Прокаинамид-Эском



Код АТХ:

- C01BA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Прокаинамид

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 класса IA, обладает мембраностабилизирующей активностью. Тормозит входящий быстрый ток ионов натрия, снижает скорость деполяризации в фазу 0. Угнетает проводимость, замедляет реполяризацию. Снижает возбудимость миокарда предсердий и желудочков. Увеличивает длительность эффективного рефрактерного периода потенциала действия (в пораженном миокарде - в большей степени). Замедление проводимости, которое наблюдается независимо от величины потенциала покоя, больше выражено в предсердиях и желудочках, меньше - в AV-узле. Непрямой м-холиноблокирующий эффект, по сравнению с хинидином и дизопирамидом, выражен меньше, поэтому парадоксального улучшения AV-проводимости обычно не отмечается. Влияет на фазу 4 деполяризации, снижает автоматизм интактного и пораженного миокарда, угнетает функцию синусного узла и эктопических водителей ритма у некоторых больных. Активный метаболит - N-ацетилпрокаинамид обладает выраженной активностью антиаритмических средств III класса, удлиняет продолжительность потенциала действия. Обладает слабым отрицательным инотропным эффектом (без существенного влияния на минутный объем), ваголитическими и вазодилатирующими свойствами, что обусловливает тахикардию и снижение АД, ОПСС. Электрофизиологические эффекты проявляются в уширении комплекса QRS и удлинении интервалов PQ и QT. Время достижения максимального эффекта при приеме внутрь 60-90 мин, при в/в введении - немедленно, при в/м - 15-60 мин.

Фармакокинетика

При приеме внутрь и в/м введении всасывание быстрое. Связывание с белками составляет 15-20%. Метаболизируется в печени с образованием активного метаболита N-ацетилпрокаинамида. Обычно около 25% введенного прокаинамида превращается в указанный метаболит; однако при быстром ацетилировании или нарушении функции почек превращению подвергается 40% дозы.

$T_{1/2}$ прокаинамида составляет 2.5-4.5 ч, а при нарушении функции почек - 11-20 ч; N-ацетилпрокаинамида - около 6 ч. Выводится почками, 50-60% в неизмененном виде, остальное количество - в виде метаболита. При нарушениях

функции почек или хронической сердечной недостаточности метаболит быстро накапливается в крови до токсических концентраций, при этом концентрация прокаинамида остается в допустимых пределах.

Показания к применению:

Желудочковые аритмии: экстрасистолия, пароксизмальная желудочковая тахикардия. Наджелудочковые аритмии. Пароксизм мерцательной аритмии или трепетания предсердий. Наджелудочковая тахикардия (в т.ч. синдром WPW).

Относится к болезням:

- Аритмия
- Желудочковая тахикардия
- Пароксизм
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

AV-блокада II и III степени (за исключением случаев применения электрокардиостимулятора), трепетание или мерцание желудочков, аритмии на фоне интоксикации сердечными гликозидами, лейкопения, повышенная чувствительность к прокаинамиду.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. При приеме внутрь начальная доза составляет от 250 мг до 1 г, далее при необходимости и с учетом переносимости - по 250-500 мг каждые 3-6 ч.

При в/м введении - по 50 мг/кг/сут в разделенных дозах каждые 3-6 ч.

При в/в струйном введении разовая доза - 100 мг, при необходимости возможны повторные введения до прекращения аритмии. При в/в инфузии доза составляет 500-600 мг.

Максимальные дозы: взрослым при приеме внутрь - 4 г/сут; в/в струйно при повторных введениях суммарная доза - 1 г.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия (вплоть до развития коллапса), внутрижелудочковые блокады, желудочковая тахикардия, тахиаритмия; при быстром в/в введении - коллапс, внутрижелудочковая блокада, асистолия.

Со стороны ЦНС: галлюцинации, депрессия, миастения, головокружение, головная боль, судороги, психотические реакции с продуктивными симптомами, атаксия.

Со стороны системы кроветворения: при длительном применении - угнетение костномозгового кроветворения (лейкопения, тромбоцитопения, нейтропения, агранулоцитоз, гипопластическая анемия), гемолитическая анемия с положительной пробой Кумбса.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Прочие: горечь во рту, при длительном применении - лекарственная красная волчанка (у 30% больных при длительности терапии более 6 мес); возможны микробные инфекции, замедление процессов заживления и кровоточивость десен в связи с риском лейкопении и тромбоцитопении.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При необходимости применения прокаинамида при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) следует учитывать, что активное вещество проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком. Поэтому применение прокаинамида возможно только в том случае, когда потенциальная польза для матери превосходит возможный риск для плода или младенца.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антиаритмическими средствами возможно аддитивное кардиодепрессивное действие; с антигипертензивными средствами - усиливается антигипертензивное действие; с антихолинэстеразными средствами - уменьшается эффективность антихолинэстеразных средств.

При одновременном применении с м-холиноблокаторами, антигистаминными препаратами усиливается их холинолитическое действие.

При одновременном применении усиливается действие средств, блокирующих нервно-мышечную передачу; при одновременном применении средств, вызывающих угнетение костномозгового кроветворения, возможно усиление лейкопении и тромбоцитопении.

При одновременном применении с амиодароном увеличивается интервал QT вследствие аддитивного действия на его продолжительность и риск развития желудочковой аритмии типа "пируэт". Повышается концентрация в плазме крови прокаинамида и его метаболита N-ацетилпрокаинамида, возможно усиление побочных эффектов.

При одновременном применении с каптоприлом возможно повышение риска развития лейкопении.

При одновременном применении с офлоксацином возможно повышение концентрации прокаинамида в плазме крови; с преniламином - усиливается отрицательное инотропное действие и риск развития желудочковой аритмии типа "пируэт".

При одновременном применении с соталолом, хинидином возможно аддитивное увеличение интервала QT.

При одновременном применении с триметопримом повышается концентрация в плазме крови прокаина и его активного метаболита N-ацетилпрокаинамида, возникает риск развития токсических реакций.

При одновременном применении с цизапридом значительно увеличивается продолжительность интервала QT вследствие аддитивного действия, возникает риск развития желудочковой аритмии (в т.ч. типа "пируэт").

При одновременном применении с циметидином повышается концентрация прокаинамида в плазме крови и риск усиления побочного действия, особенно у пациентов пожилого возраста и при нарушениях функции почек, что обусловлено уменьшением экскреции прокаинамида почками под влиянием циметидина почти на 1/3 и более.

Особые указания и меры предосторожности:

Аритмогенное действие прокаинамида было отмечено в 5-9% случаев. В связи с возможным угнетением сократительной способности миокарда и понижением АД следует с большой осторожностью применять при инфаркте миокарда. При выраженном атеросклерозе прокаинамид применять не рекомендуется.

С осторожностью применять при блокаде ножек пучка Гиса, аритмии на фоне интоксикации сердечными гликозидами, миастении, печеночной и/или почечной недостаточности, СКВ (в т.ч. в анамнезе), бронхиальной астме, хронической сердечной недостаточности в стадии декомпенсации, желудочковой тахикардии при окклюзии коронарной артерии, хирургических вмешательствах (в т.ч. в хирургической стоматологии), при удлинении интервала QT, артериальной гипотензии, атеросклерозе, при миастении, у пациентов пожилого возраста.

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 у пациентов пожилого возраста.

Источник: http://drugs.thead.ru/Prokainamid-Eskom