Круарон



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рокурония бромид

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Недеполяризующий миорелаксант с короткой (ближе к средней) продолжительностью действия. Является конкурентным антагонистом ацетилхолина в отношении н-холинорецепторов нервно-мышечных синапсов скелетной мускулатуры. Практически не оказывает ганглиоблокирующего и м-холиноблокирующего действия, в незначительной степени влияет на высвобождение гистамина. Может вызывать тахикардию (в 30% случаев), влияние на ЧСС менее выражено, чем у панкурония бромида, и больше, чем у векурония бромида.

ED_{90} (доза, необходимая для подавления на 90% сократительной способности мышцы большого пальца на стимуляцию локтевого нерва) при в/в общей анестезии составляет примерно 0.3 мг/кг массы тела. После в/в введения в дозе 0.6 мг/кг (2 x ED_{90}) полная нервно-мышечная блокада достигается через 60-70 сек; общее расслабление скелетной мускулатуры, адекватное для любых хирургических вмешательств, - в течение 2 мин; клиническая продолжительность действия (время до спонтанного восстановления сократительной способности скелетных мышц до 25% от контрольного уровня) составляет 30-40 мин; среднее время спонтанного восстановления сократительной способности от 25 до 75% контрольного уровня (индекс восстановления) - 14 мин; общая продолжительность (время до спонтанного восстановления сократительной способности скелетных мышц до 90% контрольного уровня) - 50 мин.

Время достижения максимального эффекта зависит от дозы, возраста и выбора типа анестетика: у пациентов 18-64 лет при анестезии на фоне опиоидов/динитроген оксида в дозе 0.45 мг/кг - 3 мин, при дозе 0.6 мг/кг - 1.8 мин, 0.9 мг/кг - 1.4 мин, 1.2 мг/кг - 1 мин; для пациентов старше 65 лет при дозе 0.6 мг/кг - 3.7 мин, 0.9 мг/кг - 2.5 мин, 1.2 мг/кг - 1.3 мин.

У детей в возрасте 3 месяцев на фоне галотановой анестезии при дозе 0.6 мг/кг максимальный эффект развивается через 0.8 мин, при дозе 0.8 мг/кг - через 0.7 мин; у детей 1-12 лет при дозе 0.6 мг/кг - через 1 мин, 0.8 мг/кг - 0.5 мин. Продолжительность действия зависит от дозы и возраста: у пациентов 18-64 лет при дозе 0.45 мг/кг - 22 мин, 0.6 мг/кг - 31 мин, 0.9 мг/кг - 58 мин, 1.2 мг/кг - 67 мин; у пациентов старше 65 лет при дозе 0.6 мг/кг - 46 мин, 0.9 мг/кг - 62 мин, 1.2 мг/кг - 94 мин. У детей 3 мес продолжительность действия при дозе 0.6 мг/кг - 41 мин, 0.8 мг/кг - 40 мин; у детей 1-12 лет при дозе 0.6 мг/кг - 26 мин, 0.8 мг/кг - 30 мин. При дозах, превышающих 3 x $ED_{90,}$ условия интубации существенно не улучшаются; длительность действия, однако, увеличивается. Дозы, превышающие 4 x ED_{90}, не изучались. Длительность эффекта поддерживающих доз 0.15 мг/кг при использовании энфлурановой и изофлурановой анестезии у больных старческого возраста и у больных с заболеваниями печени и/или почек может быть несколько больше (примерно 20 мин), чем у больных без нарушений функции печени и/или почек (примерно 13 мин).

Фармакокинетика

Связывание с белками плазмы - 30%. Распределение имеет двухфазный характер. Период полураспределения в быстрой фазе - 1-2 мин, в медленной фазе - 14-18 мин. V_d- 0.26 л/кг; при печеночной недостаточности - 0.53 л/кг; у пациентов с трансплантатом почки - 0.34 л/кг; у детей 3-12 мес - 0.3 л/кг, 1-3 лет - 0.26 л/кг, 3-8 лет - 0.21 л/кг. Проникает через плацентарный барьер в незначительных количествах. Метаболизируется в печени с образованием слабоактивного метаболита - 17-дезацетил-рокурония. Выводится печенью и почками. В течение первых 12 ч почками выводится 13-30.8% от суммарной введенной дозы в виде неизмененного препарата. При печеночной недостаточности клиренс увеличивается в 2 раза. При анестезии на фоне опиоидов и динитроген оксида $T_{1/2}$ - 1.4 ч, на фоне изофлурана при нормальной функции печени - 2.4 ч, при печеночной недостаточности - 4.3 ч, с почечным трансплантатом - 2.4 ч; на фоне галотана $T_{1/2}$ у детей 3-12 мес - 1.3 ч, 1-3 лет - 1.1 ч, 3-8 лет - 0.8 ч. Кумулятивный эффект при многократном введении поддерживающих доз не наблюдался.

Показания к применению:

Для кратковременной миорелаксации (с целью проведения эндотрахеальной интубации и ИВЛ).

Противопоказания:

Младенческий возраст (до 3 мес), повышенная чувствительность к рокурония хлориду.

Способ применения и дозы:

Только в/в. При интубации, а также для поддержания миорелаксации на протяжении 30 мин (анестезия опиоидами и динитроген оксидом) или более продолжительной (на фоне галотана, изофлурана или энфлурана), в начальной дозе - 0.6 мг/кг. Для уменьшения продолжительности миорелаксации (22 мин - на фоне опиоидов/динитроген оксида и 12-15 мин - на фоне галотана, изофлурана или энфлурана) - 0.45 мг/кг.

Для достижения максимального миорелаксирующего эффекта и большей продолжительности действия применяют дозы - 0.9 мг/кг и 1.2 мг/кг на фоне опиоидов/динитроген оксида; продолжительность эффекта при этом составляет 58 и 67 мин соответственно. Поддерживающие дозы (вводят при восстановлении мышечной сократимости до 25% от контрольного уровня) - 0.1, 0.15 и 0.2 мг/кг обеспечивают увеличение продолжительности эффекта на 12, 17 и 24 мин соответственно.

При появлении ранних признаков мышечной активности после начальной дозы возможно применение в виде непрерывной инфузии с начальной скоростью 0.01-0.012 мг/кг/мин; в отдельных случаях для достижения необходимой миорелаксации допускается болюсное введение.

Скорость введения и доза подбираются и рассчитываются индивидуально, чтобы сократительная реакция скелетных мышц находилась на уровне 10% от контроля, доза в среднем - 4-16 мкг/кг/мин. У больных с избыточной массой тела или ожирением рекомендуется вести расчет, исходя из дозы на 1 кг мышечной массы. Если масса тела на 30% и более превышает "идеальную" массу тела, дозу следует уменьшить, пересчитав на "идеальную".

Применение в педиатрической практике: начальная доза 0.6 мг/кг на фоне общей анестезии галотаном обеспечивает достаточную миорелаксацию на протяжении 41 мин у детей от 3 до 12 мес и 27 мин - у детей 1-12 лет. Поддерживающие дозы, обеспечивающие миорелаксацию в течение дополнительных 7-10 мин, - болюсно 0.075-0.125 мг/кг или в виде непрерывной инфузии со скоростью 0.012 мг/кг/мин при восстановлении 10% мышечной активности (скорость ведения корректируют в зависимости от реакции пациента). У детей до 3 мес дозы не установлены.

У пациентов старше 65 лет для получения релаксации в течение 46, 62 или 94 мин применяют дозы 0.6, 0.9 или 1.2 мг/кг соответственно, на фоне опиоидов/динитроген оксида. Поддерживающие дозы - 0.1-0.15 мг/кг.

В качестве растворителей можно использовать 5% раствор декстрозы, 0.9% раствор натрия хлорида, раствор Рингер-лактата или стерильную воду для инъекций. Раствор пригоден в течение 24 ч после приготовления; неиспользованный раствор утилизируют.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - снижение или повышение АД; редко - аритмия (в т.ч. тахикардия).

Со стороны пищеварительной системы: редко - икота, тошнота, рвота.

Аллергические реакции: редко - ангионевротический отек, кожная сыпь, бронхоспазм, одышка.

Местные реакции: припухлость и боль в месте введения (при экстравазации).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности и в период лактации возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода или грудного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Эффект рокурония бромида усиливают общие анестетики (рекомендуется снижать скорость их инфузии на 40%), другие недеполяризующие миорелаксанты, аминогликозиды, полимиксин, тетрациклин, ванкомицин, бацитрацин, колистин, хинидин, метронидазол (в высоких дозах), диуретики, альфа-адреноблокаторы, бета-адреноблокаторы, тиамин, ингибиторы МАО, протамина сульфат, соли магния, суксаметоний, ГКС, минералокортикоиды.

Рокуроний бромид проявляет свойства антагониста антихолинэстеразных средств (в т.ч. прозерина, неостигмина, пиридостигмина). Аминофиллин, теофиллин, норэпинефрин, азатиоприн, кальция хлорид, призводные аминопиридина, фенитоин, крабамазепин уменьшают эффект.

Атропин, гиосциамин и другие антихолинергические средства повышают риск развития тахикардии.

Фенилэфрин в назальных каплях увеличивает риск возникновения у детей тахикардии, повышения АД и резистентности к миорелаксантам.

Фармацевтически несовместим с амфотерицином, амоксициллином, азатиоприном, цефазолином, дексаметазоном, диазепамом, эритромицином, фамотидином, фуросемидом, гидрокортизоном, инсулином, метилпреднизолоном, преднизолоном, триметопримом, ванкомицином, интралипидом.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при нарушение КЩР и электролитного баланса, ожоги, кахексия, тяжелая хроническая сердечная недостаточность, нарушения нервно-мышечной передачи (в т.ч. миастения), гипертензия в "малом" круге кровообращения, пороки сердца, печеночная и/или почечная недостаточность, пожилой возраст, беременность, период лактации.

При передозировке наблюдается чрезмерное снижение АД, коллапс, продолжительная релаксация мускулатуры, апноэ, шок. Лечение передозировки: ИВЛ, введение антагонистов миорелаксантов (неостигмина, пиридостигмина), симптоматическая терапия.

Усилению действия способствуют гипокалиемия (например, после тяжелой рвоты, диареи, дигитализации, диуретической терапии), гипермагниемия, гипокальциемия (например, после массивных гемотрансфузий), гипопротеинемия, дегидратация, ацидоз, гиперкапния, кахексия.

Перед применением необходимо устранить изменения pH крови, тяжелые электролитные нарушения, дегидратация.

При применении в дозе более 0.9 мг/кг массы тела возможно увеличение ЧСС, что может противодействовать брадикардии, вызываемой другими анестетиками или возникающей при стимуляции n.vagus.

Необходимо иметь в виду, что во время проведения общей анестезии, даже в отсутствие известных провоцирующих агентов, возможно развитие злокачественной гипертермии, поэтому специалисты должны осуществлять тщательный контроль за ранними проявлениями, подтверждающими диагноз злокачественной гипертермии. В экспериментальных исследованиях показано, что рокурония бромид является фактором, провоцирующим развитие злокачественной гипертермии.

Поскольку препарат вызывает паралич дыхательных мышц, необходимо проводить ИВЛ вплоть до адекватного восстановления самостоятельного дыхания.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В течение 24 ч после полного восстановления нервно-мышечной проводимости не рекомендуется управлять транспортом и заниматься потенциально опасными в плане травматизма видами деятельности.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять в пожилом возрасте.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в младенческом возрасте (до 3 мес). У детей старше 3 мес применение возможно согласно режиму дозирования.

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