

Изакардин®

Международное непатентованное наименование - Изосорбида динитрат

Лекарственная форма - спрей подъязычный дозированный

Состав

Состав на 1 флакон (300 доз): *активное вещество* изосорбида динитрата водного в перерасчете на 100% изосорбида динитрат - 0,375 г (1 доза содержит 1,25 мг изосорбида динитрата); *вспомогательные вещества*: макрогол-400 (полиэтиленоксид-400) 1,8 г, этанол 96 % до 15 мл.

Описание

Прозрачная бесцветная или желтоватого цвета жидкость со спиртовым запахом.

Фармакотерапевтическая группа

Вазодилататоры из группы органических нитратов

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 артериального давления (АД), уменьшением общего периферического сопротивления сосудов (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 ишемической болезнью сердца (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 секунд и продолжается 15 - 120 минут.

Фармакокинетика:

Абсорбция высокая. Биодоступность через слизистую ротовой полости - 60 %. Связь с белками плазмы крови - 30 %. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 60 минут. Метаболизируется в печени до двух активных метаболитов:

изосорбида-5-моонитрата, - доля которого составляет 75 - 85 %, период полувыведения - 5 часов и изосорбида-2-моонитрата, составляющего 15 - 25 % с периодом полувыведения 2,5 часа. Выводится препарат почками (почти полностью в виде метаболитов).

Показания:

- Купирование приступов стенокардии;
- профилактика приступов стенокардии (в том числе перед физической нагрузкой);
- острый инфаркт миокарда (в том числе осложненный острой левожелудочковой недостаточностью);
- состояние после перенесенного инфаркта миокарда.

Противопоказания:

- Повышенная чувствительность к нитратам или другим компонентам препарата;
- 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 и тампонада сердца;
- тяжелый аортальный, субаортальный и митральный стеноз;
- кровоизлияние в мозг;

- тяжелая анемия;
- одновременный прием ингибиторов фосфодиэстеразы-5 (в т. ч., силденафил, варденафил, тадалафил) (риск выраженного снижения АД);
- возраст пациентов до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью:

Препарат необходимо применять с осторожностью:

- при низком давлении наполнения левого желудочка, в т.ч. при остром инфаркте миокарда;
- при аортальном или митральном стенозе;
- при склонности к ортостатическим реакциям (резкое снижение АД при изменении положения тела);
- при заболеваниях, которые сопровождаются повышением внутричерепного давления (в том числе, гемморагический инсульт, черепно-мозговая травма);
- при тяжелой почечной недостаточности, печеночной недостаточности (риск развития метгемоглобинемии);
- при гипертиреозе;
- при закрытоугольной форме глаукомы;
- в пожилом возрасте;
- при недостаточном и неполноценном питании.

Беременность и лактация:

Применение при беременности препарата Изакардин® спрей 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.

Способ применения и дозы:

Препарат Изакардин® спрей используется для распыления на слизистую полости рта, под язык.

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

- сделайте глубокий вдох;

- задержите дыхание;
- впрысните раствор в рот (при этом может появиться легкое жжение языка);
- закройте рот и около 30 секунд дышите 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 секунд 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, частоты сердечных сокращений (ЧСС) и наблюдением врача, начинают с 1-3 впрыскиваний, с 30 секундным интервалом между впрыскиваниями; при отсутствии эффекта через 5 минут можно повторить 1 впрыскивание; если улучшения не наступает, то через 10 минут еще раз повторить 1 впрыскивание. 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.

Побочные эффекты:

Частота побочных эффектов приведена согласно классификации Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто - более 1/10, часто - более 1/100 и менее 1/10, нечасто - более 1/1000 и менее 1/100, редко - более 1/10000 и менее 1/1000, очень редко - менее 1/10000, частота неизвестна (по имеющимся данным определить частоту развития не представляется возможным).

Со стороны центральной нервной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение, сонливость, 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 том числе перекрестной к другим нитратам.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение 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 высоких доз изосорбида динитрата 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 объема циркулирующей крови (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 внутривенно 0,1-0,15 мл/кг 1 % раствора (до 50 мл), оксигенотерапия, искусственная вентиляция легких, гемодиализ.

Взаимодействие:

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 - при применении ингибиторов фосфодиэстеразы-5 (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 (верапамил, нифедипин и др.) 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:

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 часов, 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 управлять транспортными средствами и механизмами:

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

Форма выпуска/дозировка:

Спрей подъязычный дозированный 1,25 мг/доза.

Упаковка:

По 15 мл (300 доз) во флаконы из коричневого стекла. Условия хранения:

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