Этмозин



Код АТХ:

- C01BG01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Морацизин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиаритмическое средство. По классификации антиаритмиков Вогена-Вильямса морацизин относится к препаратам классов I A, I B и I C, но полностью не принадлежит ни к одному из них. Подавляет быстрый, направленный внутрь клетки транспорт ионов натрия через мембраны кардиомиоцитов. Обладает выраженной местноанестезирующей и мембраностабилизирующей активностью. Уменьшает возбудимость, скорость проведения и автоматизм вследствие замедленного проведения в предсердно-желудочковом узле и системе Гиса-Пуркинье. Уменьшает длительность потенциала действия (ДПД) в волокнах Пуркинье, снижает также эффективный рефрактерный период (ЭРП), но в меньшей степени, чем ДПД, таким образом, отношение ЭРП/ДПД увеличивается. Уменьшает максимальную скорость фазы 0 деполяризации (V_{max}), но не влияет на амплитуду потенциала действия или на максимальный диастолический потенциал.

Не оказывает влияния на рефрактерные периоды предсердий, AV-узла или левого желудочка и в минимальной степени действует на реполяризацию желудочков. Не влияет на проведение в синоатриальном узле или на внутрипредсердное проведение и только незначительно действует на продолжительность синусного цикла и на время восстановления активности синоатриального узла. Оказывает менее выраженное действие на наклон фазы 0 и более сильное влияние на ДПД и ЭРП, чем препараты класса I C.

Вызывает небольшое, но стойкое повышение АД и ЧСС в покое. Может подавлять агрегацию тромбоцитов, обладает антихолинергической активностью.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбируется полностью, C_{max} в плазме достигается в течение 0.5-2 ч. Связывание с белками плазмы около 95%. Подвергается интенсивному метаболизму при первом прохождении через печень. В процессе метаболизма образуется по крайней мере до 26 метаболитов, только два из них могут быть фармакологически активными. Морацизин индуцирует свой собственный метаболизм через систему CYP в печени.

$T_{1/2}$ - 1.5-3.5 ч. Выводится в виде метаболитов с желчью - 56%, почками - 39%; менее 1% - в неизмененном виде. Отмечается некоторая кишечно-печеночная рециркуляция.

Показания к применению:

Предсердная и желудочковая экстрасистолия, пароксизмальная предсердная тахикардия, пароксизмальная желудочковая тахикардия, пароксизмальная мерцательная тахиаритмия; аритмии на фоне передозировки сердечных гликозидов.

Относится к болезням:

- Аритмия
- Желудочковая тахикардия
- Желудочковая экстрасистолия
- Пароксизм
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

Синоатриальная блокада II степени, AV-блокада II и III степени (без кардиостимулятора), блокада правой ножки пучка Гиса, сочетающаяся с блокадой одной из ветвей левой ножки, блокада внутрижелудочковой проводимости, хроническая сердечная недостаточность II-III стадии, тяжелая артериальная гипотензия, кардиогенный шок, тяжелая почечная/печеночная недостаточность, беременность, период лактации, повышенная чувствительность к морацизину.

Способ применения и дозы:

Для приема внутрь суточная доза составляет 600-900 мг, частота приема - 3 раза/сут с интервалом 8 ч. При необходимости дозу увеличивают на 150 мг/сут с интервалами 3 дня до достижения общей дозы 900 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: проаритмогенное действие (желудочковые аритмии), мерцательная аритмия, брадикардия, повышение АД, снижение АД (особенно при в/в введении), боль в грудной клетке, AV-блокада, внутрижелудочковая блокада, развитие или усугубление сердечной недостаточности (одышка, периферические отеки).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: нечеткость зрительного восприятия, головная боль, головокружение, тремор, атаксия, шум в ушах, дизартрия, нистагм, гиперестезия, парестезии, нервозность, тревожность, нарушения сна, повышенная утомляемость, слабость, галлюцинации, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, сухость во рту, тошнота, рвота, гастралгия, редко - повышение активности печеночных трансаминаз, гепатотоксичность.

Местные реакции: при в/м введении - болезненность в месте введения.

Прочие: аллергические реакции, миалгия, редко - лихорадка.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения морацизина при беременности не проведено.

Имеются сообщения, что морацизин может выделяться с грудным молоком, поэтому при необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антиаритмическими средствами повышается риск развития аритмогенного действия; с ингибиторами МАО - риск развития аритмогенного действия повышается значительно.

При одновременном применении с варфарином описан случай развития кровотечения.

Полагают, что при одновременном применении с дигоксином возможно значительное увеличение интервала QT, что может привести к AV-блокаде.

При одновременном применении с циметидином повышается концентрация морацизина в плазме крови; с теофиллином - повышается концентрация теофиллина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять при кардиогенном шоке, инфаркте миокарда (подострый период), постинфарктном кардиосклерозе, коронарокардиосклерозе, СССУ (время восстановления функции синусового узла увеличивается, возможны синусовая брадикардия, временное прекращение активности или полная блокада синусового узла), AV-блокаде I степени, брадикардии, артериальной гипотензии, нарушении электролитного баланса - гипокалиемия, гиперкалиемия, гипомагниемия (возможно изменение характера действия морацизина), при проведении электрокардиостимуляции (увеличение риска развития аритмии), при печеночной и/или почечной недостаточности, кардиомегалии, выраженной гипертрофии миокарда, у пациентов в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не изучены).

При выраженных нарушениях функции почек требуются коррекция режима дозирования и тщательное мониторирование.

С осторожностью применяют у пациентов с электрокардиостимулятором, поскольку риск вызываемых морацизином аритмий может увеличиваться. Лечение рекомендуется начинать в стационаре из-за риска аритмогенного действия, связанного с применением морацизина. Развитие аритмогенного действия не зависит от дозы и наиболее вероятно в течение первой недели лечения.

Интервал после приема ингибиторов МАО и до начала приема морацизина должен составлять не менее 14 дней.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период применения необходима осторожность при управлении транспортными средствами или выполнении другой работы, требующей повышенного внимания, из-за возможного головокружения.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почечной недостаточности. При применении у пациентов с выраженными нарушениями функции почек требуются коррекция режима дозирования и тщательное мониторирование.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

Источник: http://drugs.thead.ru/Etmozin