Нитроглицерин



Код АТХ:

- C01DA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Нитроглицерин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки сублингвальные в контурной ячейковой упаковке 10 или 20 шт.; в пачке картонной 1, 2, 3, 4, 5, 6, 8 или 10 упаковок или в контейнерах полимерных по 10, 20, 30, 40, 50 или 100 шт.; в пачке картонной 1 контейнер.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: нитроглицерин 0,5 мг

Вспомогательные вещества: кросповидон CL, лактоза, повидон 25, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксил коллоидный, кальция стеарат.

Описание:

Таблетки белого или почти белого цвета с плоской поверхностью, риской и фаской.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Венодилатирующее средство из группы нитратов. Нитраты способны высвобождать из своей молекулы оксид азота(II), являющийся естественным эндотелиальным релаксирующим фактором — медиатором прямой активации гуанилатциклазы. Повышение концентрации цГМФ приводит к расслаблению гладкомышечных волокон (преимущественно венул и вен). Оказывает антиангинальное и спазмолитическое действие, расслабляет гладкую мускулатуру сосудистых стенок, бронхов, желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей, мочеточников. При внутривенном введении вызывает быстрое уменьшение преднагрузки на сердце за счёт расширения периферических вен. Уменьшает приток крови к правому предсердию, способствует снижению давления в «малом» круге кровообращения и регрессии симптомов при отеке легких, снижает постнагрузку, потребность миокарда в кислороде (за счёт снижения преднагрузки, постнагрузки и напряжения стенок желудочков в связи с уменьшением объёма сердца). Способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровообращением. Оказывает центральное тормозящее влияние на симпатический тонус сосудов, угнетая сосудистый компонент формирования болевого синдрома. Вызывает расширение церебральных сосудов, чем объясняется головная боль при его применении. При длительном или частом применении нитратов пролонгированного действия наблюдается развитие толерантности к препарату (ослабление терапевтического эффекта). После перерыва чувствительность восстанавливается. С целью предотвращения возникновения толерантности рекомендуется соблюдать ежедневный, предпочтительно ночной «безнитратный интервал» в течение 8-12 ч. У большинства пациентов такая терапия является более эффективной, чем непрерывное лечение. При использовании в сублингвальных и буккальных формах приступ стенокардии устраняется через 1.5 мин, гемодинамический и антиангинальный эффект сохраняются до 30 мин и 5 ч соответственно. При нанесении мази антиангинальный эффект наблюдается через 15-60 мин и продолжается 3-4 ч. В таблетках ретард может предотвращать развитие приступов. После приема внутрь нитроглицерин в тонком кишечнике постепенно выделяется из капсулы и всасывается; действие наступает через 30-60 мин после приема и длится 4-6 ч (в течение этого периода в печени происходит его превращение в неактивные метаболиты). Трансдермальная терапевтическая система (ТТС) представляет собой плоскую многослойную систему, обеспечивающую после прикрепления пластыря на кожу непрерывное высвобождение нитроглицерина через проницаемую мембрану, регулирующую скорость его высвобождения из резервуара с лекарственным средством. Активное вещество постепенно проникает в кровеносные сосуды кожи, что обеспечивает его циркуляцию в системе кровообращения в относительно постоянных концентрациях в течение рекомендуемого для аппликации периода времени. Через 12 ч ТТС высвобождает 10 % первоначального содержания нитроглицерина. Поскольку из ТТС на каждый кв.см поверхности постоянно высвобождается одинаковое количество нитроглицерина, получаемая больным доза зависит исключительно от размера контактной поверхности системы. Непрерывную терапию ТТС можно проводить тем пациентам, у которых клинический эффект препарата в течение длительного периода времени практически не меняется. Эффект при использовании ТТС наступает через 0.5-3 ч и сохраняется до 8-10 ч.

Фармакокинетика

Быстро и полно абсорбируется с поверхности слизистых оболочек и через кожу. При приеме внутрь биодоступность составляет не более 10 % по сравнению с нитроглицерином, вводимым сублингвально (эффект «первого прохождения» через печень). При сублингвальном, буккальном и внутривенном введении исключается «первичная» печеночная деградация — нитроглицерин сразу попадает в системный кровоток. При сублингвальном приеме в дозе 0.5 мг биодоступность — 100 %, TCmax — 5 мин. Имеет очень большой объём распределения. Связь с белками плазмы — 60 %. Быстро метаболизируется при участии нитратредуктазы, с образованием ди- и мононитратов (активен только изосорбид-5-мононитрат), конечный метаболит — глицерин. Выводится почками в виде метаболитов. Общий клиренс составляет 25-30 л/мин, а T1/2 — 4-5 мин. При внутривенном введении T1/2 — 1-3 мин, общий клиренс — 30-78 л/мин. Через 2 ч после аппликации одного пластыря ТТС достигается та концентрация нитроглицерина в плазме, которая сохраняется в течение рекомендованного периода применения. Концентрация в плазме находится в прямой зависимости от площади контактной поверхности ТТС и практически не зависит от места аппликации пластыря (кожа груди, плеча или живота). Повторные аппликации ТТС не приводят к кумуляции нитроглицерина. Активное вещество быстро метаболизируется в печени глутатионредуктазой, воздействующей на органические нитраты. Кроме того, в эритроцитах происходит метаболизм нитроглицерина с помощью ферментативных реакций, происходящих при участии сульфгидрильных радикалов, а также при взаимодействии с восстановленным Hb. Благодаря короткому T1/2 в течение первого часа после удаления ТТС концентрация нитроглицерина в плазме падает ниже пределов обнаружения.

Показания к применению:

Препарат рекомендован к применению при следующих состояниях:

— ишемическая болезнь сердца (ИБС);

— лечение и профилактика стенокардии;

—реабилитация после перенесённого инфаркта миокарда.

Относится к болезням:

- Инфаркт миокарда
- Ишемическая болезнь сердца
- Стенокардия

Противопоказания:

Препарат не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— повышенная чувствительность к нитратам;

— черепно-мозговая гипертензия;

— тампонада сердца;

— изолированный митральный стеноз;

— констриктивный перикардит (состояния, сопровождающиеся снижением давления заполнения левого желудочка);

— неконтролируемая гиповолемия;

— сердечная недостаточность при нормальном или низком давлении в легочной артерии;

— коллапс;

— геморрагический инсульт;

— субарахноидальное кровоизлияние;

— недавно перенесенная травма головы;

— токсический отек легких;

— идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз;

— закрытоугольная форма глаукомы с высоким внутриглазным давлением;

— тяжелая анемия;

— гипертиреоз;

— возраст до 18 лет (безопасность применения не установлена);

— нарушение мозгового кровообращения;

— шок;

— артериальная гипотензия (сАД <90 мм рт.ст.);

— одновременный прием силденафила (Виагра);

— беременность;

— период грудного вскармливания.

С осторожностью (сопоставляя риск и пользу):

— тяжелая почечная недостаточность;

—печеночная недостаточность (риск развития метгемоглобинемии).

Способ применения и дозы:

Сублингвально. Нитроглицерин рекомендуется принимать по назначению врача.

Таблетку держат под языком до полного рассасывания, не проглатывая, сразу после возникновения боли — 0,5–1 мг на прием. У многих больных со стабильной стенокардией эффект наступает и от меньшей дозы (1/2–1/3 табл.), поэтому, если боль быстро проходит, остаток таблетки, не успевший рассосаться, рекомендуется выплюнуть. Обычно антиангинальный эффект проявляется уже через 0,5–2 мин; 75% больных отмечают улучшение в течение первых 3 мин, а еще 15% — в течение 4–5 мин. При отсутствии антиангинального действия, в течение первых 5 мин нужно принять еще 1 табл. нитроглицерина. При отсутствии терапевтического эффекта после приема 2–3 табл. нужно немедленно вызвать врача. Длительность действия после сублингвального приема — около 45 мин. При частых

приступах стенокардии принято назначать пролонгированные препараты нитроглицеринового ряда. Толерантность к сублингвальным формам нитроглицерина развивается нечасто, тем не менее при ее возникновении у некоторых больных дозу препарата приходится постепенно увеличивать, доводя ее до 2–3 табл.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: головокружение, «нитратная» головная боль, тахикардия, гиперемия кожи, жар, снижение АД; редко (особенно при передозировке) — ортостатический коллапс, цианоз.

Со стороны ЖКТ: сухость во рту, тошнота, рвота, боль в животе.

Со стороны ЦНС: редко (особенно при передозировке) — тревожность, психотические реакции, заторможенность, дезориентация, нечеткость зрения, головная боль (особенно в начале курса лечения, при длительной терапии уменьшается), головокружение и чувство слабости. Возможны аллергические реакции.

Передозировка:

Симптомы: снижение АД (<90 мм рт. ст.) с ортостатической дисрегуляцией, рефлекторная тахикардия, головная боль; может развиться астения; головокружение, повышенная сонливость, чувство жара, тошнота, рвота; при применении высоких доз (>20 мк/кг) — коллапс, цианоз, метгемоглобинемия, диспноэ и тахипноэ.

Лечение: при появлении симптомов передозировки немедленно уложить больного, приподнять ему ноги и срочно вызвать врача.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Во время беременности и грудного вскармливания прием препарата возможен только по жизненным показаниям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение с вазодилататорами, гипотензивными средствами, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами, БКК, прокаинамидом, трициклическими антидепрессантами, ингибиторами МАО, ингибиторами фосфодиэстеразы, а также этанолом, усиливает гипотензивный эффект.
Назначение с дигидроэрготамином может привести к повышению его содержания в крови и повышению АД (из-за повышения биодоступности дигидроэрготамина).
Одновременное назначение нитроглицерина и гепарина снижает эффективность последнего (после отмены препарата возможно существенное снижение свертываемости крови, что может потребовать снижение дозы гепарина).

Особые указания и меры предосторожности:

На фоне приема нитроглицерина возможно значительное снижение АД и появление головокружения при резком переходе в вертикальное положение из положения «лежа» или «сидя», при употреблении алкоголя, выполнении физических упражнений и жаркой погоде. К нитроглицерину, как и ко всем органическим нитратам, при частом применении развивается привыкание, при этом требуется повышение дозы.
При вождении транспортных средств и управлении механизмами, требующими повышенного внимания, следует иметь в виду, что прием нитроглицерина может привести к снижению скорости двигательной и психической реакции.
Выраженность головной боли на фоне приема нитроглицерина может быть уменьшена снижением его дозы и /или одновременным приемом валидола.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Срок годности:

2,5 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

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