

Состав

действующее вещество: glyceryl trinitrate;

1 таблетка содержит 0,5 мг нитроглицерина;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, крахмал картофельный; сахар; кросповидон; магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки сублингвальные.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, с плоской поверхностью. Возможна шероховатая поверхность таблетки.

Фармакотерапевтическая группа

Вазодилататоры, применяемые в кардиологии. Органические нитраты. Код АТХ C01D A02.

Фармакодинамика

Нитроглицерин действует непосредственно на гладкие мышцы преимущественно венозных и артериальных сосудов через нитратный рецептор, находящийся в гладкомышечных оболочке стенки сосудов. Нитроглицерин в гладких мышцах ферментативно превращается, образуя оксид азота (NO), что стимулирует активность гуанилатциклазы. Она отвечает за образование циклического гуанозин-3',5'-монофосфата (цГМФ), что является медиатором релаксации.

Влияет на процессы центральной регуляции сосудистого тонуса и деятельность сердца. Способствует высвобождению катехоламинов в мозге и сердце, что приводит к центральному угнетению симпатического и вазомоторного тонуса, косвенную симпатомиметическое действие на миокард, изменения конформации тропонин-тропомиозинового комплекса. Характер и интенсивность действия нитроглицерина на сердце и периферические сосуды зависит от взаимодействия центральных и периферических процессов. Подавление вазоконстрикторных рефлексов на коронарные сосуды, является результатом центрального угнетения болевых импульсов, способствует купированию приступов боли при стенокардии. Антиангинальное действие нитроглицерина обусловлено нормализующим влиянием на обмен электролитов и энергетику миокарда, а именно: на ключевые

показатели дыхательной цепи - соотношение окисленных и восстановленных форм никотинамидных коферментов, активность НАД-зависимых дегидрогеназ. Влияет на деятельность сердца и системную гемодинамику. Под влиянием нитроглицерина увеличивается ретроградный кровоток вследствие расширения и увеличения количества функционирующих коллатералей. Косвенная симпатомиметическое действие, а также кумуляция циклического аденозинмонофосфата (АМФ) в миокарде приводят к усилению его сократимости. Кроме этого, оксид азота эффективно подавляет как агрегацию, так и адгезию тромбоцитов. Снижение периферического сопротивления и уменьшения венозного возврата - эффекты, связанные с расслаблением гладких мышц сосудов, уменьшением пред- и постнагрузки на сердце. Расширение вен приводит к уменьшению количества крови, поступающей к сердцу, снижение преднагрузки, а расширение артерий - к уменьшению общего периферического сопротивления и снижению постнагрузки, что в конечном итоге облегчает работу сердца и улучшает коронарное кровообращение.

Происходит перераспределение кровообращения в миокарде в пользу очага ишемии, усиливается ионотропная функция миокарда. Снижаются конечно-диастолическое давление в левом желудочке и размеры сердца, улучшает кровоснабжение наиболее уязвимой к ишемии субэндокардиального участка миокарда. Ослабление периферического венозного и артериального сопротивления и давления наполнения сердца кровью способствует уменьшению затрат энергии левым желудочком и потребности миокарда в кислороде. Давление в легочных капиллярах снижается, что делает назначения нитроглицерина при инфаркте миокарда с отеком легких, а также при сердечной недостаточности. При ишемической гипокинезии отдельных участков миокарда восстанавливается его сократимость. Менингеальные сосуды расширяются, сосуды внутренних органов сужаются, снижается давление в системе легочной артерии вследствие вазодилатации и системного эффекта нитроглицерина. Нитроглицерин расслабляет гладкие мышцы бронхов, желчевыводящих путей, пищеварительного тракта и мочевыводящих путей. При экспериментальном исследовании не было выявлено тератогенного или токсического действия на эмбрион.

Фармакокинетика

При сублингвальному применению эффект развивается через 0,5-2 минуты; 75% больных отмечают улучшение в течение 3 минут, а еще 15% - в течение 4-15 минут.

Нитроглицерин, принятый сублингвально, абсорбируется слизистой оболочкой и поступает в основном в системный кровоток. Всасывается 60-75% принятой дозы.

Через 2-4 минуты после приема достигается максимальная концентрация в плазме крови - 2,3 мкг/л, через 8 минут - снижается на 50% и уже через 20 минут нитроглицерин почти не определяется в крови. Быстро метаболизируется в печени. Нитроэфиры многоатомных спиртов быстро подвергаются денитрации. Денитрованные метаболиты, например 1,2 и 3,4-динитрат, действуют слабее и имеют более длительный период полувыведения по сравнению с нитроглицерином. Период полураспада нитроглицерина - почти 30 минут. Отщепление нитрогрупп происходит последовательно как путем образования неорганических нитритов, так и с образованием нитратов. С органической части молекулы нитроэфиров образуются спирты, альдегиды и органические кислоты. Через 4 часа после применения препарата нитроэфиры (исходный продукт) почти не определяются. Активно метаболизируется в печени, почках и крови. Нитроэфиры расщепляются двумя путями: с помощью глутатионзависимой редуктазы, локализованной в основном в растворимой фракции гепатоцитов, и с помощью фермента, который не требует восстановленного глутатиона. Препарат метаболизируется в первую очередь в артерио-венозном сосудистом русле, диффундирует в клетки гладких мышц, где превращается в оксид азота. Незначительная часть препарата, преимущественно под влиянием глутатион-S-редуктазы, метаболизируется в печени до ди-, моонитрата и глицерина. При приеме внутрь большая часть препарата метаболизируется в печени (эффект «первого прохождения»). Значительная часть динитрата и моонитрата образует конъюгаты с глюкуроновой кислотой. Экскретируются метаболиты нитроглицерина главным образом почками, часть метаболитов выводится через легкие с выдыхаемым воздухом. Общий клиренс нитроглицерина составляет 25-30 л.

Период полувыведения - 4-5 минут. Период полувыведения метаболитов - 4 часа.

Показания

Купирования и кратковременная профилактика приступов стенокардии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к нитратам и вспомогательных компонентов лекарственного средства; церебральная ишемия, брадикардия (менее 50 уд/мин), артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление ниже 100 мм рт. ст., диастолическое артериальное давление ниже 60 мм рт. ст.), шок, коллапс, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, одновременное применение ингибиторов фосфодиэстеразы -5 (ФДЭ-5) (силденафила, тадалафила, варденафила), повышение внутричерепного давления, тампонада

сердца, закрытоугольная форма глаукомы с высоким внутриглазным давлением, токсический отек легких, кровоизлияние в мозг, недавно перенесенная травма головы, геморрагический инсульт, аортальный стеноз, состояния, сопровождающиеся снижением давления заполнения левого желудочка (острый инфаркт миокарда, изолированный митральный стеноз, констриктивный перикардит).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении с другими вазодилататорами, гипотензивными средствами, ингибиторами АПФ, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, ингибиторами фосфодиэстеразы (см. Раздел «Противопоказания»), диуретиками, трициклическими антидепрессантами, ингибиторами МАО, этанолом и этанолсодержащими препаратами, β -адреноблокаторами, прокаинамид, хинидином, новокаином усиливается гипотензивное действие нитроглицерина.

Ингибиторы фосфодиэстеразы (силденафила, тадалафила, варденафила) - противопоказано одновременное применение нитроглицерина с этими препаратами, поскольку существует риск неконтролируемой артериальной гипотензии, опасных для жизни сердечно-сосудистых осложнений.

Атропин и другие препараты, оказывающие М-холинолитическое действие, могут снижать эффект нитроглицерина вследствие снижения секреции и биодоступность препарата.

Применение с дигидроэрготамином может привести к повышению его концентрации в плазме крови и повышение артериального давления (вследствие повышения биодоступности дигидроэрготамин).

При одновременном применении с гепарином возможно снижение антикоагулянтного действия последнего (после отмены препарата возможно значительное снижение свертываемости крови, что может потребовать снижения дозы гепарина).

Фенобарбитал активирует метаболизм нитратов в печени. α -адреномиметики, гистамин, питуитрин, кортикостероиды, стимуляторы центральной нервной системы, яд пчел, змей, чрезмерная инсоляция снижают антиангинальный эффект нитроглицерина. Салицилаты повышают уровень нитроглицерина в крови, барбитураты ускоряют его метаболизм. Донаторы сульфгидрильных групп (каптоприл, ацетилцистеин, унитиол) восстанавливают сниженную чувствительность к нитроглицерину.

Особенности применения

Необходимо с осторожностью, сопоставляя риск и пользу, назначать препарат при: неконтролируемой гиповолемии, больным с сердечной недостаточностью при нормальном или низком давлении в легочной артерии, тяжелой анемии, гипертиреозе, нарушении мозгового кровообращения, тяжелой почечной и / или печеночной недостаточности (риск развития метгемоглобинемии).

Следует с осторожностью применять пациентам с выраженным церебральным атеросклерозом, пациентам пожилого возраста. В период лечения не допускается употребление алкоголя; противопоказаны посещения бани, сауны, горячий душ.

Таблетку нельзя разжевывать, поскольку через слизистую оболочку полости рта в системный кровоток может поступить избыточное количество действующего вещества.

К нитроглицерина, как и в других органических нитратов, при частом применении может развиваться привыкание (толерантность), которое требует повышения дозы. При длительном применении НИТРОГЛИЦЕРИНА, чтобы предотвратить возникновение толерантности, рекомендуется прерывистый прием препарата в течение суток (с интервалом 10-12 часов) или одновременное применение антагонистов кальция, ингибиторов АПФ или диуретиков. При развитии толерантности иногда следует временно отменить применение нитроглицерина (на несколько дней) и заменить его антиангинальными средствами других фармакотерапевтических групп.

Пациенту следует обязательно сообщить врачу о предыдущей реакции на прием лекарств этой группы.

При приеме нитроглицерина возможно значительное снижение артериального давления и появление головокружения при внезапном переходе в вертикальное положение из положения лежа или сидя; при применении алкоголя, при выполнении физических упражнений в жаркую погоду.

Если нечеткость зрения или сухость во рту сохраняются или значительно выражены, лечение необходимо прекратить.

Выраженность головной боли при приеме препарата может быть уменьшена снижением его дозы и / или одновременным приемом валидола.

Риск развития метгемоглобинемии, что проявляется цианозом и изменением цвета крови, возрастает при длительном бесконтрольном приеме нитроглицерина, приеме высоких доз препарата больным с печеночной

недостаточностью. В случае развития метгемоглобинемии нитроглицерин необходимо срочно отменить и применить антидот - метилтионинию хлорид (метиленовый синий). Если есть необходимость дальнейшего применения нитратов, обязательно следует контролировать содержание метгемоглобина.

Перед применением препарата впервые следует проконсультироваться с врачом!

Если у Вас установлен непереносимость некоторых сахаров, проконсультируйтесь с врачом, прежде чем принимать этот препарат.

Содержит 0,005 г сахарозы на дозу. С осторожностью применять больным сахарным диабетом.

Содержит 0,0289 г лактозы на дозу. С осторожностью применять больным сахарным диабетом.

Лекарственное средство противопоказано применять пациентам с редкими наследственными состояниями, такими как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

При управлении транспортными средствами или другими механизмами, требующими повышенного внимания, прием нитроглицерина может привести к снижению скорости реакции.

Применение в период беременности или кормления грудью

Применение нитроглицерина в период беременности и кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

Применять взрослым.

Назначая препарат впервые, необходимо исследовать его влияние на уровень артериального давления. Контроль за эффективностью применения нитроглицерина необходимо осуществлять по частоте сердечных сокращений и уровнем артериального давления.

При стенокардии нитроглицерин следует принимать сублингвально сразу после возникновения приступа. Обычная доза - 1 таблетка, для многих больных со

стабильной стенокардией эффективна и меньшая доза. Поэтому если боль быстро проходит, остаток таблетки, не успевшая полностью раствориться, рекомендуется выплюнуть. При отсутствии антиангинального действия в течение первых 5 минут необходимо принять еще 1 таблетку.

В случае отсутствия терапевтического эффекта после приема 2-3 таблеток необходимо немедленно вызвать врача (вероятность развития инфаркта миокарда)!

Нитроглицерин действует в течение 30 минут. При частых приступах стенокардии целесообразно назначать пролонгированные препараты нитроглицеринового ряда. Однако, если приступ стенокардии развивается при лечении пролонгированным нитратом, для купирования острого приступа необходимо применять нитроглицерин. Толерантность к сублингвальной форме нитроглицерина развивается редко, однако при ее возникновении у некоторых больных дозу препарата следует постепенно увеличивать, доводя ее до 2-3 таблеток.

Дети

Опыта применения препарата у детей нет, поэтому не рекомендуется его применять этой возрастной категории пациентов.

Передозировка

Симптомы: снижение артериального давления (ниже 90 мм рт. Ст.) с ортостатической дисрегуляцией, головная боль, сильное головокружение, обморок, частое сердцебиение, тошнота и рвота, одышка, выраженная слабость, сонливость, повышенная температура тела, ощущение жара, артериальная гипотензия, повышенное потоотделение, озноб.

При применении высоких доз (более 20 мкг/кг) - коллапс, цианоз губ, ногтей или ладоней, метгемоглобинемия, диспноэ и тахипноэ.

Лечение: перевести больного в горизонтальное положение с приподнятыми ногами, в тяжелых случаях назначать плазмозаменители, симпатомиметики, кислород, при метгемоглобинемии - метиленовый синий.

Побочные реакции

Со стороны ЦНС: нечеткость зрения, «нитратный» головная боль (особенно в начале курса лечения, при длительной терапии уменьшается), головокружение и чувство слабости, тревожность, психотические реакции, заторможенность,

дезориентация.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, рефлекторная тахикардия, редко (особенно при передозировке) - ортостатический коллапс, цианоз, метгемоглобинемия, покраснение лица.

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

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, в том числе кожные высыпания, зуд гиперемия кожных покровов, бледность, анафилактический шок.

Другие: возбудимость, нарушение зрения, обострение глаукомы, гипотермия, ощущение жара, нарушение дыхания, слабость.

Также сообщалось о единичных случаях побочных реакций: обострение ишемической болезни сердца вследствие гипоксии, полная блокада, асистолия, ангионевротический отек.

Иногда при внезапном снижении артериального давления может наблюдаться усиление симптомов стенокардии (парадоксальные "нитратные" реакции).

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С в оригинальной упаковке вдали от огня.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 40 таблеток в банках с маркировкой на украинском языке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ООО НПФ «МИКРОХИМ».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 93000, Луганская обл., г. Рубежное, ул. Ленина, д. 33.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).