



ИНСТРУКЦИЯ
(информация для специалистов)
по медицинскому применению лекарственного средства
НИТРОГЛИЦЕРИН

Торговое название: Нитроглицерин.

Международное непатентованное название: Glyceryl trinitrate.

Описание: таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы, с фаской и риской.

Состав

Каждая таблетка содержит: нитроглицерина (в виде нитроглицерина с глюкозой) – 0,5 мг;
вспомогательные вещества: крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный безводный, кальция стеарат, лактоза моногидрат.

Форма выпуска: таблетки подъязычные 0,5 мг.

Фармакотерапевтическая группа

Периферические вазодилататоры, применяемые при лечении заболеваний сердца. Органические нитраты.

Код АТС: C01DA02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Нитроглицерин - соединение из группы органических нитратов, которое оказывает дилаторное действие на артерии и вены.

Посткапиллярные цепи периферических сосудов, крупные артерии и особенно участки коронарных сосудов, которые все еще реактивные, более чувствительны к нитроглицерину, чем резистентные (прекапиллярные) сосуды. Расширение кровеносных сосудов в большом круге кровообращения увеличивает венозную емкость и, как следствие, уменьшает венозный приток крови к сердцу (преднагрузку), размер желудочка и давление наполнения кровью сердца. Благодаря этому снижается потребность миокарда в энергии и кислороде, кровоснабжение уязвимых к ишемии субэндокардиальных слоев стенок, при этом улучшаются также региональная подвижность стенок и ударный объем сердца. Расширение крупных артерий, которые находятся возле сердца, уменьшает системный и легочный сосудистый сопротивление. Нитроглицерин проявляет также миорелаксирующее действие на гладкие мышцы бронхов, желче- и мочевыводящих путей, желчного пузыря, толстого и тонкого кишечника, сфинктеров. Предполагается, что нитроглицерин проявляет эти эффекты благодаря связыванию с так называемыми нитратными рецепторами, находящимися на оболочке клеток гладких мышц. В гладких мышцах из нитроглицерина посредством ферментативного превращения, образуется оксид азота (NO), который стимулирует растворимую гуанилатциклазу, отвечающий за образование циклического гуанозин-3'5'-монофосфата (цГМФ), который расслабляет гладкие мышцы.

Фармакокинетика

Всасывание

Быстро и полностью всасывается с поверхности слизистых оболочек. При сублингвальном применении сразу же попадает в системный кровоток. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 5 минут.

Распределение

Препарат имеет большой объем распределения. Связь с белками плазмы крови составляет 60 %. $T_{1/2}$ составляет 20 мин.

Метаболизм

Быстро метаболизируется в печени при участии нитратредуктазы, с образованием ди- и мононитратов.

Выведение

Выводится почками в виде метаболитов.

Показания к применению

Купирование и кратковременная профилактика приступов стенокардии.

Способ применения и дозы

Дозу и схему лечения устанавливают индивидуально в зависимости от чувствительности больного к препаратам нитроглицерина, показаний, конкретной клинической ситуации. С осторожностью следует назначать препарат при выраженных нарушениях функции печени и/или почек.

Обычная доза препарата при стенокардии – 1 таблетка под язык, 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 успевший 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 терапевтического эффекта в течение первых 5 мин необходимо назначить еще одну таблетку препарата. При отсутствии терапевтического эффекта после 2-3 кратного приема следует учитывать вероятность развития инфаркта миокарда. Длительность действия нитроглицерина – около 45 минут.

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.

Побочное действие

Со стороны ЦНС: нечеткость зрения, головная боль (особенно в начале курса лечения, при длительной терапии уменьшается), головокружение и чувство слабости, двигательное беспокойство, обморок, сонливость, церебральная ишемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, покраснение кожи лица, тахикардия, брадикардия, сосудистый коллапс. Иногда при внезапном снижении артериального давления может наблюдаться усиление симптомов стенокардии (парадоксальные «нитратные реакции»).

Со стороны пищеварительного тракта: ощущение легкого жжения в ротовой полости, редко – тошнота, рвота, изжога.

Со стороны системы кроветворения: редко - метгемоглобинемия, цианоз.

Прочие: возможны аллергические реакции; редко - эксфолиативный дерматит, повышение внутриглазного давления; при длительном применении препарата в высоких дозах - синдром отмены препарата; развитие толерантности.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу, другим нитратам, или к любому из вспомогательных веществ; артериальная гипотензия (систолическое давление менее 90 мм рт. ст.); сосудистый коллапс; закрытоугольная форма глаукомы; шок; острый инфаркт миокарда с низким давлением заполнения левого желудочка; токсический отек легких; геморрагический инсульт; состояния, сопровождающиеся снижением давления заполнения левого желудочка (изолированный митральный стеноз, констриктивный перикардит); гипертрофическая кардиомиопатия; одновременный прием с ингибиторами фосфодиэстеразы (например, силденафил, варденафил, тадалафил); анемия, повышение внутричерепного давления (в том

числе после перенесенной черепно-мозговой травмы), брадикардия, тампонада сердца, аортальный стеноз».

Беременность, период кормления грудью, детский возраст.

Передозировка

Симптомы: выраженная артериальная гипотензия, тахикардия, коллапс, цианоз, метгемоглобинемия.

Лечение: при коллапсе следует принять больному горизонтальное положение с приподнятыми вверх ногами. При метгемоглобинемии показано внутривенное введение метиленового синего (в среднем 0,1-0,15 мл 1 % раствора на 1 кг массы тела). В тяжелых случаях назначают плазмозаменители, симпатомиметики, кислород.

Меры предосторожности и особенности применения

На фоне приема препарата возможно значительное снижение артериального давления, появление головокружения при резком переходе в вертикальное положение из положения "лежа" или "сидя", при употреблении алкоголя, выполнении физических упражнений и жаркой погоде.

К нитроглицерину при частом применении может развиваться привыкание, требующее повышения дозировки.

Выраженность головной боли на фоне приема препарата может быть уменьшена снижением его дозы и/или одновременным приемом валидола.

В период лечения не допускается употребление алкоголя.

С осторожностью применять при цереброваскулярной патологии, тяжелых заболеваниях печени или почек, гипотиреозе, гипоксемии, недавно перенесенном инфаркте миокарда, первичной легочной гипертензии, мигрени, склонности к развитию ортостатической гипотензии, недостаточности питания, дефиците метгемоглобинредуктазы, глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

Для предупреждения гипотензии рекомендуется принимать нитроглицерин в положении лежа или сидя. Прием нитроглицерина в положении стоя может не только способствовать обморочному состоянию, но и ослаблению антиангинального действия, развитию синдрома «обкрадывания» (усиление ишемии миокарда), особенно у пациентов с распространенным атеросклерозом коронарных сосудов.

Если симптомы стенокардии не прошли после приема трех доз препарата, пациенту следует немедленно обратиться к врачу.

С целью предотвращения развития толерантности рекомендуется ежедневно выдерживать интервал между приемом нитратов (8-12 часов). В случае развития толерантности следует временно прекратить прием препарата (на несколько дней) и заменить его антиангинальными средствами других фармакотерапевтических групп.

Следует строго соблюдать условия хранения препарата. При нарушении целостности упаковки или условий хранения эффективность препарата может снижаться.

Из-за содержания лактозы, препарат противопоказан пациентам с редкой врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Особенности применения у пациентов пожилого возраста.

При использовании нитратов у пожилых людей увеличивается риск развития таких побочных реакций как гипотония и обмороки. Данной категории пациентов препарат рекомендуется принимать с осторожностью, по возможности, в положении сидя или лежа».

Применение у детей.

Препарат противопоказан детям в связи с отсутствием данных об эффективности и безопасности.

Применение в период беременности и грудного вскармливания

Безопасность применения в период беременности и лактации не доказана. Во время беременности и грудного вскармливания прием препарата возможен только в случае, если ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода или ребенка.

Влияние лекарственного средства на способность управлять автомобилем и механизмами

При управлении транспортным средством или при управлении механизмами, которые требуют повышенного внимания, следует помнить, что прием препарата может привести к снижению скорости реакции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Гипотензивное действие препарата может быть чрезмерным в случае неконтролируемого одновременного приема гипотензивных средств, трициклических антидепрессантов, алкоголя, диуретиков, бетаадреноблокаторов, ингибиторов моноаминоксидазы (МАО). С осторожностью следует принимать нитроглицерин с прокаинамидом, так как возможно усиление гипотензивного эффекта и развитие коллапса.

Совместное применение нитроглицерина с ингибиторами фосфодиэстеразы типа 5, которые используются для лечения нарушений эрекции или легочной гипертензии, строго противопоказано из-за риска развития тяжелой гипотензии. Применение нитроглицерина возможно не ранее чем через 24 часа после приема препаратов, содержащих силденафил и варденафил, не ранее чем через 48 часов после приема препаратов, содержащих тадалафил.

N-ацетилцистеин может усиливать сосудорасширяющее действие нитроглицерина.

Вероятность развития толерантности возрастает при использовании в сочетании с препаратами нитратов пролонгированного действия.

Препараты, которые вызывают сухость во рту (например, антихолинергические, антиму斯卡риновые), могут уменьшить эффективность нитратов, применяемых сублингвально в результате снижения всасывания.

Антикоагулянтный эффект гепарина может снижаться при одновременном применении с нитратами. Ранний и частый мониторинг эффективности антикоагулянтной терапии рекомендуется при сочетанной терапии нитратами и гепарином.

Усиление гипотензивного эффекта апоморфина может происходить в результате сопутствующего применения нитроглицерина.

Алкалоиды спорыньи, препятствуя коронарной вазодилатации, вызываемой нитратами, могут усиливать стенокардию. Нитроглицерин может уменьшить эффект первого прохождения и метаболизм дигидроэрготамина.

Условия хранения

В защищенном от влаги и света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

10 или 20 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной прозрачной и фольги алюминиевой. Две, три или четыре контурные ячейковые упаковки № 10, или 2 контурные ячейковые упаковки № 20 вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке из картона.

Условия отпуска

Без рецепта

Информация о производителе

СООО «Лекфарм», Республика Беларусь, 223141, г. Логойск, ул. Минская, д. 2а/4
Тел./факс: (01774)-53801, www.lekpharm.by