Пропанорм



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]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
пропафенона гидрохлорид	150 мг,
что соответствует содержанию пропафенона	135.7 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая гранулированная, крахмал кукурузный, коповидон, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, натрия лаурилсульфат, гипромеллоза 5, макрогол 6000, титана диоксид, эмульсия диметикона с кремния диоксидом.

10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
пропафенона гидрохлорид	300 мг,
что соответствует содержанию пропафенона	271.05 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая гранулированная, крахмал кукурузный, коповидон, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, натрия лаурилсульфат, гипромеллоза 5, макрогол 6000, титана диоксид, эмульсия диметикона с кремния диоксидом.

10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиаритмический препарат класса IC, блокирует быстрые натриевые каналы. Обладает слабой β-адреноблокирующей активностью (соответствует примерно 1/40 части активности пропранолола) и м-холиноблокирующим эффектом. Антиаритмический эффект основывается на местноанестезирующем и прямом мембраностабилизрующем действии на миокардиоциты, а также на блокаде адренергических β-адренорецепторов и кальциевых каналов.

Местноанестезирующее действие приблизительно соответствует активности прокаина.

Пропафенон, блокируя быстрые натриевые каналы, вызывает дозозависимое снижение скорости деполяризации и угнетает фазу 0 потенциала действия и его амплитуду в волокнах Пуркинье и сократительных волокнах желудочков, угнетает автоматизм. Замедляет проведение по волокнам Пуркинье. Удлиняет время проведения по синоатриальному узлу и предсердиям. При применении пропафенона происходит удлинение интервала PQ и расширение комплекса QRS (от 15 до 25) на ЭКГ, а также интервалов AH и HV на гисограмме. Замедляя проведение, препарат удлиняет эффективный рефрактерный период в предсердиях, AV-узле, дополнительных пучках, и, в меньшей степени, желудочках. Не наблюдается каких-либо значительных изменений интервала QT. Электрофизиологические эффекты более выражены в ишемизированном, чем в нормальном миокарде. Оказывает отрицательное инотропное действие, которое обычно проявляется при снижении фракции выброса левого желудочка ниже 40%.

Действие препарата начинается через 1 ч после приема внутрь, достигает максимума через 2-3 ч и длится 8-12 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь абсорбируется более 95% пропафенона. Биодоступность препарата повышается нелинейно с увеличением дозы (с 5% до 12% при повышении разовой дозы со 150 мг до 300 мг, а при приеме в дозе 450 мг - до 40-50%). C_{max} достигается через 1-3.5 ч и составляет 500-1500 мкг/л.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови и внутренних органов составляет 85-97%.

Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер низкая. V_d - 3-4 л/кг.

Метаболизм

Пропафенон почти полностью метаболизируется. Описаны 11 метаболитов препарата, фармакологически активными являются 5-гидроксипропафенон и N-депропилпропафенон, обладающие сопоставимой с пропафеноном антиаритмической активностью. Окислительный метаболизм зависит от специфического цитохрома, активность которого генетически детерминирована.

Терапевтический диапазон концентрации пропафенона в плазме крови составляет 0.5-2 мг/л.

Выведение

$T_{1/2}$ у пациентов с интенсивным метаболизмом составляет от 2 до 10 ч, у пациентов с замедленным метаболизмом - от 10 до 32 ч.

Выводится с мочой - 38% в виде метаболитов (< 1% в неизмененном виде), с желчью - 53% (в виде глюкуронидов и сульфатов).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При печеночной недостаточности выведение снижается.

Показания к применению:

— профилактика и лечение наджелудочковых и желудочковых экстрасистолий;

— профилактика и лечение пароксизмальных нарушений ритма (наджелудочковые - фибрилляция и трепетаний предсердий, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта);

— профилактика и лечение предсердно-желудочковой re-entry тахикардии;

— профилактика устойчивой мономорфной желудочковой тахикардии.

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— тяжелые формы хронической сердечной недостаточности (в стадии декомпенсации), неконтролируемая хроническая сердечная недостаточность;

— кардиогенный шок (за исключением артериальной гипотензии, обусловленной тахикардией, и антиаритмического шока);

— выраженная брадикардия;

— выраженная артериальная гипотензия;

— синоатриальная блокада, нарушение внутрипредсердного проведения;

— блокада ножек пучка Гиса;

— внутрижелудочковая бифасцикулярная блокада и AV-блокада II и III степени (без установки электрокардиостимулятора);

— СССУ;

— синдром "тахикардии-брадикардии";

— инфаркт миокарда;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— интоксикация дигоксином;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при ХОБЛ, миастении (в т.ч миастения gravis), сердечной недостаточности (фракция выброса менее 30%), кардиомиопатии, артериальной гипотензии, печеночном холестазе, печеночной и/или почечной недостаточности, электролитных нарушениях (должны быть обязательно скорректированы до назначения пропафенона), пациентам в возрасте старше 70 лет, пациентам с постоянным или временным электрокардиостимулятором, при одновременном назначении с другими антиаритмическими средствами аналогичного действия на электрофизиологию сердца.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования устанавливается индивидуально и корректируется врачом.

Препарат принимают после еды. Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды.

Препарат назначают по 150 мг 3 раза/сут (каждые 8 ч). Суточная доза составляет 450 мг.

Дозу увеличивают постепенно (каждые 3-4 дня) до 600 мг/сут (разделенная на 2 приема) или максимально до 900 мг/сут (разделенная на 3 приема).

Если на фоне лечения отмечено расширение комплекса QRS или интервала QT более чем на 20% по сравнению с исходными значениями, либо удлинение интервала PQ более чем на 50%, удлинение интервала QT более чем на 500 мсек, увеличение частоты и тяжести аритмии, следует уменьшить дозу или временно прервать применение препарата Пропанорм.

У **пациентов старше 70 лет, а также у больных с массой тела <70 кг** применяются меньшие дозы (первую дозу дают в стационаре под контролем ЭКГ и АД).

При **нарушении функции печени** (возможна кумуляция) Пропанорм используется в дозах, составляющих 20-30% от обычной.

При **нарушении функции почек (КК<10 мл/мин)** начальная доза составляет 50% от исходной.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, AV-диссоциация, желудочковые тахиаритмии, стенокардия, ухудшение течения сердечной недостаточности (у больных со сниженной функцией левого желудочка), синоатриальная блокада, AV-блокада, нарушения внутрижелудочковой проводимости, наджелудочковые тахиаритмии, при приеме в высоких дозах - ортостатическая гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: изменение вкуса, сухость во рту, горечь во рту, тошнота, снижение аппетита, чувство тяжести в эпигастрии, запор или диарея; редко - нарушения функции печени, холестатическая желтуха, холестаз.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение; редко - нечеткость зрения, диплопия, судороги.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, агранулоцитоз, увеличение времени кровотечения, тромбоцитопения, появление антинуклеарных антител.

Со стороны половой системы: олигоспермия, снижение потенции.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, экзантема, покраснение кожи, крапивница, волчаночноподобный синдром.

Прочие: слабость, бронхоспазм, геморрагические высыпания на коже.

Передозировка:

При одномоментном приеме дозы, в 2 раза превышающей суточную, симптомы интоксикации могут появляться через 1 ч, максимум - через несколько часов.

Симптомы: стойкое снижение АД, тошнота, сухость во рту, рвота, мидриаз, сонливость, экстрапирамидные расстройства, спутанность сознания, брадикардия, удлинение интервала QT, нарушения внутрипредсердной и внутрижелудочковой проводимости, желудочковые тахиаритмии, пароксизмы полиморфной желудочковой тахикардии, синоатриальная блокада, AV-блокада, асистолия, кома, судороги, делирий, отек легких.

Лечение: промывание желудка, дефибрилляция, введение добутамина, диазепама; при необходимости - ИВЛ и непрямой массаж сердца. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение пропафенона при беременности, особенно в I триместре, возможно только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нельзя сочетать Пропанорм с лидокаином, т.к. усиливается кардиодепрессивный эффект.

При одновременном применении пропафенон повышает концентрацию пропранолола, метопролола, дигоксина (увеличивается риск развития гликозидной интоксикации), антикоагулянтов непрямого действия, циклоспорина в плазме крови.

При одновременном применении пропафенон усиливает действие варфарина (за счет блокирования метаболизма).

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами, трициклическими антидепрессантамии возможно усиление антиаритмического действия.

При одновременном применении с местными анестетиками увеличивается риск поражения ЦНС.

Циметидин и хинидин, замедляя метаболизм, повышают концентрацию пропафенона в плазме на 20%, рифампицин -

снижает.

При одновременном применении с пропафеноном амиодарон повышает риск развития тахикардии типа "пируэт".

Препараты, угнетающие синоатриальный узел и AV-узел и обладающие отрицательным инотропным действием, при одновременном применении с пропафеноном повышают риск развития побочных эффектов.

Препараты, угнетающие костномозговое кроветворение, при одновременном применении с пропафеноном увеличивают риск миелосупрессии.

Особые указания и меры предосторожности:

В течение курса лечения, особенно в начале терапии необходимо ЭКГ-мониторирование.

Лечение рекомендуется начинать в условиях стационара, поскольку повышен риск аритмогенного действия, связанного с применением пропафенона.

Пропанорм следует применять под контролем электролитного баланса крови (особенно концентрации калия) и ЭКГ; периодически следует определять активность печеночных трансаминаз.

При лечении желудочковых нарушений ритма пропафенон эффективнее антиаритмических препаратов IA и IB классов.

У пациентов с недостаточностью функции печени биодоступность пропафенона возрастает на 70%, у таких пациентов рекомендуется снизить дозу и проводить регулярный контроль лабораторных параметров.

Показания и дозу особенно осторожно необходимо определять для пациентов с установленным электрокардиостимулятором.

Необходимо проводить клиническое и лабораторное наблюдение за пациентами, проходящими долгосрочное лечение антикоагулянтами и гипогликемическими препаратами, при одновременном применении препарата Пропанорм.

В случае, если при лечении отмечаются синоатриальная блокада или AV-блокада III степени, или часто повторяющаяся экстрасистолия, то лечение необходимо прервать.

Учитывая возможность проаритмогенного воздействия, препарат рекомендуется применять только по назначению и под контролем врача.

Влияние на способность к вождению автотранспорта или управлению механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При **нарушении функции почек (КК<10 мл/мин)** начальная доза составляет 50% от исходной.

При нарушениях функции печени

При **нарушении функции печени** (возможна кумуляция) Пропанорм используется в дозах, составляющих 20-30% от обычной.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов старше 70 лет, а также у больных с массой тела <70 кг** применяются меньшие дозы (первую дозу дают в стационаре под контролем ЭКГ и АД).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре 15-25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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