Нитросорбид



Код АТХ:

- C01DA08

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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Антиангинальное средство. Механизм действия связан с высвобождением активного вещества оксида азота в гладкой мускулатуре сосудов. Оксид азота вызывает активацию гуанилатциклазы и повышает уровень цГМФ, что в конечном счете 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. Способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровоснабжением.

Повышает толерантность к физической нагрузке у пациентов с ИБС, стенокардией. При сердечной недостаточности способствует разгрузке миокарда за счет уменьшения преднагрузки. Снижает давление в малом круге

кровообращения.

Фармакокинетика

При приеме внутрь после всасывания из ЖКТ изосорбид динитрат подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч. При буккальном применении изосорбид динитрат быстро всасывается, C_{max} активного вещества в плазме достигается через 5-6 мин.

Метаболизируется с образованием активного метаболита изосорбида-5-мононитрата, $T_{1/2}$ которого составляет 5 ч, а также изосорбида-2-мононитрата с $T_{1/2}$ 2.5 ч.

$T_{1/2}$ изосорбида динитрата, в зависимости от применяемой лекарственной формы варьирует от 20 мин до 4 ч. Выводится почками и через кишечник.

Показания к применению:

Для приема внутрь, сублингвально, буккально: купирование и профилактика приступов стенокардии, восстановительное лечение после инфаркта миокарда. Хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии), некоторые формы легочной гипертензии, легочного сердца (в составе комбинированной терапии).

Для ингаляционного применения: купирование и профилактика приступов стенокардии; как средство скорой помощи при остром инфаркте миокарда и острой левожелудочковой недостаточности на догоспитальном этапе. Профилактика и лечение спазма коронарных артерий при использовании сердечного катетера.

Для в/в введения: острый инфаркт миокарда, в т.ч. осложненный острой левожелудочковой недостаточностью; нестабильная стенокардия; отек легких.

Для накожного применения: профилактика приступов стенокардии.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Инфаркт миокарда
- Миокардит
- Спазмы
- Стенокардия

Противопоказания:

Выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт.ст., диастолическое АД менее 60 мм рт.ст.), коллапс, шок, острый инфаркт миокарда с выраженной артериальной гипотензией, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, констриктивный перикардит, тампонада сердца, токсический отек легких, состояния, сопровождающиеся повышением внутричерепного давления (в т.ч. геморрагический инсульт, черепно-мозговая травма), закрытоугольная глаукома, одновременный прием силденафила (ингибитора ФДЭ), повышенная чувствительность к нитратам.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь разовая доза составляет 10-120 мг, частота приема 1-5 раз/сут, в зависимости от показаний и применяемой лекарственной формы.

При сублингвальном или буккальном применении разовая доза - 5-10 мг, частота приема зависит от показаний и реакции пациента на лечение.

При ингаляционном применении 1-3 дозы впрыскивают в полость рта с интервалом около 30 секунд на фоне задержки дыхания. При остром инфаркте миокарда и острой сердечной недостаточности начальная доза составляет 1-3 ингаляции. Если через 5 мин не наступает улучшения, ингаляции можно повторять при условии постоянного контроля АД и ЧСС. Для профилактики коронарного спазма в случае катетеризации следует применить 1-2 дозы непосредственно перед процедурой.

При в/в введении режим дозирования зависит от клинической ситуации и применяемой лекарственной формы.

Для накожного применения начальная доза - 1 г на ночь, перед сном, а при необходимости и утром.

Продолжительность лечения определяется в каждом случае индивидуально.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: головокружение, головная боль, тахикардия, преходящая гиперемия лица, ощущение жара, артериальная гипотензия; в отдельных случаях - усиление приступов стенокардии (парадоксальная реакция).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, появление ощущения легкого жжения языка, сухость во рту.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, нечеткость зрения; редко - ишемия мозга и коллапс.

Аллергические реакции: кожная сыпь.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение изосорбида динитрата при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с адсорбентами, вяжущими и обволакивающими средствами уменьшается абсорбция изосорбида динитрата.

При одновременном применении антигипертензивных средств, периферических вазодилататоров, блокаторов кальциевых каналов, бета-адреноблокаторов, антипсихотических средств (нейролептиков), трициклических антидепрессантов, ингибиторов ФДЭ, этанола возможно усиление гипотензивного эффекта.

При одновременном применении с антихолинергическими средствами возможны нарушения памяти и внимания у пациентов пожилого возраста.

При одновременном применении с симпатомиметическими средствами возможно снижение антиангинального эффекта изосорбида динитрата.

При одновременном применении с дигидроэрготамином возможно повышение концентрации и усиление действия дигидроэрготамина.

При одновременном применении с норэпинефрином уменьшается терапевтическое действие норэпинефрина.

При одновременном применении с силденафилом возникает риск развития тяжелой артериальной гипотензии и инфаркта миокарда.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями мозгового кровообращения, с аортальным и/или митральным стенозом; у пациентов, склонных к ортостатической гипотензии; у пожилых пациентов. В период лечения, особенно в случае постепенного увеличения дозы, необходим контроль АД и ЧСС.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения не рекомендуется водить транспортные средства и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, т.к. при регулярном применении изосорбид динитрат снижает способность к концентрации внимания и скорость психомоторных реакций.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применяют у пожилых пациентов.

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