

Procaine HCl Amino 1% / 2%

Amino AG

(riassunto del foglietto illustrativo a cura di Farmacia Internazionale- per l'uso interno della Farmacia)

AMZV

composizione

Principio attivo: Procaini cloridrato.

Eccipienti : cloruro di sodio; Cloruro di potassio; Calcio chloride dihydricum Antiox.; Metabisolfito di sodio (E223) 0,744 mg / ml; Aqua ad iniectiones.

Forma galenica e quantità di ingrediente attivo per unità

Soluzione *iniezione* all'1% per uso intracutaneo: Procaini cloridrato 10 mg per 1 ml (20 mg / 2 ml, 50 mg / 5 ml, 100 mg / 10 ml).

Soluzione *iniezione* 2% per uso intracutaneo: Procaini cloridrato 20 mg per 1 ml. (40 mg / 2 ml, 100 mg / 5 ml).

Indicazioni / Applicazioni

La procaina viene utilizzata per l'applicazione intracutanea sulla pelle sana nel contesto della terapia neurale in vari tipi di dolore.

Dosaggio / Application

Procain HCl Amino deve essere iniettato solo da persone con conoscenze adeguate per la corretta attuazione delle rispettive applicazioni.

In linea di principio, solo le soluzioni a bassa concentrazione di procaina vengono applicate se utilizzate in modo continuo .

adulto

Il dosaggio è individuale. In linea di principio, dovrebbero essere utilizzate la concentrazione e la quantità più piccole possibili.

La seguente raccomandazione posologica si applica agli adulti con corporatura media: pustole della pelle per pustola fino a 10 mg.

La dose massima raccomandata per l'uso a dose singola nei tessuti per l'assunzione rapida del farmaco è di 500 mg di procaina.

Se utilizzato nelle aree della testa, del collo e dei genitali, la dose massima raccomandata di una volta è di 200 mg di procaina (entro 2 ore).

Nei pazienti con determinate condizioni preesistenti (occlusione vascolare, arteriosclerosi o danni ai nervi nel diabete), la dose deve essere ridotta di un terzo.

Pazienti con malattia epatica o renale

In caso di compromissione della funzionalità epatica o renale, possono verificarsi aumenti dei livelli plasmatici, specialmente con un uso ripetuto. In questi casi, si raccomanda anche un intervallo di dose inferiore.

Persone anziane

Negli anziani, si raccomanda un aggiustamento della dose in base alle rispettive condizioni generali.

Bambini e adolescenti

L'uso e la sicurezza di Procain HCl Amino nei bambini e negli adolescenti non è stato stabilito. Procain HCl Amino non deve pertanto essere usato nei bambini e negli adolescenti.

Controindicazioni

Reazioni allergiche agli anestetici locali di tipo estere (come procaina e benzocaina), sulfamidici, acido benzoico (parabeni) o uno qualsiasi degli ingredienti della composizione; Miastenia grave, malattie cardiache (insufficienza cardiaca e aritmia); ipotensione; ipovolemia; Pseudocholinesterasemangel; iniezione intraarteriosa, peridurale o spinale; Bambini e adolescenti.

Avvertenze e precauzioni

Si consiglia cautela:

- nei pazienti con epilessia
- con nota ipersensibilità ai solfiti
- nei disturbi del sistema di conduzione cardiaca
- per iniezione in un'area infiammata (infetta).

Se è nota l'allergia alla procaina, si può verificare un'allergia crociata ad altri anestetici locali dell'estere e sostanze chimicamente correlate sotto forma di allergia paragrale. La base chimica di questa allergia di gruppo è un gruppo amminico o idrossilico legato all'anello benzenico, che è in parastossione agli altri radicali. Anche con la forma cutanea di allergia alla procaina, un'allergia di gruppo può svilupparsi con sintomi corrispondenti di farmaci sulfa, antidiabetici orali, alcuni coloranti, ecc. Nell'allergia nota ai sulfamidici, una reazione allergica crociata alla procaina non può essere esclusa.

Nei pazienti con deficit di pseudocolinesterasi e attività enzimatica significativamente ridotta, i sintomi tossici associati all'applicazione di procaina devono essere sempre più attesi (vedere "Interazioni").

In linea di principio, prima dell'iniezione di un anestetico locale, è necessario assicurarsi che siano immediatamente disponibili gli strumenti per la rianimazione (ad esempio per mantenere libero il tratto respiratorio e per la fornitura di ossigeno) e i farmaci di emergenza per il trattamento delle reazioni tossiche. Devono essere disponibili tutte le misure di ventilazione, terapia anticonvulsivante e rianimazione (vedere "Sovradosaggio").

Se utilizzato nell'area del collo e della testa, esiste un grado di pericolo più elevato poiché aumenta il rischio di sintomi di intossicazione del sistema nervoso centrale.

Per evitare effetti collaterali, è necessario notare i seguenti punti:

In pazienti ad alto rischio e quando si usano dosi più elevate (oltre il 25% della dose singola massima per uso monodose), somministrare infusione endovenosa (volume di sostituzione).

- Seleziona il dosaggio il più basso possibile.
- Non utilizzare un additivo vasoconstrictore.
- Aspirare accuratamente in due piani prima dell'iniezione (rotazione della cannula).
- Rispettare la corretta conservazione del paziente.
- Faccia attenzione quando si inietta in aree infette (a causa di un maggiore assorbimento con ridotta efficacia).
- Fai l'iniezione lentamente.
- Controllare la pressione sanguigna, il polso e la larghezza della pupilla.

Va notato che quando trattati con anticoagulanti (anticoagulanti, come l'eparina), i farmaci antinfiammatori non steroidei o i sostituti del plasma non solo le lesioni vascolari accidentali nel contesto del trattamento del dolore possono portare a sanguinamenti gravi, ma che in generale deve essere previsto un aumento della tendenza al sanguinamento. Se necessario, il tempo di sanguinamento e il tempo parziale di tromboplastina (PTT), risp. Viene determinato il tempo di tromboplastina parziale attivato (aPTT), viene eseguito il test rapido e viene controllato il conteggio delle piastrine. Questi studi devono essere condotti anche in pazienti ad alto rischio in caso di profilassi con eparina a basso dosaggio (anticoagulante eparinico a basso dosaggio precauzionale) prima della somministrazione di Procain HCl Amino Injection Solutions.

L'iniezione con terapia preventiva concomitante per prevenire la trombosi (profilassi della trombosi) con eparina a basso peso molecolare deve essere effettuata solo con particolare attenzione

Persone anziane

Negli anziani, si raccomanda un aggiustamento della dose in base alle rispettive condizioni generali.

Attenzione: le soluzioni anestetiche locali contenenti un conservante o un antiossidante (ad es. Soluzioni in contenitori multidose) non devono essere utilizzate per anestesia endovenosa, intramuscolare, intratecale, epidurale (incluso caudale), intrabulbare o retrobulbare. Le soluzioni di iniezione di aminoacidi Procain HCl sono esclusivamente per uso intracutaneo.

interazioni

La procaina e altri anestetici locali di tipo estere riducono l'effetto antibatterico dei sulfamidici (formazione di acido p-aminobenzoico). Dovrebbero essere prese in considerazione le interazioni con vasocostrittori (ad es. Epinefrina, noradrenalina). La fisostigmina e l'ecotiopato potenziano l'azione della procaina e di altri anestetici locali di tipo estere (riduzione dell'attività della colinesterasi).

L'effetto della procaina è prolungato dai miorellassanti non depolarizzanti.

Procaine non deve essere usato in associazione con inibitori della colinesterasi. L'effetto sul metabolismo della procaina porta ad un aumento della tossicità della procaina. Altre proprietà farmacologiche degli inibitori della colinesterasi potrebbero anche influenzare la tossicità della procaina.

Gravidanza / allattamento al seno

In 1340 coppie madre-figlio, anomalie fetali non si sono verificate troppo frequentemente con l'uso di procaina nel primo trimestre. Finora non sono disponibili altri studi epidemiologici pertinenti.

Negli studi sugli animali, il potenziale di tossicità riproduttiva della procaina non è sufficientemente chiarito (vedere "Dati preclinici"). La procaina passa rapidamente e bene la placenta. Tuttavia, il rischio per il feto sembra essere basso poiché la procaina viene rapidamente divisa dall'idrolisi dell'estere. Procaine deve essere usato in gravidanza solo con un'attenta indicazione, anche se finora non sono stati resi noti rischi speciali.

La procaina viene escreta nel latte materno. A causa della rapida scissione dell'estere, il rischio di effetti neonatali è basso, ma l'emivita plasmatica è prolungata nel neonato.

Poiché finora non sono note conseguenze dannose per il bambino, di solito non sarà necessario un uso a breve termine di un'interruzione dell'allattamento al seno. Se è necessario un trattamento ripetuto o un trattamento con dosi più elevate, deve essere svezzato.

Effetto sulla capacità di guidare veicoli e usare macchinari

Non sono stati condotti studi.

Effetti avversi

Significativi effetti collaterali correlati alla dose di procaina comprendono il sistema nervoso centrale e il sistema cardiovascolare. La procaina può innescare cambiamenti dell'ECG (appiattimento dell'onda T, accorciamento del segmento ST). Un calo della pressione arteriosa può essere il primo segno di un sovradosaggio relativo in termini di effetti cardiotossici. I disturbi del nervo centrale possono essere malessere peri-orale, agitazione, delirio, convulsioni tonico-cloniche (vedere "Sovradosaggio").

Le categorie di frequenza per gli effetti collaterali si basano sulle seguenti categorie: comune (> 1/100, <1/10), non comune (> 1/1000, <1/100), raro (> 1 / 10'000, <1/1000), molto raro <1 / 10'000).

Disturbi del sistema immunitario

Raramente: reazioni allergiche (edema, prurito, attacchi di asma), reazioni anafilattiche / shock.

Malattie del sistema nervoso

Disturbi della vista e dell'udito, nistagmo, acufene, vertigini, brividi, disorientamento, perdita temporanea di coscienza, convulsioni, linguaggio confuso poco chiaro, tremore, singulto.

malattia cardiaca

Cardiotossicità con prolungamento dell'intervallo QT, effetto inotropico negativo, riduzione della velocità di conduzione, bradicardia sinusale, cianosi, perdita di coscienza, eventualmente fibrillazione ventricolare e / o asistolia.

Malattie del tratto gastrointestinale

Nausea, vomito

Patologie sistemiche e condizioni relative alla sede di somministrazione

Potrebbe esserci una transitoria sensazione di bruciore nel sito di iniezione. Edema, gonfiore, eritema, ematoma.

Altri sintomi, come agitazione, linguaggio, ansia, iperpernea, bradicardia, aumento della pressione sanguigna e mal di testa, possono anche essere dovuti all'aggiunta di agenti vasocostrittori come l'epinefrina.

overdose

Sintomi di ubriachezza

Procain HCl Amino agisce come uno stimolante nervoso centrale a basse dosi tossiche, mentre nelle aree ad alta tossicità si verifica la depressione delle funzioni centrali.

L'intossicazione da procaina cloridrato procede in 2 fasi:

1a stimolazione

CNS: sensazione anomala periorale, sensazione di intorpidimento della lingua, irrequietezza, delirio, convulsioni (tonico-clonico).

Cardiovascolare: aumento della frequenza cardiaca, aumento della pressione sanguigna, arrossamento della pelle.

2. Depressione

CNS: coma, arresto respiratorio.

Cardiovascolare: polso non palpabile, pallore, arresto cardiaco.

I pazienti con intossicazione da anestetico locale incipiente si distinguono innanzitutto per sintomi eccitatori. Diventi irrequieto, lamentando vertigini, disturbi acustici e visivi e formicolio, specialmente sulla lingua e *nella* zona delle labbra. La lingua è sbiadita, i brividi e le contrazioni muscolari sono portatori di un imminente attacco generalizzato. I livelli plasmatici subconvulsivi di procaina cloridrato spesso causano anche sonnolenza e sedazione dei pazienti. Le convulsioni sono prima di forma clonico-tonica. Con il progredire dell'intossicazione del sistema nervoso centrale, la disfunzione cerebrale del cervello aumenta con sintomi che vanno dalla depressione respiratoria e dal coma alla morte.

Una caduta della pressione sanguigna è spesso il primo segno di un effetto tossico sul sistema cardiovascolare. L'ipotensione è principalmente causata dall'inibizione o dal blocco della conduzione cardiaca. Tuttavia, gli effetti tossici sono clinicamente di importanza relativamente minore.

Terapia delle intossicazioni

Se si verificano sintomi di intossicazione centrale o cardiovascolare, sono necessarie le seguenti contromisure:

- Interruzione immediata della fornitura di Procain HCl Amino Injection Solution.
- Mantenere le vie respiratorie libere.
- Aggiungi ulteriore ossigeno; assistito con ossigeno puro se necessario o ventilato in modo controllato.
- Attento controllo della pressione arteriosa, del polso e della larghezza della pupilla.

Queste misure si applicano anche al caso di anestesia spinale totale accidentale, i cui primi segni sono irrequietezza, sussurro e sonnolenza; quest'ultimo può portare all'incoscienza e all'arresto respiratorio. Altre possibili contromisure sono:

In caso di un calo acuto e minaccioso della pressione sanguigna, il paziente deve essere immediatamente posto in posizione orizzontale con le gambe sollevate e un beta-simpaticomimetico lentamente iniettato per via endovenosa.

Inoltre, è necessario effettuare una sostituzione del volume (ad es. Con soluzioni di cristalloidi). A tono vagale elevato (bradicardia), viene somministrata atropina (da 0,5 a 1,0 mg iv). Se si sospetta un arresto cardiaco, è necessario eseguire le necessarie misure di rianimazione. Le convulsioni sono trattate con diazepam da 5 a 10 mg iv. In linea di principio, va notato che in molti casi, se i segni di convulsioni, la ventilazione di ossigeno obbligatoria per il trattamento è sufficiente. Gli analeptici ad azione centrale sono controindicati in caso di intossicazione da anestetici locali.

Proprietà / Effetti

Codice ATC: N01BA02

La procaina cloridrato è un anestetico locale di tipo estere di base. La base inibisce le funzioni delle strutture eccitabili, come le fibre nervose sensoriali, motorie e autonome e la conduzione del cuore. La procaina cloridrato abolisce in modo reversibile e locale la conduttività delle fibre nervose sensoriali. Dopo la sensazione di dolore, la sensazione di freddezza o calore, di tatto e pressione viene ridotta in ordine decrescente.

Il cloridrato di procaina ha effetti antiaritmici e di riduzione del tono sulla muscolatura liscia. Mostra anche una debole azione antistaminergica e parasimpatica.

Il cloridrato di procaina riduce la permeabilità della membrana per i cationi, specialmente per gli ioni sodio, in concentrazioni più elevate anche per gli ioni potassio. Questo porta alla concentrazione dipendente da una ridotta eccitabilità della fibra nervosa, poiché si riduce il repentino aumento della permeabilità al sodio necessaria per la formazione del potenziale d'azione. La stabilizzazione della membrana si basa sull'incorporazione degli anestetici lipofili locali nella membrana cellulare. Ciò provoca un'espansione non specifica della membrana, che blocca i canali ionici, in particolare i canali del sodio. Secondariamente, la penetrazione degli elettroliti è compromessa dalla parte idrofila della molecola anestetica locale, che sporge nel poro che trasporta l'acqua. Pertanto, l'effetto dipende dal pKa della sostanza e dal pH dell'ambiente, cioè, la proporzione di base non caricata che può permeare meglio dei cationi nella membrana del nervo lipofilo. Il pKa per procaina cloridrato è 9,1 a 25 ° C. Il rapporto tra forma dissociata e base liposolubile è determinato dal pH presente nel tessuto.

Il principio attivo si diffonde dapprima come una forma base attraverso la membrana nervosa fino alla fibra nervosa, ma agisce come catione di procaina solo dopo la reprotoneazione. A valori di pH bassi, ad esempio nel tessuto infiammatorio, nella forma di base sono presenti solo piccole quantità, in modo che non sia possibile ottenere un'anestesia sufficiente.

farmacocinetica

assorbimento

Il periodo di latenza dalla procaina all'inizio dell'azione è di 2-10 minuti, la durata dell'azione 1-2 ore. Le concentrazioni plasmatiche massime vengono raggiunte 10-45 minuti dopo l'iniezione sottocutanea.

distribuzione

La biotrasformazione della procaina non avviene nel tessuto, ma solo dopo la rimozione sul flusso sanguigno da parte delle plasma e delle esterasi epatiche. Il legame con le proteine plasmatiche è di circa il 6%. La procaina supera la barriera emato-encefalica in dosi terapeutiche. La procaina si presenta alla dose di 4 mg / kg di peso corporeo, la placenta. Non ci sono risultati sull'escrezione nel latte materno.

Metabolismo / eliminazione

Il tasso di degradazione della procaina è di circa 1 mg / kg / minuto. Durante l'idrolisi sorgono il dietilaminoetanolo e l'acido p-aminobenzoico che espandono la vasca. Il 70% di dietilaminoetanolo viene metabolizzato nel fegato, il 30% viene escreto immodificato nelle urine. circa L'80% dell'acido p-aminobenzoico viene eliminato invariato o come glucuronide. L'escrezione di tutti i metaboliti è renale.

Cinetica di gruppi di pazienti speciali

Secondo uno studio condotto negli adulti con funzionalità renale e / o epatica compromessa, è stata osservata un'idrolisi più lenta della procaina rispetto a soggetti sani. La riduzione del tasso di idrossilazione nei pazienti con insufficienza renale è proporzionale alla concentrazione plasmatica di urea.

Dati preclinici

Non sono disponibili studi a lungo termine per la valutazione di un potenziale cancerogeno. Gli studi di genotossicità in vitro sono risultati negativi con la procaina.

Il potenziale tossicologico riproduttivo della procaina non è sufficientemente chiarito. Ci sono indicazioni che la procaina nei feti di ratto può portare alla formazione di cataratta.

Altre note

incompatibilità

Poiché non sono disponibili studi di compatibilità, questo medicinale non deve essere miscelato con altri medicinali.

durabilità

Il farmaco può essere utilizzato solo fino alla data contrassegnata sul contenitore con "SCAD".

Le soluzioni di iniezione di aminoacidi Procain HCl non contengono conservanti. Dopo aver avviato la fiala, la soluzione rimanente deve essere eliminata

Istruzioni speciali per la conservazione

Conservare a temperatura ambiente (15-25 ° C) lontano dalla luce e lontano dalla portata dei bambini.

numero di targa

56503 (Swissmedic).

titolare dell'autorizzazione

Amino AG, Gebenstorf.

Stato delle informazioni

Novembre 2015.

confezioni

	lotto	CHF	Abgabekat.	Rückerstattungskat.
PROCAIN HCL 1% amino 20 mg / 2 ml	10 fiale da 2 ml		B	
	100 fiale 2 ml		B	
PROCAIN HCL 1% amino 50 mg / 5 ml	10 fiale 5 ml		B	
	100 fiale 5 ml		B	
PROCAIN HCL 1% amino 100 mg / 10 ml	10 fiale da 10 ml		B	
	100 fiale da 10 ml		B	
PROCAIN HCL 2% amino 40 mg / 2 ml	10 fiale da 2 ml		B	
	100 fiale 2 ml		B	
PROCAIN HCL 2% amino 100 mg / 5 ml	10 fiale 5 ml		B	
	100 fiale 5 ml		B	

Publicato il 28.06.2017