Изокет



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

Вспомогательные вещества: вода д/и, натрия хлорид, натрия гидроксида раствор 2М, хлороводородная кислота 1М (до pH 5.0-7.0).

10 мл - ампулы (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Механизм действия связан с высвобождением активного вещества оксида азота в гладкой мускулатуре сосудов. Оксид азота вызывает активизацию гуанилатциклазы и повышает уровень цГМФ, что приводит к расслаблению гладких мышц. Под влиянием изосорбида динитрата артериолы и прекапиллярные сфинктеры расслабляются в меньшей степени, чем крупные артерии и вены. Это частично обусловлено рефлекторными реакциями, а также менее интенсивным образованием оксида азота из молекул активного вещества в стенках артериол.

Действие изосорбида динитрата связано главным образом с уменьшением потребности миокарда в кислороде за счет уменьшения преднагрузки (расширение периферических вен и уменьшение притока крови к правому предсердию) и постнагрузки (уменьшение ОПСС), а также с непосредственным коронарорасширяющим действием. Изосорбида динитрат способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровоснабжением, снижает давление в малом круге кровообращения. При сердечной недостаточности способствует разгрузке миокарда за счет уменьшения преднагрузки.

Фармакокинетика

Метаболизм и выведение

Отсутствует эффект "первого прохождения" через печень. Подвергается метаболизму и вне печени под воздействием глютатион-S-трансферазы с образованием активного метаболита изосорбида-5-мононитрата, а также изосорбида-2-мононитрата.

$T_{1/2}$ изосорбида-5-мононитрата составляет 5 ч, изосорбида-2-мононитрата - 2.5 ч. $T_{1/2}$ изосорбида динитрата составляет около 20 мин.

Показания к применению:

— острый инфаркт миокарда с левожелудочковой недостаточностью;

— острая левожелудочковая недостаточность;

— сердечная недостаточность различной этиологии;

— нестабильная стенокардия.

Относится к болезням:

- Инфаркт миокарда
- Миокардит
- Стенокардия

Противопоказания:

— острая сосудистая недостаточность (шок, сосудистый коллапс);

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

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— констриктивный перикардит;

— тампонада сердца;

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

— первичные легочные заболевания (т.к. за счет относительного перераспределения кровотока в гиповентилируемые зоны может возникнуть гипоксемия);

— ИБС (т.к. перераспределение кровотока может привести к транзиторной ишемии миокарда);

— токсический отек легких;

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

— повышенная чувствительность к нитратным соединениям.

С *осторожностью* следует применять препарат при остром инфаркте миокарда со сниженным давлением наполнения левого желудочка (при этом требуется наблюдение врача).

С *осторожностью* следует применять препарат и при этом необходимо избегать снижения систолического АД ниже 90 мм рт.ст. при аортальном и/или митральном стенозе, склонности к ортостатическим реакциям, заболеваниях, которые сопровождаются повышением внутричерепного давления.

Способ применения и дозы:

Дозу следует подбирать индивидуально для каждого больного. Лечение следует начинать с низких доз, постепенно увеличивая до необходимой.

Начальная доза составляет 2-7 мг/ч. В отдельных случаях дозу можно увеличить до 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.

Раствор вводят в виде в/в инфузий с помощью автоматических инфузионных систем в больничных условиях под постоянным мониторированием показателей сердечно-сосудистой системы. В зависимости от вида и тяжести

заболевания, дополнительно к обычному обследованию (симптомы, контроль АД, ЧСС, диуреза), проводят инвазивные процедуры для определения гемодинамических параметров.

Для в/в введения используют системы из следующих материалов: полиэтилен, полипропилен и политетрафторэтилен. Инфузионные материалы, сделанные из поливинилхлорида или полиуретана, вызывают потерю активного вещества в результате адсорбции, что приходится восполнять увеличением дозы.

Концентрат раствора стерилен, не содержит консервантов. 0.1% раствор следует открывать в асептических условиях непосредственно перед использованием.

Приготовление раствора

Для приготовления раствора в концентрации 100 мкг/мл (0.01%) необходимо 50 мл 0.1% раствора (т.е. 5 ампул по 10 мл) развести до 500 мл.

Для приготовления раствора в концентрации 200 мкг/мл (0.02%) необходимо 100 мл 0.1% раствора (т.е. 10 ампул по 10 мл) развести до 500 мл.

Таблица расчета дозы

Раствор в концентрации 100 мкг/мл		**Раствор в концентрации 200 мкг/мл**		**Кол-во активного вещества**
Скорость инфузии		**Скорость инфузии**		
мл/ч	**капли/мин**	**мл/ч**	**капли/мин**	**мг/ч**
10	3-4	5	1-2	1
20	7	10	3	2
30	10	15	5	3
40	13	20	7	4
50	17	25	8	5
60	20	30	10	6
70	23	35	12	7
80	27	40	13	8
90	30	45	15	9
100	33	50	17	10

1 мл соответствует 20 каплям.

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

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при первом применении или при повышении дозы препарата возможно снижение АД и/или ортостатическая гипотензия, что может сопровождаться рефлекторным повышением частоты пульса, заторможенностью, а также головокружением и чувством слабости. В начале лечения может появляться головная боль ("нитратная" головная боль), которая, как правило, исчезает через несколько дней при дальнейшем применении препарата. В редких случаях при выраженном снижении АД может наблюдаться усиление симптомов стенокардии.

В единичных случаях наблюдаются коллаптоидные состояния, иногда с брадикардией и синкопэ (приступы с нарушением сознания, головокружением, связанные с расстройством мозгового кровообращения в результате нарушений ритма сердца, прежде всего, обусловленные значительным его урежением).

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, рвота.

Прочие: покраснение кожи, аллергические кожные реакции; в отдельных случаях - эксфолиативный дерматит.

Передозировка:

В настоящее время о случаях передозировки препарата Изокет не сообщалось.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности и в период лактации препарат следует использовать крайне осторожно, только в тех ситуациях, когда ожидаемая польза для матери значительно превышает возможный риск для плода или ребенка.

В *экспериментальных исследованиях* не выявлено повреждающего действия на плод.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Изокета с другими сосудорасширяющими средствами (вазодилататорами), гипотензивными препаратами, бета-адреноблокаторами, блокаторами кальциевых каналов, ингибиторами фосфодиэстеразы типа 5, применяемыми для лечения эректильной дисфункции (например, сильденафил), нейролептиками, трициклическими антидепрессантами, а также этанолом возможно усиление гипотензивного действия

При одновременном применении Изокета с дигидроэрготамином может отмечаться увеличение концентрации дигидроэрготамина в крови, что приводит к усилению его гипотензивного действия.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении препарата Изокет следует контролировать показатели сердечно-сосудистой системы: контроль АД (систолическое АД не ниже 100 мм рт.ст.), ЭКГ-мониторинг, ЧСС, объем мочеотделения (катетеризация мочевого пузыря).

Поскольку 0.1% раствор Изокета является перенасыщенным раствором, может наблюдаться кристаллизация вещества. Несмотря на то, что при обычных условиях это не влияет на активность препарата, в случае кристаллизации раствор использовать не рекомендуется.

Следует учитывать, что ампула уже надпилена под синей точкой, поэтому дополнительное надпиливание не требуется.

Условия хранения:

Срок годности препарата указан на картонной коробке и на ампулах. Не следует применять препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

Срок годности:

5 лет.

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