Изакардин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Изосорбида динитрат

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Концентрат для приготовления раствора для инфузий прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
изосорбида динитрат	1 мг	10 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид - 9 мг, вода д/и - до 1 мл.

10 мл - ампулы стеклянные с цветным кольцом излома (5) - кассеты из полиэтилентерефталата (2) - пачки картонные.
10 мл - ампулы стеклянные без цветного кольца излома (5) - кассеты из полиэтилентерефталата (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Периферический вазодилататор, влияющий преимущественно на венозные сосуды. Оказывает антиангинальное действие, вызывает гипотензивный эффект. Механизм действия связан с высвобождением оксида азота (эндотелиального релаксирующего фактора) в эндотелии сосудов, вызывающего активацию внутриклеточной гуанилатциклазы, следствием чего является повышение содержания цГМФ (медиатор вазодилатации), что, в конечном счете, приводит к расслаблению гладких мышц сосудов.

Изосорбида динитрат действует на периферические артерии и вены. Расслабление вен приводит к снижению венозного возврата к сердцу (преднагрузка), что снижает давление наполнения левого желудочка. Также происходит (хотя и в меньшей степени) расширение артериальных сосудов, что сопровождается снижением АД, уменьшением ОПСС (постнагрузка). Снижение пред- и постнагрузки приводит к снижению потребления кислорода

миокардом. Способствует перераспределению коронарного кровотока в пользу субэндокардиальных зон, особенно при атеросклерозе коронарных артерий (преимущественно крупных). Вазодилатация коллатеральных артерий может улучшать кровоснабжение миокарда. Купирует коронароспазм; улучшает гемодинамику у пациентов с хронической сердечной недостаточностью как в покое, так и при физической нагрузке.

Снижая потребление кислорода миокардом и улучшая доставку кислорода к ишемизированным участкам, уменьшает зону повреждения миокарда, расслабляет также гладкие мышцы бронхов, ЖКТ, желче- и мочевыводящих путей.

Фармакокинетика

Поскольку раствор Изакардина применяется в/в, то отсутствует эффект "первого прохождения" через печень.

Изосорбида динитрат метаболизируется благодаря участию ферментной системы глютатион-S-трансферазы. Активные метаболиты, образующиеся при отщеплении нитрогруппы, изосорбид-2-нитрат и изосорбид-5-нитрат, имеют $T_{1/2}$ от 1.5 до 2 ч или от 4 до 6 ч соответственно. $T_{1/2}$ изосорбида динитрата, введенного в/в, составляет 10 мин.

Показания к применению:

— купирование затяжного приступа стенокардии (в т.ч. нестабильная или вазоспастическая стенокардия);

— острый инфаркт миокарда;

— острая левожелудочковая недостаточность;

— контроль АД при его повышении перед и во время хирургических операций, особенно в сердечно-сосудистой хирургии.

Относится к болезням:

- Инфаркт миокарда
- Миокардит
- Стенокардия

Противопоказания:

— острое нарушение кровообращения (шок, коллапс);

— кардиогенный шок (если не проводятся мероприятия по поддержанию конечного диастолического давления);

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— констриктивный перикардит;

— тампонада сердца;

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД ниже 90 мм рт.ст.);

— тяжелая гиповолемия;

— тяжелая анемия;

— тяжелый аортальный и субаортальный стеноз, митральный стеноз;

— кровоизлияние в мозг;

— закрытоугольная глаукома;

— одновременный прием ингибиторов ФДЭ5 (в т.ч. силденафила, варденафила в предшествующие 24 ч, тадалафила в предшествующие 48 ч и более);

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим нитросоединениям.

С осторожностью:

— низкое давление наполнения левого желудочка, в т.ч. при остром инфаркте миокарда, нарушении функции левого

желудочка (например, при левожелудочковой недостаточности);

— аортальный и/или митральный стеноз;

— заболевания, сопровождающиеся повышенным внутричерепным давлением (до настоящего время повышение внутричерепного давления наблюдалось только после внутривенного введения нитроглицерина в высоких дозах);

— склонность к ортостатической гипотензии;

— тяжелая почечная недостаточность;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— гипотиреоз;

— недостаточное и неполноценное питание;

— беременность;

— период лактации.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования устанавливается индивидуально в соответствии с клиническим состоянием пациента и показателями гемодинамики.

Вводят в/в медленно. Рекомендуемая начальная доза от 1-2 мг/ч в зависимости от реакции больного (при условии мониторирования АД, ЧСС, ЭКГ и диуреза). Максимальная доза препарата составляет 8-10 мг/ч. Для пациентов с сердечной недостаточностью, как правило, требуются повышенные дозы - в отдельных случаях до 50 мг/ч. Средняя доза составляет приблизительно 7.5 мг/ч.

Пациентам, которые раньше принимали органические нитраты (например, изосорбида динитрат, изосорбида-5-мононитрат) можно вводить более высокие дозы препарата Изакардин для достижения желаемого гемодинамического действия.

Концентрат Изакардин 1 мг/мл следует вводить в растворенном виде в/в с помощью автоматических инфузионных систем (или в крайнем случае в виде капельной инфузии) в больничных условиях под постоянным мониторированием показателей сердечно-сосудистой системы.

Для приготовления раствора концентрацией 100 мкг/мл (0.01%) - 50 мл концентрата Изакардин 1 мг/мл (5 ампул по 10 мл) необходимо развести в 450 мл 0.9% раствора хлорида натрия.

Для приготовления раствора концентрацией 200 мкг/мл (0.02%) - 100 мл концентрата Изакардин 1 мг/мл (10 ампул по 10 мл) необходимо развести в 400 мл 0.9% раствора хлорида натрия.

Таблица расчета дозы препарата

Доза	**0.01% раствор**		**0.02% раствор**	
мг/ч	мл/ч	капли/мин	мл/ч	капли/мин
1	10	3-4	5	1-2
2	20	7	10	3
3	30	10	15	5
4	40	13	20	7
5	50	17	25	8
6	60	20	30	10
7	70	23	35	12
8	80	27	40	13
9	90	30	45	15
10	100	33	50	17

1 мл соответствует 20 каплям.

В зависимости от клинической картины, показателей гемодинамики и ЭКГ лечение может быть продолжено до 3 дней или дольше.

Побочное действие:

Возможные побочные эффекты приведены ниже по системам организма и частоте возникновения: очень часто (>1/10), часто (>1/100 и <1/10), нечасто (>1/1000 и <1/100), редко (>1/10 000 и <1/1000), очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - тахикардия, ортостатическая гипотензия; нечасто - парадоксальное усиление приступов стенокардии, коллапс (иногда сопровождающийся брадиаритмией и обмороком), преходящая гипоксемия вследствие относительного перераспределения кровотока в гиповентилируемые альвеолярные участки (у пациентов с ИБС - может приводить к гипоксии миокарда).

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота, рвота; очень редко - изжога.

Со стороны ЦНС: очень часто - головная боль; часто - сонливость, головокружение.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожные аллергические реакции (в т.ч. сыпь), гиперемия кожи лица; очень редко - ангионевротический отек, синдром Стивенса-Джонсона; частота неизвестна - эксфолиативный дерматит.

Общие расстройства: часто - астения.

Передозировка:

Симптомы: снижение АД менее 90 мм рт.ст., бледность, повышенное потоотделение, нитевидный пульс, тахикардия, постуральное головокружение, пульсирующая головная боль, слабость, головокружение, тошнота, рвота, диарея, метгемоглобинемия, цианоз с последующим развитием тахипноэ, чувства тревожности, утратой сознания и остановкой сердца.

Применение высоких доз препарата может вызвать повышение внутричерепного давления, что может вызвать церебральные симптомы.

Лечение: прекращают дальнейшее введение препарата. Следует опустить изголовье кровати и приподнять ноги больного. Как правило, АД при этом нормализуется в течение 15-20 мин после прекращения введения препарата.

В случае тяжелой артериальной гипотензии, должно быть произведено возмещение ОЦК. В исключительных случаях, для поддержания кровообращения можно ввести норэпинефрин (норадреналин) и/или допамин.

Введение эпинефрина (адреналина) и родственных ему соединений противопоказано!

При метгемоглобинемии в зависимости от степени тяжести назначаются в/в аскорбиновая кислота в форме натриевой соли; оксигенотерапия, гемодиализ, обменное переливание крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Изакардин при беременности и в период лактации возможно только в случае, если предполагаемая польза для матери превышает риск для плода и/или ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможно усиление гипотензивного действия при применении изосорбида динитрата с:

— гипотензивными средствами (например, бета-адреноблокаторами, диуретиками, блокаторами медленных кальциевых каналов, ингибиторами АПФ);

— сосудорасширяющими средствами (вазодилататорами);

— антипсихотическими средствами (нейролептиками);

— трициклическими антидепрессантами;

— этанолом и этанолсодержащими средствами.

При одновременном приеме препарата и ингибиторов ФДЭ5 (в т.ч. силденафила, тадалафила, варденафила) возможно потенцирование гипотензивного действия.

При одновременном применении с дигидроэрготамином возможно увеличение концентрации и усиление его

гипотензивного действия.

Изосорбида динитрат при в/в введении ослабляет антикоагулянтный эффект гепарина.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время лечения необходим контроль следующих показателей сердечно-сосудистой системы: АД (не ниже 100 мм рт.ст.), ЭКГ-мониторинг, ЧСС, объема мочеотделения (катетер).

Инфузионные материалы, сделанные из поливинилхлорида или полиуретана, вызывают потерю активного составляющего в результате адсорбции, что приходится восполнять за счет увеличения дозы. Приготовленный рабочий раствор препарата Изакардин следует предохранять от воздействия интенсивного света.

В случае выпадения кристаллов (помутнения) препарат использовать не рекомендуется. Раствор должен быть использован в течение 24 ч после разведения!

При нарушениях функции почек

С осторожностью: тяжелая почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: тяжелая печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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