышқылы және металакрилаттың сополимері; тальк; диэтилфталат; фумар қышқылы; гипромеллоза; этилцеллюлоза; стеарин қышқылы; гипромеллоза фталаты
капсула қабығының құрамы (30мг): желатин, титанның қостотығы (Е 171), темірдің (III) сары тотығы (Е172); тазартылған су; тазартылған қара сия,
капсула қақпақшасының құрамы (60мг): титанның қостотығы (Е 171); желатин,

капсула қабығының құрамы (60мг): индигокармин (Е132), желатин.

Сипаттамасы

Капсулалар, 30 мг

Корпусы мөлдір емес және сары түсті қақпақшасы мен қара түсті ««Ebr30» таңбасы бар, өлшемі № 4, қатты желатинді капсулалар. Капсуланың ішіндегісі – сары түсті түйіршіктер.

Капсулалар, 60 мг

Ашық көгілдір түсті мөлдір корпусы және ақ түсті мөлдір емес қақпақшасы бар, өлшемі № 2, қатты желатинді капсулалар. Капсуланың ішіндегісі – сары түсті түйіршіктер.

Фармакотерапиялық тобы

Гипертензияға қарсы препараттар. Шеткері антиадренергиялық препараттар. Альфа-адреноблокаторлар. Урапидил.
АТХ коды C02CA06

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Сіңуі

Пероральді қабылдағаннан кейін урапидилдің 80 – 90% асқазан-ішек жолынан сіңеді. Эсер етуі ұзаққа созылатын түрлерінің ең жоғары концентрациясына енгізгеннен кейін 4-6 сағаттан соң жетеді; плазмадан жартылай шығарылу кезеңі 4,7 сағатқа жуықты (3,3-7,6 сағат) құрайды. Эсері ұзаққа созылатын капсулалардың абсолютті биожетімділігі көктамыр ішіне енгізумен салыстырғанда 72 (63-80)% құрайды. Эсері ұзаққа созылатын капсулалардың салыстырмалы биожетімділігі пероральді тағайындалған ерітіндімен салыстырғанда 92 (83-103)% құрайды.

Таралуы

Урапидилдің қан плазмасы ақуыздарымен байланысуы 80% құрайды. Таралу көлемі дене салмағының әр кг 0,77 л келеді. Зат гематоэнцефалдық бөгет арқылы өтеді және плацента арқылы енеді.

Метаболизмі

Урапидил көбіне бауырда метаболизденеді. Негізгі метаболиті - фенил сақинасының 4 қалпындағы гидроксилденген урапидил, оның іс жүзінде гипертензияға қарсы белсенділігі жоқ. Урапидилдің О-деметилденген метаболиті де урапидил сияқты биологиялық белсенді, бірақ өте аз мөлшерде болады.

Эскрециясы және шығарылуы

Адамда урапидил мен оның метаболиттері шығарылуының 50-70% бүйрек арқылы жүреді, олардың ішінде енгізілген дозаның 15%-ын фармакологиялық белсенді урапидил құрайды; басқалары, негізінен гипертензияға қарсы емес р-гидроксилденген урапидил түрінде нәжіс арқылы шығарылады.

Пациенттердің ерекше топтары

Егде жастағы және айқын бауыр және/немесе бүйрек жеткіліксіздігі бар пациенттерде таралу көлемі және клиренсі азаяды және плазмадан жартылай шығарылу кезеңі ұзарады.

Фармакодинамикасы

Урапидил шеткері тамырлық кедергіні төмендету арқылы систолалық және диастолалық артериялық қысымның төмендеуін туындатады. Жүректің жиырылу жиілігі көп жағдайда өзгеріссіз қалады. Жүрек лықсытуы өзгермейді; жүктемеден кейін ұлғаюдың есебінен төмендеген жүрек лықсытуы артуы мүмкін.

Урапидилдің орталықтық және шеткері эсер ету аймағы болады. Шеткері эсері – урапидил көбіне постсинапстық альфа-1-рецепторларды бөгеп, осылайша катехоламиндердің тамыр тарылтатын әсеріне кедергі жасайды.

Орталықтық әсері кезінде урапидил айналымдық-реттеу орталықтарының белсенділігін төмендетеді; бұл симпатикалық жүйке жүйесі тонусын рефлекторлық ұлғайтуды болдырмайды немесе симпатикалық тонусты төмендетеді.

Қолданылуы

- артериялық гипертензияда

Қолдану тәсілі және дозалары

Ұсынылатын дозасы:

Артериялық қысымды біртіндеп төмендету үшін емдеу күніне Эбрантил® препаратын 30 мг екі рет (30 мг урапидил× күніне 2 ретке сәйкес келеді) қабылдаудан басталады.

Егер артериялық қысымның тезірек төмендетілуі қажет болса, Эбрантил® препаратын 60 мг дозада күніне екі рет (60 мг урапидил× күніне 2 ретке сәйкес келеді) қабылдау ұсынылады.

Дозаны пациенттің жекелей қажетіне қарай біртіндеп бейімдеуге болады. Демеуші доза урапидилдің күніне 60-180 мг құрайды, жалпы мөлшері екі жекелеген дозаға бөлінеді.

Қолдану тәсілі:

Бөлініп шығуы өзгертілген капсулаларды таңертеңгі және кешкі тамақтану кезінде қабылдаған жөн, тұтастай жұтып, аздаған мөлшердегі сұйықтықпен ішеді.

Урапидилдің бөлініп шығуы өзгертілген капсулалары ұзақ қолдануға жарамды. Аталған препаратпен артериялық гипертензияны емдеу ұдайы медициналық бақылауы талап етеді.

Пациенттердің ерекше тобы

Бауыр жеткіліксіздігі кезіндегі дозалануы

Бауыр жеткіліксіздігі бар пациенттерге урапидил дозасын төмендету қажет болуы мүмкін.

Бүйрек жеткіліксіздігі кезіндегі дозалануы

Ауырлығы орташа және ауыр дәрежедегі бүйрек жеткіліксіздігі бар пациенттерге бөлініп шығуы өзгертілген урапидил капсулаларымен ұзақ емдеген кезде дозаны төмендету қажет болуы мүмкін.

Егде жастағы адамдарға арналған дозасы

Егде жастағы пациенттерге бөлініп шығуы өзгертілген урапидил капсулаларымен ұзақ емдеген кезде дозаны төмендету қажет болуы мүмкін.

Педиатрияда қолдану

18 жасқа дейінгі балалар мен жасөспірімдерде қолдану тәжірибесі жеткіліксіз.

Жағымсыз әсерлері

Қолайсыз жағымсыз реакциялары туындау жиілігін ескере отырып, мынадай тәртіппен бөлінген: өте жиі ($\geq 1/10$); жиі ($\geq 1/100 < 1/10$ дейін); жиі емес ($\geq 1/1000$ -нан $< 1/100$ дейін); сирек ($\geq 1/10000$ -нан $< 1/1000$ дейін); өте

сирек (< 1/10000), белгісіз (қолда бар деректер негізінде бағалау мүмкін емес).

Жиілігі Ағзалар жүйесі	Жиі	Жиі емес	Өте сирек	Белгісіз
Психикалық бұзылыстар		Ұйқының бұзылуы	Мазасыздық	
Жүйке жүйесінің бұзылуы	Бас айналу; бас ауыру			
Кардиологиялық бұзылулар		Жүректің қағуы; тахикардия; брадикардия; кеуденің қысуын немесе ауыруын сезіну (стенокардияға ұқсас симптомдар)		
Қантамыр бұзылулары		Оргостатикалық гипотензия		
Тыныс алу жүйесі, кеуде қуысы мен көкірек ортасы тарапынан бұзылулар		Мұрынның бітелуі		
Асқазан-ішек жолы тарапынан бұзылулар	Жүрек айну	Құсу; диарея; ауыздың құрғауы		
Тері және тері асты тіндері тарапынан бұзылулар		Аллергиялық реакциялар (қышыну, терінің қызаруы, экзантема)		Квинке ісінуі, есекжем
Бүйрек және несеп шығару жүйесі тарапынан бұзылулар			Кіші дәретке жиі отырғысы келу және несеп ұстай алмау жағдайларының жиілеуі	
Ұрпақ өрбіту жүйесі және сүт бездері тарапынан бұзылулар			Приапизм	
Жалпы сипаттағы бұзылулар және препаратты енгізген орындағы жергілікті реакциялар		Шаршау	Су іркілісінің ұлғаюы салдарынан ісіну	

Жиілігі Ағзалар жүйесі	Жиі	Жиі емес	Өте сирек	Белгісіз
Зерттеулер			Бауыр ферменттерінің қайтымды жоғарылауы, тромбоциттер санының төмендеуі*	

* Өте сирек жағдайларда даму уақыты бойынша урапидилді қолданумен сәйкес келетін тромбоциттер санының төмендеуі байқалады, алайда мұндай жағдайларда тромбоцитопенияның урапидилді қабылдаумен байланыстылығын иммунологиялық зерттеулер жоққа шығарады.

Күмәнді жағымсыз реакциялар туралы хабарламалар

Күмәнді жағымсыз реакциялар туралы хабарламалар беру дәрілік препараттың тіркеуден кейінгі кезеңінде маңызды болып табылады, өйткені бұл препараттың пайда/қауіп теңгеріміне үздіксіз мониторинг жүргізуге мүмкіндік береді. Денсаулық сақтау мамандарынан күмәнді жағымсыз реакциялар туралы хабарлауды өтінеміз.

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- препараттың қандай да бір компоненттеріне аса жоғары сезімталдық (аллергия)
- жүктілік және лактация кезеңі
- 18 жасқа дейінгі балалар және жасөспірімдер (60 мг доза үшін)

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Урапидилдің гипертензияға қарсы әсері альфа-адренергиялық рецепторлар блокаторларын, тамыр кеңейтетін дәрілер мен басқа да гипертензияға қарсы препараттарды бір мезгілде қолданумен, сондай-ақ сусыздану жағдайларында (диарея, құсу) және алкоголь қабылдағанда күшеюі мүмкін.

Циметидинді бір мезгілде қабылдау сарысуда урапидил деңгейінің 15% дейін жоғарылауы мүмкін.

Осы уақытқа дейін ангиотензин өзгертуші фермент тежегіштерін (АӨФт) қолданумен біріктірілген емдеу туралы толық ақпарат жоқ болғандықтан, қазіргі кезде мұндай емдеу ұсынылмайды.

Айрықша нұсқаулар

Урапидил мынадай кезде қолданылғанда аса сақ болу қажет:

- механикалық сипаттағы функциялық бұзылу себеп болатын (мысалы, аортальді немесе митральді клапандар стенозы) жүрек жеткіліксіздігінде, өкпе эмболиясы кезінде немесе перикард ауруы салдырынан миокард жұмысы нашарлағанда;
- бауыр дисфункциясы бар пациенттерді емдеуде;

- бүйректің орташадан ауырға дейінгі дисфункциясы бар пациенттерде;
- егде жастағы пациенттерде;
- циметидинді қатар алатын пациенттерді емдегенде

Педиатрияда қолданылуы

Препарат 18 дейінгі балалар мен жасөспірімдерге қолданылмауы тиіс, өйткені балаларда ешқандай клиникалық зерттеулер жүргізілмеген.

Фруктозаны көтере алмаушылық, глюкоза және галактоза мальабсорбциясы синдромы немесе сахараза-изомальтаза жеткіліксіздігі түріндегі сирек кездесетін тұқым қуалайтын бұзылулары бар пациенттер урапалді қолданбаулары тиіс.

Дәрілік заттың көлік құралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсер ету ерекшеліктері.

Эбрантил® препаратымен ем кезінде машинаны немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқаруда сақ болу қажет. Бұл ем басталғаннан кейін дәрілік препаратты алмастырғанда немесе алкоголь қабылдағанда ерекше маңызды.

Артық дозалануы

Симптомдары:

- айналымдық симптомдар: бас айналу, ортостатикалық гипотензия, коллапс;
- орталық жүйке жүйесі тарапынан симптомдар: шаршағыштық, реакция жылдамдығының төмендеуі.

Емі:

Артериялық қысымның шамадан тыс төмендеуін аяқты жоғары көтеріп қою, сондай-ақ айналымдағы қан көлемін толықтыру арқылы азайтуға болады. Егер бұл шаралар тиімсіз болса, артериялық қысымды ұдайы бақылай отырып, тамыр тарылтатын препараттарды көктамыр ішіне баяу енгізуге болады.

Өте сирек жағдайларда 10 мл натрий хлориді изотониялық ерітіндісінде сұйылтылған 0,5-1,0 мг адреналинді көктамыр ішіне енгізу қажет.

Шығарылу түрі және қаптамасы

30 капсуладан ішінде силикагельді қуысы бар, бұралып кигізілетін полиэтилен қақпақпен тығындалған және бірінші ашылуы бақыланатын сақинамен жабдықталған полиэтилен құтыға салынған.

1 құтыдан медициналық қолдану жөніндегі мемлекеттік және орыс тіліндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынады.

Сақтау шарттары

25⁰С-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Сақтау мерзімі

2 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін пайдалануға болмайды.

Дәріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші

Такеда ГмбХ, Ораниенбург, Германия.

Тіркеу куәлігі иесінің атауы мен елі

Такеда ГмбХ, Германия

Қазақстан Республикасы аумағында тұтынушылардан өнім (тауар) сапасына қатысты шағымдарды қабылдайтын және дәрілік заттың тіркеуден кейінгі қауіпсіздігін қадағалауға жауапты ұйымның мекенжайы

«Такеда Қазақстан» ЖШС

Алматы қ., Шашкин к-сі 44

Телефон нөмірі (727) 2444004

Факс нөмірі (727) 2444005

Электрондық пошта DSO-KZ@takeda.com