Изакардин (спрей)



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:

Спрей подъязычный дозированный прозрачный, бесцветный или желтоватого цвета, со спиртовым запахом.

	1 доза	**1 фл.**
изосорбида динитрат	1.25 мг	375 мг

Вспомогательные вещества: макрогол 400 (полиэтиленоксид 400) - 1.8 г, этанол 96% - до 15 мл.

15 мл (300 доз) - флаконы темного стекла (1) с механическим насосом дозирующего действия и распылителем - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Стимулирует образование оксида азота (эндотелиального релаксирующего фактора) в эндотелии сосудов, вызывающего активацию внутриклеточной гуанилатциклазы, следствием чего является увеличение циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), медиатора вазодилатации. Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет снижения преднагрузки (уменьшает конечно- диастолический объем (КДО) левого желудочка и снижает систолическое напряжение его стенок). Обладает коронарорасширяющим действием.

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. Улучшая доставку кислорода к ишемизированным участкам, уменьшает зону повреждения миокарда.

Снижает приток крови к правому предсердию, способствует снижению давления в малом круге кровообращения и регрессии симптомов при отеке легких. Способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровообращением. Повышает толерантность к физической нагрузке у больных с ИБС, стенокардией.

Расширяет сосуды головного мозга, твердой мозговой оболочки, что может сопровождаться головной болью.

Как и к другим нитратам, развивается перекрестная толерантность. После отмены (перерыва в лечении) чувствительность к нему быстро восстанавливается. После распыления на слизистую оболочку полости рта эффект проявляется через 30 сек и продолжается 15-120 мин.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция высокая. Биодоступность через слизистую ротовой полости - 60%. Связывание с белками плазмы крови - 30%.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ составляет 60 минут. Метаболизируется в печени до двух активных метаболитов: изосорбида-5-мононитрата (доля которого составляет 75-85%, $T_{1/2}$ - 5 ч) и изосорбида-2-мононитрата (составляющего 15-25% с $T_{1/2}$ 2.5 ч). Выводится препарат почками (почти полностью в виде метаболитов).

Показания к применению:

— купирование приступов стенокардии;

— профилактика приступов стенокардии (в т.ч. перед физической нагрузкой);

— острый инфаркт миокарда (в т.ч. осложненный острой левожелудочковой недостаточностью);

— состояние после перенесенного инфаркта миокарда.

Относится к болезням:

- Инфаркт миокарда
- Миокардит
- Стенокардия

Противопоказания:

— острое нарушение кровообращения (шок, коллапс);

— тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД ниже 90 мм рт.ст., диастолическое АД ниже 60 мм рт.ст.);

— тяжелая гиповолемия;

— кардиогенный шок, если невозможна коррекция конечного диастолического давления левого желудочка с помощью внутриаортальной контрпульсации или препаратов с положительным инотропным действием;

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, констриктивный перикардит, тампонада сердца;

— тяжелый аортальный, субаортальный и митральный стеноз;

— кровоизлияние в мозг;

— тяжелая анемия;

— одновременный прием ингибиторов ФДЭ5 (в т.ч. силденафил, варденафил, тадалафил) - риск выраженного снижения АД;

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

— повышенная чувствительность к нитратам или другим компонентам препарата.

С *осторожностью:*

— при низком давлении наполнения левого желудочка, в т.ч. при остром инфаркте миокарда;

— при аортальнои или митральном стенозе;

— при склонности к ортостатическим реакциям (резкое снижение АД при изменении положения тела);

— при заболеваниях, сопровождающиеся повышением внутричерепного давления (в т.ч. геморрагический инсульт, черепно-мозговая травма);

— при тяжелой почечной недостаточности;

— при печеночной недостаточности (риск развития метгемоглобинемии);

— при гипертиреозе;

— при закрытоугольной глаукоме;

— в пожилом возрасте;

— при недостаточном и неполноценном питании;

— токсический отек легких.

Способ применения и дозы:

Изакардин спрей используют путем распыления на слизистую оболочку полости рта, под язык.

Раствор не следует вдыхать. Следует поднести спрей вплотную ко рту и, нажав на распылитель, впрыснуть раствор в полость рта:

— сделать глубокий вдох;

— задержать дыхание;

— впрыснуть раствор в рот (при этом может появиться легкое жжение языка);

— закрыть рот и около 30 секунд дышать через нос.

В одной дозе препарата содержится 1.25 мг изосорбида динитрата.

Для *купирования приступа стенокардии* или *перед физической или эмоциональной нагрузкой, которая может вызвать приступ*, нужно впрыснуть спрей в рот 1-3 раза с интервалом в 30 сек между впрыскиваниями на фоне задержки дыхания. Разовую дозу из 3 впрыскиваний для купирования приступа можно увеличить только по рекомендации врача.

При *остром инфаркте миокарда* и *острой сердечной недостаточности* терапию проводят под контролем АД, ЧСС и наблюдением врача, начинают с 1-3 вспрыскиваний, с 30 секундным интервалом между вспрыскиваниями; при отсутствии эффекта через 5 мин можно повторить 1 вспрыскивание; если улучшения не наступает, то через 10 мин еще раз повторить 1 вспрыскивание.

При первом применении препарата Изакардин спрей или при перерыве в использовании более суток следует несколько раз нажать на распылитель до появления первых капель раствора. При применении флакончик спрея нужно держать вертикально распылителем вверх. Избегать попадания спрея в глаза.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов приведена согласно классификации ВОЗ: очень часто (> 1/10), часто (> 1/100 и < 1/10), нечасто (> 1/1000 и < 1/100), редко (> 1/10000 и < 1/1000), очень редко (< 1/10 000), частота неизвестна (по имеющимся данным определить частоту развития не представляется возможным).

Со стороны ЦНС: очень часто - головная боль; часто - головокружение, сонливость, слабость, нечеткость зрительного восприятия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия, рефлекторная тахикардия; нечасто - "парадоксальное" усиление приступов стенокардии, коллапс (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: часто - жжение языка; нечасто - тошнота, рвота; очень редко - изжога.

Со стороны кожных покровов: нечасто - кожные аллергические реакции (в т.ч. кожная сыпь), "приливы" крови к коже лица; очень редко - ангионевротический отек, синдром Стивенса-Джонсона; частота неизвестна - эксфолиативный дерматит.

Прочие: часто - астения.

Возможно развитие толерантности, в т.ч. перекрестной к другим нитратам.

Передозировка:

Симптомы: выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.), бледность, повышенное потоотделение, нитевидный пульс, тахикардия, головокружение, головная боль, слабость, обморок, тошнота, рвота, диарея, метгемоглобинемия (сопровождающаяся тахипноэ, чувством тревоги, потерей сознания, остановкой сердца). При применении в высоких дозах может повышаться внутричерепное давление.

Лечение: в легких случаях - перевод пациента в положение "лежа" с приподнятыми ногами или с опущенным головным концом кровати; в более серьезных случаях, при выраженном снижении АД - восполнение ОЦК, введение норэпинефрина или других вазоконстрикторов (сосудосуживающих препаратов), например, фенилэфрин, допамин (применение эпинефрина не рекомендуется); при метгемоглобинемии - аскорбиновая кислота - 1 г внутрь или в форме натриевой соли в/в 0.1-0.15 мл/кг 1% раствора (до 50 мл), оксигенотерапия, ИВЛ, гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Изакардин спрей при беременности возможно только в случаях, когда ожидаемая польза превышает потенциальный риск для плода и ребенка, и должно проводиться под контролем врача.

При необходимости применения изосорбида динитрата в период грудного вскармливания грудное вскармливание рекомендуется прекратить, т.к. имеются сведения о проникновении нитратов в грудное молоко.

При необходимости экстренного применения препарата Изакардин спрей, например, для купирования приступа стенокардии, необходимо установить наблюдение за ребенком на предмет развития возможных побочных эффектов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможно усиление гипотензивного действия препарата Изакардин спрей при одновременном приеме с другими сосудорасширяющими средствами (вазодилататорами), гипотензивными средствами, бета-адреноблокаторами, блокаторами медленных кальциевых каналов, антипсихотическими средствами (нейролептиками) и трициклическими антидепрессантами, в сочетании с этанолом, а также - с ингибиторами ФДЭ5 (в т.ч. силденафилом, варденафилом, тадалафилом).

При одновременном применении с прокаинамидом, хинидином также возможно усиление гипотензивного эффекта.

При комбинации с амиодороном, пропранололом, блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамилом, нифедипином и другими) возможно усиление антиангинального эффекта.

Одновременное применение изосорбида динитрата с дигидроэрготамином может привести к увеличению концентрации в плазме крови последнего и, таким образом, усилить его гипертензивное действие.

При одновременном применении с м-холиноблокаторами (атропин) возрастает вероятность повышения внутриглазного давления.

Нитросоединения могут снижать терапевтический эффект норэпинефрина (норадреналина).

Барбитураты ускоряют метаболизм и снижают концентрацию нитросоединений в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

В период терапии необходим контроль АД и ЧСС. Следует избегать резкой отмены препарата, дозу снижать постепенно. Частое назначение и высокие дозы могут вызывать развитие толерантности, в этом случае рекомендуется отмена на 24-48 ч, или после 3-6 недель регулярного приема делать перерыв на 3-5 дней, заменив на это время препарат Изакардин спрей другими антиангинальными средствами.

Особенно тщательное врачебное наблюдение необходимо при остром инфаркте миокарда со сниженным давлением

наполнения желудочков.

Раствор содержит около 85% этанола. В период лечения препаратом Изакардин спрей следует исключить употребление этанола (алкоголя).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении препарата Изакардин спрей необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами (риск головокружения).

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности (риск развития метгемоглобинемии).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте, при температуре не выше 30°С, вдали от огня.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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