

Состав

действующее вещество: 1 таблетка содержит нитроглицерина разбавленного (лактозой) в пересчете на нитроглицерин 0,5 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал картофельный, повидон, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, аспартам (Е 951), кросповидон, лактоза.

Лекарственная форма

Таблетки сублингвальные.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрической формы с фаской.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакодинамика

Нитроглицерин - периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на периферические сосуды.

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), который стимулирует растворимую гуанилатциклаза, отвечающий за образование циклического гуанозин-3'5'-монофосфата (цГМФ), который 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, косвенной симпатомиметической действия 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. Антиангинальная действие нитроглицерина обусловлена 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 цАМФ 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, снижению преднагрузки, а расширение артерий - к уменьшению общего периферического сопротивления и снижению постнагрузки, что в конечном итоге проявляется облегчением работы сердца и улучшением коронарного кровообращения.

Происходит перераспределение кровообращения в миокарде в пользу очага ишемии, усиливается ионотропная функция миокарда. Снижается 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 приводит к назначению 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. В экспериментальном исследовании не было выявлено тератогенного или токсического действия на эмбрион.

Фармакокинетика

После сублингвального применения эффект наступает уже через 0,5-2 минуты; 75% больных отмечают улучшение в течение первых 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, до 8-й минуты - 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 глутатионозависимой редуктазы, локализованной в основном в растворимой фракции гепатоцитов, и с помощью фермента, который не требует восстановленного глутатиона. Препарат метаболизируется в первую очередь в артериовенозном 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. Экскреция метаболитов нитроглицерина происходит 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 вспомогательным компонентам препарата, церебральная ишемия, геморрагический инсульт, кровоизлияние в мозг, повышение внутричерепного давления, недавно перенесенная травма головы, брадикардия (менее 50 уд/мин), артериальная гипотензия (систолическое АД ниже 100 мм рт. ст., диастолическое АД ниже 60 мм рт. ст.),

шок, коллапс, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, аортальный стеноз, состояния, сопровождающиеся снижением давления заполнения левого желудочка (острый инфаркт миокарда, изолированный митральный стеноз, констриктивный перикардит), тампонада сердца, токсический отек легких, закрытоугольная форма глаукомы с высоким внутриглазным давлением, одновременное применение ингибиторов фосфодиэстеразы-5 (ФДЭ-5) (силденафила, тадалафила, варденафила).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении с другими вазодилататорами, гипотензивными средствами, ингибиторами АПФ (АПФ), блокаторы «медленных» кальциевых каналов, диуретики, трициклическими антидепрессантами, ингибиторами МАО, этанолом и этанолсодержащими препаратами, β -адреноблокаторами, прокаинамид, хинидином, новокаинамидом усиливается гипотензивное действие нитроглицерина .

Ингибиторы фосфодиэстеразы (силденафил, тадалафил, варденафил) - противопоказано одновременное применение нитроглицерина с этими препаратами, поскольку существует потенциальная опасность 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, солнечные лучи снижают антиангинальный эффект нитроглицерина. Салицилаты повышают уровень нитроглицерина в крови, барбитураты ускоряют его метаболизм. Донаторы сульфгидрильных групп (каптоприл, ацетилцистеин, унитиол) восстанавливают сниженную

чувствительность к нитроглицерина.

Особенности применения

Необходимо с осторожностью, сопоставляя риск и пользу, принимать препарат при: неконтролируемой гиповолемии, сердечной недостаточности при нормальном или низком давлении в легочной артерии, тяжелой анемии, гипертиреозе, 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, для предотвращения возникновения толерантности рекомендуется прерывистый прием препарата в течение суток (с интервалом 10-12 часов) или одновременное назначение антагонистов кальция, ингибиторов АПФ или диуретиков. В случае необходимости при развитии толерантности иногда следует временно отменить применение нитроглицерина (на несколько дней) и заменить его антиангинальными средствами других фармакотерапевтических групп.

Перед применением препарата впервые следует проконсультироваться с врачом!

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

После приема 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 в случае длительного бесконтрольного приема нитроглицерина, приема высоких доз препарата больным с печеночной недостаточностью. При развитии метгемоглобинемии нитроглицерин необходимо срочно отменить и применить антидот - метилтионинию хлорид (метиленовый синий). В случае необходимости дальнейшего применения нитратов - обязательный контроль содержания метгемоглобина.

Аспартам (Е 951), который входит в состав препарата, является производным фенилаланина, который представляет опасность для больных фенилкетонурией.

Препарат содержит лактозу. Если у пациента установлена непереносимость некоторых сахаров, надо проконсультироваться с врачом, прежде чем принимать этот препарат.

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

Во время управления транспортными средствами и другими механизмами, требующими повышенного внимания, следует помнить, что 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 эффективности применения препарата необходимо осуществлять с частотой сердечных сокращений и уровнем артериального давления.

Необходимо принимать сразу при первых же симптомах приступа стенокардии.

Сразу после возникновения боли 1 таблетку положить под язык и держать во рту до полного рассасывания, а не глотая. Обычная доза - 1 таблетка под язык. При отсутствии антиангинального действия в течение 3-5 минут нужно принять еще 1 таблетку препарата.

При отсутствии терапевтического эффекта после приема 2-3 таблеток необходимо вызвать врача.

При частых приступах стенокардии целесообразно применять препараты пролонгированного действия.

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

Опыт применения препарата у детей ограничен, 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: снижение артериального давления, рефлекторная тахикардия, редко (особенно при передозировке) - ортостатический коллапс, цианоз, метгемоглобинемия, покраснение лица.

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

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, в том числе кожная сыпь, крапивница, 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 в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 40 таблеток в контейнере в коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Общество с ограниченной ответственностью «Фармацевтическая компания» Здоровье ».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 61013, Харьковская обл., г. Харьков, улица Шевченко, дом 22.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника —

Государственного реестра лекарственных средств Украины.