Пропафенон



Код АТХ:

- C01BC03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пропафенон

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 I C, блокатор натриевых каналов. Уменьшает максимальную скорость деполяризации фазы 0 потенциала действия и его амплитуду преимущественно в волокнах Пуркинье и сократительных волокнах желудочков, понижает автоматизм. Высокоэффективен при желудочковых аритмиях; при наджелудочковых нарушениях ритма эффективность несколько ниже. Пропафенон оказывает слабо выраженное бета-адреноблокирующее действие.

Фармакокинетика

Фармакокинетика пропафенона характеризуется значительными индивидуальными различиями.

После приема внутрь всасывание быстрое и практически полное - более 90%, C_{max} в плазме крови достигается через 1-3.5 ч. Связывание с белками 97%. Подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень с образованием 2 активных метаболитов - 5-гидроксипропафенона и N-деспропилпропафенона, которые обладают антиаритмической активностью, сравнимой с активностью пропафенона, но присутствуют в концентрациях, составляющих 20% от концентраций пропафенона.

$T_{1/2}$ у пациентов с интенсивным метаболизмом (более 90% случаев) - 2-10 ч, с замедленным метаболизмом (менее 10% случаев) - 10-32 ч. Выводится почками - 38% в виде метаболитов, 1% - в неизмененном виде; через кишечник - 53% в виде метаболитов.

Показания к применению:

Лечение и профилактика наджелудочковых и желудочковых экстрасистол, пароксизмальных нарушений ритма (наджелудочковая тахикардия, в т.ч. при синдроме WPW; желудочковая тахикардия).

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

Тяжелые формы хронической сердечной недостаточности, выраженная артериальная гипотензия, кардиогенный шок, выраженная брадикардия, СССУ, AV-блокада II и III степени, нарушения электролитного баланса, миастения, тяжелые обструктивные заболевания легких, печеночный холестаз, детский возраст, повышенная чувствительность к пропафенону.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь начальная доза - 450-600 мг/сут, при необходимости дозу увеличивают до 900 мг/сут.

При в/в капельном введении начальная доза - 500 мкг/кг, при необходимости дозу увеличивают до 1-2 мг/кг.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: возможны брадикардия, замедление синоатриальной, AV и внутрижелудочковой проводимости, снижение сократительной способности миокарда (у предрасположенных пациентов), аритмогенное действие; при приеме в высоких дозах - ортостатическая гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: при приеме в высоких дозах возможны тошнота, анорексия, чувство тяжести в эпигастрии, запор; редко - нарушения функции печени.

Со стороны ЦНС: при приеме в высоких дозах - головная боль, головокружение; редко - нарушение зрения.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Со стороны репродуктивной системы: олигоспермия.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антихолинергическими средствами возможно усиление антихолинергического действия.

При одновременном применении с антихолинэстеразными средствами (в т.ч. с пиридостигмином) уменьшается эффективность пиридостигмина при миастении.

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами, трициклическими антидепрессантами, местными анестетиками возможно усиление антиаритмического действия пропафенона при желудочковых аритмиях.

При одновременном применении пропафенон может потенцировать действие непрямых антикоагулянтов.

При одновременном применении с фенобарбиталом повышается выведение пропафенона из организма и уменьшается его концентрация в плазме крови. Полагают, что другие барбитураты взаимодействуют с пропафеноном таким же образом.

При одновременном применении с кетоконазолом описан случай развития судорог.

При одновременном применении возможно повышение концентраций в плазме крови пропранолола, метопролола, циклоспорина, дигоксина.

При одновременном применении с рифампицином уменьшается концентрация пропафенона в плазме крови и значительно уменьшается его терапевтическая эффективность. Это обусловлено тем, что рифампицин индуцирует изоферменты CYP3A4/1A2 и фазу II глюкуронизации пропафенона. Рифампицин не влияет на метаболизм пропафенона, обусловленный активностью изофермента CYP2D6.

При одновременном применении описаны случаи повышения концентрации теофиллина в плазме крови и развития токсических реакций.

Хинидин ингибирует метаболизм пропафенона в печени у лиц с высоким уровнем метаболизма, что приводит к значительному повышению его концентрации в плазме крови. При этом эффективность пропафенона не меняется, т.к. продукция его активного метаболита (5-гидроксипропафенона) одновременно уменьшается в 2 раза.

Хинидин повышает бета-блокирующие эффекты пропафенона у лиц с высоким уровнем метаболизма в печени, т.к. только исходное активное вещество, а не метаболиты, обладает бета-блокирующей активностью.

При одновременном применении с циметидином возможно небольшое повышение концентрации пропафенона в плазме крови и расширение комплекса QRS на ЭКГ.

При одновременном применении эритромицин может ингибировать метаболизм пропафенона.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при нарушениях функции печени, выраженных нарушениях функции почек, а также в комбинации с другими антиаритмическими средствами со сходными электрофизиологическими параметрами.

Лечение следует начинать в условиях стационара, поскольку повышен риск аритмогенного действия, связанного с применением пропафенона. Рекомендуется, чтобы предшествующая антиаритмическая терапия была прекращена до начала лечения пропафеноном в сроки, равные 2-5 периодам полувыведения.

Пропафенон характеризуется выраженными индивидуальными различиями значений концентрации активного вещества в плазме крови, поэтому рекомендуется тщательный подбор доз для каждого пациента.

В/в введение следует проводить под постоянным контролем АД, ЧСС и ЭКГ. Если во время курсового лечения или на фоне в/в введения отмечается уширение комплекса QRS или интервала QT более чем на 20%, по сравнению с исходными значениями, следует уменьшить дозу или временно отменить пропафенон. У пожилых пациентов, больных с массой тела менее 70 кг применяют пропафенон в более низких дозах.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью применяют у пациентов, занимающихся потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют при выраженных нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют при нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов применяют пропафенон в более низких дозах.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

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