

Нитроспринт



Код АТХ:

- [C01DA02](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Нитроглицерин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLS VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия покрытые оболочкой;

Спрей подъязычный дозированный;

Капсулы подъязычные;

Концентрат для приготовления раствора для инфузий;

Пленки для наклеивания на десну.

Состав:

Активное вещество: нитроглицерин.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Органотропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нитроглицерин - органическое азотсодержащее соединение с преимущественным венодилатирующим действием.

Эффекты нитроглицерина обусловлены его способностью высвобождать из своей молекулы оксид азота, являющийся естественным эндотелиальным релаксирующим фактором. Оксид азота повышает внутриклеточную концентрацию циклического гуанозинмонофосфата, что предотвращает проникновение ионов кальция в гладкомышечные клетки и вызывает их расслабление. Расслабление гладких мышц сосудистой стенки вызывает расширение сосудов, что снижает венозный возврат к сердцу (преднагрузка) и сопротивление большого круга кровообращения (постнагрузка). Это снижает нагрузку на сердце и потребность миокарда в кислороде. Расширение коронарных сосудов улучшает коронарный кровоток и способствует его перераспределению в области со сниженным кровообращением, что увеличивает доставку кислорода в миокард.

Уменьшение венозного возврата приводит к снижению давления наполнения правого предсердия, улучшению кровоснабжения субэндокардиальных слоев, снижению давления в малом круге кровообращения и регрессии симптомов при отеке легких. Нитроглицерин расслабляет гладкомышечные клетки бронхов, мочевыводящих путей, желчного пузыря, желчных протоков, пищевода, тонкой и толстой кишки.

Действие начинается быстро, эффект развивается в течение 1-1.5 минут и длится примерно 30 минут.

Фармакокинетика

Нитроглицерин очень быстро и достаточно полно всасывается в системный кровоток, после подъязычного применения через слизистую оболочку полости рта. Биодоступность составляет приблизительно 100%, так как исключается эффект "первого прохождения" через печень. Связь с белками плазмы крови - 60%. C_{max} в плазме крови достигается через 5 минут. Быстро метаболизируется при участии нитратредуктазы, с образованием ди- и мононитратов, конечный метаболит - глицерол. Выводится почками в виде метаболитов. Общий клиренс составляет 25-30 л/мин. После приема препарата под язык $T_{1/2}$ из плазмы крови составляет 2.5-4.4 минуты. Выводится почками; менее 1% дозы выделяется в неизмененном виде.

Показания к применению:

Препарат рекомендован к применению при следующих состояниях:

- купирование приступов стенокардии;
- профилактика приступов стенокардии перед физической нагрузкой.

Относится к болезням:

- [Стенокардия](#)

Противопоказания:

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

- повышенная чувствительность к органическим нитратам;
- шок, коллапс;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- одновременный прием ингибиторов фосфодиэстеразы 5 (такие как силденафил, варденафил или тадалафил), поскольку они потенцируют гипотензивное действие нитратов.

С осторожностью (сопоставляя риск и пользу): внутричерепная гипертензия, тампонада сердца, неконтролируемая гиповолемия, у больных с сердечной недостаточностью при нормальном или низком давлении в легочной артерии, артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление менее 90 мм рт. ст.), закрытоугольная форма глаукомы с высоким внутриглазным давлением, тяжелая анемия, гипертиреоз, токсический отек легких, субарахноидальное кровоизлияние, недавно перенесенная травма головы, геморрагический инсульт, состояния, сопровождающиеся снижением давления заполнения левого желудочка (острый инфаркт миокарда, изолированный митральный стеноз, констриктивный перикардит), идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз, гипертрофическая кардиомиопатия (возможно учащение приступов стенокардии), нарушение мозгового кровообращения, тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность (риск развития метгемоглобинемии).

Способ применения и дозы:

Внутрь, сублингвально, буккально, в/в, трансдермально, на кожу. Купирование стенокардии.

Таблетки, капсулы

Сублингвально (таблетку, капсулу держат под языком до полного рассасывания, не проглатывая), сразу после возникновения боли - 0.5-1 мг на прием. При необходимости для достижения более быстрого эффекта, капсулу следует сразу раздавить зубами, повторять прием капсулы можно через 30-40 мин. У многих больных со стабильной стенокардией эффект наступает и от меньшей дозы (1/2-1/3 таблетки), поэтому, если боль быстро проходит, остаток таблетки, не успевшей 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 0.5 мг нитроглицерина. При отсутствии терапевтического эффекта после приема 2 таблеток нужно немедленно вызывать врача. Длительность действия после сублингвального приема - около 45 мин. При частых приступах стенокардии целесообразно назначать пролонгированные формы нитратов. Если приступ стенокардии развивается на фоне лечения пролонгированными нитратами, для купирования острого приступа необходимо сублингвально принять нитроглицерин. 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 таблеток. Для профилактики стенокардии - внутрь, запивая водой, перед приемом пищи. В легких случаях - 1-2 таблетки по 2.9 мг 2-3 раза в сутки. В более тяжелых случаях - 1-2 таблетки по 5.2 мг 2-3 раза в сутки. Максимальная суточная доза - 34.8 мг. В связи с тем что биодоступность нитроглицерина из таблеток ретард низкая, рекомендуется при хорошей переносимости принимать по 1-3 таблетки одновременно регулярно 3-4 раза в течение суток либо периодически, за 30-40 мин до ожидаемой физической нагрузки. При недостаточном терапевтическом эффекте дозу можно постепенно увеличивать (но не более 2 таблеток на прием), а после наступления терапевтического эффекта - уменьшить.

Пленки для наклеивания на десну

1% раствор для сублингвального применения: купирование приступа - 1-2 кап сублингвально или 2-3 кап наносят на небольшой кусок сахара и держат его во рту, не проглатывая, до полного рассасывания. Буккально: пластинку с подобранной дозой нитроглицерина наклеивают на слизистую оболочку полости рта, обычно в области верхней десны над клыками или малыми коренными зубами. Для этого достаточно прижать пластинку пальцем к слизистой оболочке полости рта в течение нескольких секунд. Действие наступает практически немедленно и продолжается 3-4 ч и более. Для профилактики приступов стенокардии в течение 1-1.5 ч используют пленки 1 мг, в течение 2-3 ч - 2 мг. При необходимости увеличения поступления нитроглицерина в кровь (в т.ч. при интенсивной ходьбе, подъеме на несколько этажей) следует 2-3 раза лизнуть пленку языком, не сдвигая ее с места. Если физическая нагрузка превышает по продолжительности период рассасывания пленки, необходимо наклеить новую на противоположную сторону десны. Трансдермально: лечение начинают с аппликации одного пластыря ТТС 5 (0.2 мг/ч) в день. Для поддержания терапии суточная доза может быть увеличена, для чего прикрепляют дополнительный пластырь (0.2 мг/ч) и/или ТТС 10 (0.4 мг/ч). Максимальная суточная доза - аппликация 2 пластырей ТТС 10 (0.8 мг/ч). При ХСН рекомендуется начинать и проводить лечение в условиях стационара до перевода больного на необходимую поддерживающую дозу. Следует определить оптимальную дозу (с учетом клинической реакции и возможного побочного действия). При этом следует строго следить за появлением признаков передозировки (снижение АД и тахикардия).

Концентрат для приготовления раствора для инфузий

В/в введение нитроглицерина должно проводиться с индивидуальным подбором скорости введения препарата. Раствор вводят через автоматический дозатор или через обычную систему для в/в вливаний. Автоматический дозатор позволяет вводить даже неразведенный 0.1% раствор с точным дозированием ритма введения и общей дозы. Введение через обычную систему для переливания жидкостей обеспечивает выбор точной дозы путем подсчета числа капель. При использовании системы трубок из поливинилхлорида активное вещество абсорбируется и потери на стенках трубок составляют до 60% (целесообразно использовать полиэтиленовые и стеклянные трубки). Раствор быстро разрушается на свету, поэтому флаконы и систему для переливания необходимо экранировать светонепроницаемым материалом. Обычно используют инфузионный раствор с концентрацией 100 мкг/мл: концентрированный раствор разводят 0.9% раствором NaCl или 5% раствором декстрозы (не следует использовать др. растворители). Раствор вводят в/в капельно с начальной скоростью 5 мкг/мин. Скорость введения можно увеличивать каждые 3-5 мин на 5 мкг/мин (в зависимости от эффекта и реакции ЧСС, центрального венозного давления и систолического АД, которое может быть снижено на 10-25% от исходного, но не должно быть ниже 90 мм рт.ст.). Если при скорости введения 20 мкг/мин не получено терапевтического эффекта, дальнейший прирост скорости введения должен составлять 10-20 мкг/мин. При появлении ответной реакции (в частности, снижения АД) дальнейшее увеличение скорости инфузии не проводится или проводится через более продолжительные интервалы времени. Для достижения хорошего эффекта скорость введения 0.01% раствора нитроглицерина обычно не превышает 100 мкг/мин (1 мл/мин). При отсутствии эффекта от меньших доз и допустимом АД скорость введения 0.01% раствора может достигать 300 мкг/мин (3 мл/мин). Дальнейшее увеличение скорости нецелесообразно. Длительность лечения определяется клиническими показаниями и может составить 2-3 сут. Нитроглицерин для в/в введения при необходимости может вводиться повторно, через любые промежутки времени.

Спрей подъязычный

Распыляют подъязычно.

При первом использовании или после длительного неиспользования препарата рекомендуется, перед непосредственным применением, одну дозу «сбросить» в воздух для заполнения камеры насоса.

Препарат Нитроспринт необходимо использовать в положении «сидя», снять защитный колпачок, держать флакон вертикально, открыть рот и задержать на несколько секунд дыхание, нажать на дозирующий клапан, направив струю препарата под язык, закрыть рот на несколько секунд, не глотать препарат.

Для купирования приступа стенокардии – 0.4-0.8 мг (1-2 дозы) под язык. При необходимости можно применить повторно с 5-минутными интервалами, но не более 1.2 мг (3 дозы). Если в течение 15 минут приступ не купировался, необходимо немедленно обратиться к врачу.

С профилактической целью применяется 0.4 мг (1 доза) за 5-10 мин до предполагаемой нагрузки.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение артериального давления; редко - ортостатический коллапс, цианоз.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту.

Со стороны центральной нервной системы: головокружение, «нитратная» головная боль, слабость, редко - тревожность.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, зуд.

Местные реакции: жжение под языком, гиперемия кожи.

Передозировка:

Симптомы: снижение артериального давления (ниже 90 мм рт.ст.), ортостатическая гипотензия, рефлекторная тахикардия, головная боль; могут развиваться астеня, головокружение, повышенная сонливость, ощущение жара или озноб, тошнота, рвота.

Лечение: при появлении симптомов передозировки придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами и срочно вызвать врача.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности и во время грудного вскармливания требует тщательного сопоставления пользы для матери и риска для плода или ребенка и должно проводиться под строгим медицинском наблюдении.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение с вазодилататорами, ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, прокаинамидом, трициклическими антидепрессантами, ингибиторами моноаминоксидазы, диуретиками, с ингибиторами фосфодиэстеразы-5 (силденафил, варденафил, тадалафил), а также этанолом усиливает гипотензивный эффект. На фоне хинидина и прокаинамида может возникнуть ортостатический коллапс. Одновременное применение с дигидроэрготамином может привести к повышению его концентрации в крови и к повышению артериального давления (повышение биодоступности дигидроэрготамин).

Одновременное назначение нитроглицерина и гепарина снижает эффективность последнего, что может потребовать увеличения дозы (после отмены препарата может потребоваться снижение дозы гепарина).

Особые указания и меры предосторожности:

В остром периоде инфаркта миокарда и при развитии острой сердечной недостаточности назначают под строгим контролем за гемодинамикой. С осторожностью применяют при аортальном и митральном стенозе, у больных с гиповолемией и пониженным САД (менее 90 мм рт.ст.). При гипертрофической кардиомиопатии может вызвать учащение и/или утяжеление приступов стенокардии. При длительном бесконтрольном приеме нитроглицерина, назначении высоких доз больным с печеночной недостаточностью и детям возрастает риск метгемоглобинемии, проявляющейся цианозом и появлением у крови коричневого оттенка. В случаях развития метгемоглобинемии препарат необходимо срочно отменить и ввести антидот — метилтиониния хлорид (Метиленовый синий). При необходимости дальнейшего применения нитратов обязателен контроль за содержанием метгемоглобина в крови или замена нитратов на сиднонимини.

Для уменьшения риска развития побочных эффектов необходимо соблюдать осторожность при одновременном приеме с лекарственными средствами, обладающими выраженными гипотензивными и вазодилатирующими

Нитроспринт

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

свойствами; не рекомендуется прием препарата на фоне употребления алкоголя, в помещениях с высокой температурой окружающей среды (баня, сауна, горячий душ), а также прием нескольких таблеток одновременно либо последовательно за короткий промежуток времени при первом приеме.

Нельзя разжевывать таблетки и капсулы для того, чтобы купировать приступ стенокардии, т.к. в системный кровоток может поступить избыточное количество препарата из разрушенных микрокапсул через слизистую оболочку полости рта. При появлении головной боли и других неприятных ощущений в области головы улучшение достигается назначением валидола или капель ментола сублингвально. Нередко плохо переносятся только первые дозы, затем побочные эффекты ослабевают.

При одновременном применении с гепарином необходимо увеличивать дозу гепарина и строго контролировать частично активизированное тромбопластиновое время. С осторожностью применяют у пожилых пациентов. Не рекомендуется назначение буккальных форм больным с афтозным стоматитом, гингивитом, заболеваниями пародонта и корневой системы зубов, съёмными верхними зубными протезами.

Бесконтрольный прием может привести к развитию толерантности, выражающейся в уменьшении продолжительности и выраженности эффекта при регулярном применении или необходимости повышения дозы для достижения того же эффекта. При регулярном применении пролонгированных форм нитроглицерина, особенно пластырей и мазей, препарат почти все время присутствует в крови, поэтому риск развития толерантности значительно возрастает. Для предупреждения возникновения устойчивости необходим прерывистый прием в течение суток, или совместное назначение антагонистов кальция, ингибиторов АПФ, или диуретиков. Трансдермальные формы нитроглицерина рекомендуют снимать с тела на ночь, оставляя таким образом период, свободный от действия препарата. При этом следует остерегаться развития синдрома отмены, связанного с резким прекращением поступления нитроглицерина в организм и проявляющегося внезапным развитием приступов стенокардии.

При в/в введении возможно развитие тахифилаксии, что требует изменения дозировки в сторону увеличения. О степени толерантности можно судить по динамике давления в правом предсердии. Приближение показателя толерантности к 25% требует прекращения введения раствора. Имитировать развитие толерантности при внутривенном введении может снижение содержания нитроглицерина в растворе из-за нарушения техники введения, разрушения нитроглицерина при прямом воздействии световых лучей или его абсорбции на стенках пластиковой инфузионной системы (20–80% при использовании систем из поливинилхлорида, полистирол-бутадиена, целлюлозо-пропионата, латекса или полиуретана). Рекомендуется использовать системы из химически чистого стекла, полиэтилена, нейлона, тефлона, силикона. Не рекомендуется использовать слишком длинные гидропроводы. При в/в введении нитроглицерина необходимо учитывать, что после прекращения инфузий и при переводе больного на таблетированные (даже длительного действия) нитраты может возникнуть синдром отмены или недостаточной дозы, при этом возможно увеличение частоты осложнений в остром периоде инфаркта миокарда — учащение приступов стенокардии, нарастание явлений недостаточности кровообращения, рецидивирование инфаркта миокарда, формирование острой аневризмы сердца, увеличение частоты разрывов миокарда.

Условия хранения:

При температуре не выше 30°C, вдали от огня, в недоступном для детей месте.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Nitrosprint>