ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

Прокаинамид - ЭСКОМ

Регистрационный номер:

Торговое название: Прокаинамид - ЭСКОМ

Международное непатентованное название: прокаинамид.

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Состав
1 мл раствора содержит:
активное вещество: прокаинамида гидрохлорида (в пересчете на прокаинамид) 100 мг,
вспомогательные вещества: натрия дисульфит, вода для инъекций.

Описание
Прозрачная бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: антиаритмическое средство.

КодАТХ: C01BA02.

Фармакологическое действие
Фармакодинамика
Антиаритмический препарат IA класса. 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 атриовентрикулярном (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 (N-АПА) обладает выраженной активностью антиаритмических лекарственных средств III класса, удлиняет продолжительность потенциала действия.
Обладает слабым отрицательным инотропным эффектом (без существенного влияния на минутный объем крови). Имеет ваголитические и вазодилатирующие свойства, что обу-

словливает тахикардию и снижение артериального давления (АД), общего периферического сосудистого сопротивления (ОПСС).
Электрофизиологические эффекты проявляются в уширении комплекса QRS и удлинении интервалов PQ и QT. Время достижения максимального эффекта при внутривенном введении (в/в) - немедленно, при внутримышечном (в/м) - 15-60 мин.

Фармакокинетика
Проникает через гематоэнцефалический барьер, секретируется с грудным молоком. Метаболизируется в печени с образованием активного метаболита - N-ацетил-прокаинамида, имеет эффект "первого прохождения". Около 25 % введенного прокаинамида превращается в указанный метаболит, однако при быстром ацетилировании или хронической почечной недостаточности (ХПН) превращению подвергается 40 % дозы. При ХПН или хронической сердечной недостаточности метаболит быстро накапливается в крови до токсических концентраций, при этом концентрация прокаинамида остается в допустимых пределах.
Период полувыведения - 2,5-4,5 часа; при ХПН - 11-20 ч.; N-ацетилпрокаинамида около 6 ч. Около 25 % введенного препарата выводится почками (50-60 % в неизмененном виде), с желчью.

Показания к применению
Желудочковые нарушения ритма: желудочковая тахикардия, желудочковая экстрасистолия. Предсердная тахикардия, мерцание и/или трепетание предсердий.

Противопоказания
Повышенная чувствительность к препарату; желудочковая аритмия, вызванная интоксикацией сердечными гликозидами, синоатриальная и атриовентрикулярная блокады II-III степени (при отсутствии имплантированного электрокардиостимулятора), хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, артериальная гипотензия, кардиогенный шок, системная красная волчанка (в том числе и в анамнезе), период грудного вскармливания, желудочковые тахикардии типа "пируэт", удлиненный интервал QT, лейкопения, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), трепетание или мерцание желудочков.

С осторожностью
В связи с возможным снижением сократимости миокарда и снижением АД следует с большой осторожностью назначать препарат при инфаркте миокарда. Возможно аритмогенное действие.
Блокада ножек пучка Гиса, атриовентрикулярная блокада I степени, миастения, бронхиальная астма, печеночная и/или почечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность, желудочковая тахикардия при окклюзии коронарной артерии, хирургические вмешательства (в т.ч. хирургическая стоматология), выраженный атеросклероз, пожилой возраст.

Применение при беременности
Применять только в том случае, когда польза для матери превосходит потенциальный риск для плода/ребенка.
При назначении препарата при беременности существует потенциальный риск развития артериальной гипотензии у матери, что может привести к маточно-плацентарной недоста-

точности.

Способ применения и дозы

Внутривенно: 100-500 мг со скоростью 25-50 мг/мин (под контролем АД и электрокардиограммы (ЭКГ)) до купирования пароксизма (максимальная доза - 1 г) или внутривенно капельно: 500-600 мг за 25-30 мин. Поддерживающая доза при внутривенном капельном введении - 2-6 мг/мин., при необходимости через 3-4 часа после прекращения инфузии начать прием препарата внутрь.

При сердечной недостаточности II степени дозу уменьшают (на 1/3 и более). Внутримышечно вводят по 5-10 мл (до 20-30 мл в сутки). При внутривенном введении препарат разводят в 5 % растворе глюкозы или растворе натрия хлорида 0,9 %. Скорость введения не должна превышать 0,05 г/мин. При этом необходим постоянный контроль частоты сердечных сокращений, АД и ЭКГ. Высшая доза для взрослых при внутримышечном и внутривенном (капельно) введении: разовая - 1 г (10 мл препарата), суточная - 3 г (30 мл препарата). При переходе на прием препарата внутрь, первая доза назначается через 3-4 часа после прекращения в/в инфузии.

Побочное действие

Со стороны центральной нервной системы: общая слабость, галлюцинации, депрессия, миастения, головокружение, головная боль, бессонница, судороги, психотические реакции с продуктивной симптоматикой, атаксия.

Со стороны пищеварительной системы: горечь во рту, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, желудочковая пароксизмальная тахикардия.

Со стороны органов чувств: нарушение вкуса.

При быстром в/в введении возможно развитие коллапса, нарушение предсер дной или внутрижелудочковой проводимости, асистолии.

Аллергические реакции: кожная сыпь.

Передозировка

Симптомы: препарат имеет малую терапевтическую широту, поэтому может легко возникнуть тяжелая интоксикация (особенно при одновременном применении других антиаритмических средств): брадикардия, синоатриальная и атриовентрикулярные блокады, асистолия, удлинение интервала Q-T, пароксизмы полиморфной желудочковой тахикардии, снижение сократимости миокарда, стойкая артериальная гипотензия, отек легких, судороги, кома, остановка дыхания.

Лечение: гемодиализ. При снижении АД – введение норэпинефрина или фенилэфрина.

Для лечения желудочковой тахикардии, вызванной передозировкой прокаинамида, не использовать антиаритмические средства IA или IC классов. Натрия гидрокарбонат способен устранить расширение комплекса QRS или артериальную гипотензию.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает эффект антиаритмических, гипотензивных, холиноблокирующих и цитостатических средств, миорелаксантов, побочные эффекты бретилия тозилата. При одновременном применении с антигистаминными средствами могут усиливаться атропиноподобные эффекты; с пимозодом - удлинение интервала Q-T. Снижает активность антимиастенических лекарственных средств. Циметидин, ранитидин снижают почечный клиренс прокаи-

намида и удлиняют период полувыведения.
При комбинированной терапии с антиаритмическими средствами III класса риск развития аритмогенного эффекта возрастает. Лекарственные средства, угнетающее костномозговое кроветворение, увеличивает риск миелосупрессии.

Особые указания
Перед в/в применением необходимо разводить, вводить со скоростью не более 50 мг/мин; следует применять лишь в условиях стационара. При проведении терапии необходимо проводить постоянный контроль АД, ЭКГ, формулы периферической крови (в конце терапии). У пациентов пожилого возраста более вероятно развитие артериальной гипотензии.

Форма выпуска
Раствор для внутримышечного и внутривенного введения 100 мг/мл.
По 5 мл препарата в ампулы.
По 5 или 10 ампул в контурных ячейковых упаковках из пленки поливинилхлоридной.
По 1 или 2 контурной ячейковой упаковке вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения
Список Б. В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
5 лет.
Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Претензии от покупателей принимает предприятие-изготовитель:
ОАО НПК «ЭСКОМ»
355107 г. Ставрополь, Старомарьевское шоссе, 9 «Г»
тел.:(8652) 94-68-08, факс: (8652) 94-68-12.

И. о. Директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Директор по развитию
ОАО Научно-производственного
концерна «ЭСКОМ» С.А. Рожнова