



# Urapidil Kalceks

## 25 mg a 50 mg injekčný/infúzny roztok

Urapidil je N-substituovaný derivát fenylpiperazínu, ktorý má antihypertenzívny účinok vďaka periférnemu a centrálnemu účinku. Urapidil predovšetkým periférne blokuje postsynaptické alfa-1 blokátory, čím sa inhibuje vazokonstrikčný účinok katecholamínov. Urapidil centrálnie moduluje aktivitu obehových regulačných centier, čím zabraňuje reflexnému zvýšeniu tonusu sympatiku alebo znižuje tonus sympatiku. Urapidil reguluje krvný tlak a tonus sympatiku inhibíciou aktivity alfa-1 adrenoreceptorov a stimuláciou serotonínových 5-HT<sub>1A</sub> receptorov. Urapidil vedie k zníženiu systolického a diastolického krvného tlaku znížením periférnej rezistencie. Srdcová frekvencia zostáva väčšinou konštantná.

#### Schválené:

• V Európe 24. augusta 1988 (Ebrantil®, Takeda GmbH).

#### Indikácie:

Naliehavé hypertenzné stavy (napr. hypertenzná kríza), ťažke až veľmi ťažké formy hypertenzie, liečba rezistentnej hypertenzie. Kontrolované zníženie krvného tlaku u pacientov s hypertenziou počas a/alebo po chirurgickom zákroku. Urapidil je určený len pre dospelých.

#### Spôsob podávania lieku:

Intravenózne podanie lieku.

#### Urapidil sa používa pri liečbe:

- hypertenzných stavov vrátane eklampsie a preeklampsie,
- hypertenznej krízy a hypertenzie vyskytujúcej sa počas všeobecnej a kardiochirurgickej operácie, prudkého poklesu krvného tlaku bez zmeny srdcovej frekvencie.

#### Výhody urapidilu u pacientov so srdcovými poruchami:

- zlepšenie spotreby kyslíka v myokarde,<sup>1</sup>
- zlepšená systémová cievna rezistencia,<sup>1</sup>
- zlepšenie funkcie ľavej komory,<sup>2</sup>
- zníženie preťaženia v súvislosti s absenciou predĺženej tachykardie,<sup>3</sup>
- zlepšenie srdcového výdaja a tlaku v pľúcnych kapilárach.<sup>1</sup>

#### Porovnanie Urapidilu s inými antihypertenzívami v rade nežiaducich účinkov:

- Urapidil neovplyvňuje metabolizmus lipidov a glukózy, nezhoršuje ani funkciu obličiek. Farmakokinetika Urapidilu teda nie je ovplyvnená poruchou funkcie obličiek.<sup>1</sup>
- hoci je Urapidil vazodilatátor, nespôsobuje tachykardiu a zvýšenie intrakraniálneho tlaku;
- Urapidil je účinný a dobre tolerovaný s ľahkým priebehom nežiaducich účinkov. V kombinácii s inými liekmi používanými počas celkovej anestézie sa nevyskytli žiadne nežiaduce reakcie. Urapidil je vhodný na liečbu hypertenzných záchvatov počas operácií;<sup>4</sup>
- dlhodobá liečba Urapidilom nevedie k rozvoju tolerance a neznižuje účinok Urapidilu.<sup>5</sup>

#### Výhody Urapidilu v porovnaní s inými antihypertenzívami:

- pri podávaní dávok s rovnakým antihypertenzným účinkom pôsobí Urapidil silnejšie na artérie a vyvoláva menšiu posturálnu hypotenziu ako prazosín, ktorý pôsobí silnejšie na cievy;<sup>1</sup>
- na rozdiel od norepinefrínu je Urapidil rýchlo pôsobiaci vazodilatátor; pôsobí špecifickým alfa-1 adrenergným blokovacím účinkom, a keďže nepotláča aktivitu presynaptických alfa-2 receptorov na sympatických nervových zakončeniach, nedochádza k fyziologickej spätnej väzbe uvoľňovania noradrenalínu. Urapidil tiež spôsobuje útlm centrálného sympatiku interakciou so serotonínovým 5-HT<sub>1A</sub> receptorom. Urapidil je vhodnejší ako klonidín na zvládanie akútnej artérie;<sup>6</sup>
- Urapidil sa môže používať v kombinácii s látkami blokujúcimi kalciové kanály, ako je napríklad nifedipín, na úspešnú liečbu pacientov s rezistentnou hypertenziou.<sup>7</sup>

#### Urapidil Kalceks 25 mg a 50 mg injekčný/infúzny roztok:

Sklenená ampulka z bezfarebného skla s obsahom 5 ml alebo 10 ml s označeným bodom zlomu. Päť ampuliek je balených v ochrannej vložke. Ochranná vložka je zabalená v kartónovej škatuli.

#### Čas použiteľnosti:

2 roky - neotvorená ampulka

#### Podmienky skladovania:

Neskladujte pri teplote nad 30°C.

#### Velkosti balenia:

5 x 5 ml ampuliek;

5 x 10 ml ampuliek.

Nie všetky typy balení sú uvádzané na trh v Slovenskej republike.

#### Distribútor pre SR:

PHAREX, s. r. o.

Záhradná 557/3

038 04 Bystrička

Web: [www.pharex.sk](http://www.pharex.sk)

Mail: [objednavky@pharex.sk](mailto:objednavky@pharex.sk)

Tel.: +421 948 885 815



<sup>1</sup> Langtray, HD. et al. Urapidil: A Review of its Pharmacodynamic and Pharmacokinetic Properties, and Therapeutic Potential in the Treatment of Hypertension. *Drugs* 1989; 38:900-940.

<sup>2</sup> Schoetensack, W. Bruckschen, E. G. and Zech, K. Urapidil. *New Drugs Annual: Cardiovascular Drugs*, edited by Alexander Scriabine. Raven Press, New York © 1983.

<sup>3</sup> Lepage, J.-Y. et al. Acute effects of urapidil on left ventricular function in hypertensive patients: comparison with clonidine using radionuclide angiography. *British J Anaesth.* 1994; 72:638-642.

<sup>4</sup> Schook, C.E. et al. Overview of Clinical Trials with Urapidil. *Am.J. Cardiol.* 1989, 64:300-370.

<sup>5</sup> Buch, J. Urapidil, a Dual-Acting Antihypertensive Agent: Current Usage Considerations. *Review. AdvTher.* 2010, 27(426):426-443.

<sup>6</sup> Hess, W. Urapidil Versus Clonidine Acute Haemodynamic Effects During Control of Intraoperative Hypertensive Episodes. *Drugs*, 1990, 40(4): 77-79.

<sup>7</sup> Spah, F. et al. Acute Haemodynamic Effects of Urapidil and Nifedipine in Hypertensive Urgencies and Emergencies. *Drugs*, 1990, 40(4):58-59.