

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

НІТРОСОРБІД
(NITROSORBIDE)

Склад:

діюча речовина: ізосорбїду динїтрат;

1 таблетка містить ізосорбїду динїтрату 10 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний; кальцію стеарат; цукор; лактоза, моногідрат.

Лікарська форма.

Таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Кардіологічні препарати. Вазодилататори, що застосовуються у кардіології. Ізосорбїду динїтрат. Код АТС С01D А08.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Профілактика та лікування нападів стенокардії, у тому числі постінфарктної.
- Лікування хронічної застійної серцевої недостатності у комбінації з серцевими глікозидами та діуретиками.

Протипоказання.

- Гіперчутливість до ізосорбїду динїтрату, інших нітратів або інших компонентів препарату.
- Підвищений внутрішньочерепний тиск (у тому числі при черепномозковій травмі, геморагічному інсульті), оскільки венодилатація може призвести до його подальшого підвищення.
- Виражена артеріальна гіпотензія (систоличний артеріальний тиск нижче 90 мм. рт. ст.), кровотечі, гіповолемія (ізосорбїду динїтрат, знижуючи венозне повернення, може спровокувати синкопе).
- Гостра недостатність кровообігу (шок, судинний колапс).
- Кардіогенний шок (якщо відповідними заходами не підтримується достатній рівень кінцевого діастолічного тиску).
- Стенокардія, викликана гіпертрофічною обструктивною кардіоміопатією.
- Тампонада серця, аортальний стеноз, мітральний стеноз, констриктивний перикардит.
- Гострий інфаркт міокарда з низьким тиском наповнення.
- Первинні легеневі захворювання (через ризик виникнення гіпоксемії, що може бути спричинена перерозподілом кровотоку у зони гіпервентиляції) токсичний набряк легень, легеневе серце.
- Тяжка анемія.
- Закритокутова глаукома.
- Тяжкі порушення функцій печінки та/або нирок, гіпертиреоз.
- Сумісне застосування з інгібіторами фосфодіестерази (наприклад силденафіл, тадалафіл, варденафіл).

Спосіб застосування та дози.

Дозування та тривалість терапії визначає лікар індивідуально.

Застосовувати дорослим внутрішньо по 10-20 мг 3-4 рази на добу за 30 хвилин до їди, не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини. При недостатній ефективності терапії можливе поступове підвищення дози до максимальної – 120 мг на добу.

У пацієнтів із застійною серцевою недостатністю для визначення індивідуального дозування істотне значення має моніторинг гемодинаміки.

Інтервал між прийомами препарату має становити не менше 4 годин.

Пацієнти літнього віку: доза може бути знижена, особливо при порушенні функції нирок та/або печінки.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: рефлекторна тахікардія, гіперемія обличчя, артеріальна гіпотензія; почастищення нападів стенокардії, брадикардія, порушення серцевого ритму та синкопальний стан, альвеолярна гіповентиляція з подальшою гіпоксемією і ризиком розвитку гіпоксії/інфаркту міокарда у пацієнтів з ішемічною хворобою серця.

З боку травної системи: нудота, блювання, поява відчуття легкого печіння язика, сухість у роті, печія, запор.

З боку центральної нервової системи: запаморочення, сонливість, головний біль (при постійному лікуванні звичайно зникає через 1-2 тижні після початку терапії), колапс, крововилив у пілофіз у пацієнтів з недиагностованою пухлиною гіпофіза.

Алергічні реакції: шкірний висип, свербіж, блідість шкірних покривів, синдром Стівенса-Джонсона, набряк Квінке.

З боку органів зору: нечіткість зору, закритокутова глаукома. Повідомлялось про випадки зорових галюцинацій, звуження поля зору.

Загальні порушення: пітливість, кволість, припливи, периферичний набряк, гематологічні побічні ефекти, включаючи метгемоглобінемію, випадок ізосорбїду динітрат-індукованої гемолітичної анемії у пацієнта з супутньою недостатністю глюкозо-6-фосфатдегідрогенази.

Були описані випадки розвитку толерантності до ізосорбїду днітрату, а також перехресної толерантності по відношенню до інших нітратів.

Тривале застосування високих доз та/або скорочення інтервалу між прийомами може призвести до зниження або навіть до втрати ефекту препарату.

Повідомлялося про випадки значного збільшення рівня реніну та альдостерону в плазмі крові, асоційованого зі зниженням швидкості гломерулярної фільтрації та кліренса осмотично вільної води, у хворих на цироз печінки, особливо з асцитом.

Передозування.

Симптоми:

- блідість,
- посилене потовиділення,
- слабе наповнення пульсу,
- гіпертермія,
- діарея,
- рефлекторна тахікардія,
- головний біль,
- напади кволості,
- запаморочення,
- прискорене серцебиття,
- нудота,
- блювання,
- артеріальна гіпотензія,
- стан заціпеніння.

Можливе утворення метгемоглобіну, що супроводжується тахіпноєю, відчуттям тривоги, втратою свідомості, зупинкою серця.

При надмірних дозах можливе підвищення внутрішньочерепного тиску з появою церебральних симптомів, у тому числі судом.

Лікування: промивання шлунка.

При артеріальній гіпотензії пацієнту слід надати горизонтальне положення тіла з піднятими нижніми кінцівками. Якщо артеріальний тиск не нормалізується, провести корекцію об'єму циркулюючої крові, у тяжких випадках показане введення допаміну та симпатоміметиків. Застосування епінефрину (адреналіну) протипоказано.

При метгемоглобінемії, залежно від тяжкості стану, можна застосовувати антидоти: вітамін С – 1 г перорально, метиленовий синій – до 50 мл 1% розчину внутрішньовенно, толуїдиновий синій – спочатку 2-4 мг/кг маси тіла внутрішньовенно, потім – залежно від тяжкості стану, а також киснева терапія, гемодіаліз, трансфузійна терапія.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Даних щодо безпеки застосування ізосорбїду динїтрату у період вагітності недостатньо. У I триметрі вагітності застосування препарату протипоказане. У II-III триместрах вагітності препарат слід застосовувати тільки з урахуванням співвідношення очікувана користь для матері/потенційний ризик для плода.

При необхідності застосування препарату грудне годування слід припинити.

Діти.

Досвід застосування дітям відсутній.

Особливості застосування.

Препарат не можна застосовувати для усунення нападів стенокардії.

При застосуванні препарату описані випадки розвитку толерантності та перехресної толерантності до інших нітратів. Для запобігання зниженню або втраті ефекту слід уникати тривалого прийому великих доз. У випадку «нітратної» толерантності рекомендується відмінити препарат на 24-48 годин або після 3-6 тижнів регулярного прийому робити перерву на 3-5 днів, замінюючи на цей час препарат іншими антиангінальними лікарськими засобами. Пацієнтів слід попередити, що антиангінальний ефект ізосорбїду динїтрату тісно пов'язаний з його режимом дозування, тому запропонованого графіка дозування слід ретельно дотримуватися.

Препарат слід з обережністю призначати пацієнтам зі схильністю до ортостатичних реакцій, з гіпотиреозом, гіпотермією, недостатнім харчуванням, а також пацієнтам літнього віку з огляду на вікові зміни функції печінки, нирок та серця, супутні захворювання та прийом інших ліків.

Під час лікування, особливо при поступовому підвищенні дози, необхідний контроль артеріального тиску та частоти серцевих скорочень.

Відмінити препарат слід поступовим зменшенням дози.

Для попередження артеріальної гіпотензії та «нітратного» головного болю лікування слід розпочинати з мінімальної дози. Можливе застосування аспірину та/або ацетамінофену для зменшення ізосорбїду динїтрат-індукованого головного болю без негативного впливу на антиангінальний ефект ізосорбїду динїтрату.

Лікування препаратом може викликати розвиток ортостатичних реакцій, що частіше виникають при одночасному вживанні алкоголю або інших вазодилататорів. Під час лікування препаратом слід утримуватися від вживання алкоголю.

У пацієнтів із дефіцитом глюкозо-6-фосфатдеїдрогенази можливий розвиток гострого гемолізу (фавізму) при застосуванні ізосорбїду динїтрату.

Прийом ізосорбїду динїтрату може вплинути на результати колориметричного визначення холестеролу. Пацієнтів, які знаходяться на підтримуючій терапії препаратом, слід поінформувати, що їм не можна приймати препарати, які містять інгібітори фосфодіестерази (наприклад силденафіл, тадалафіл, варденафіл), через ризик розвитку неконтрольованої гіпотензії.

У хворих із закритокутовою глаукомою можливе підвищення внутрішньоочного тиску.

Препарат містить лактозу, тому його застосування протипоказане пацієнтам з рідкісними спадковими станами, такими як непереносимість галактози, недостатність лактази або з синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Доки не буде з'ясована індивідуальна реакція на препарат, слід утримуватись від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами, враховуючи можливість зниження здатності до концентрації уваги та швидкості психомоторних реакцій, запаморочення, порушення зору.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інгібітори фосфодіестерази (силденафіл, тадалафіл, варденафіл) – під час застосування ізосорбїду динїтрату протипоказане лікування еректильної дисфункції цими препаратами, оскільки існує потенційна небезпека неконтрольованої гіпотензії, небезпечних для життя серцево-судинних ускладнень. У разі потреби інгібітори фосфодіестерази слід приймати не раніше ніж через 72 години після прийому нітратів.

Алкоголь – можливі тяжкі дисульфїрам-алкогольні реакції, у т.ч. тяжка гіпотензія, колапс.

Гіпотензивні препарати (наприклад бета-адреноблокатори, інгібітори АПФ, антагоністи кальцію, вазодилататори), фенотіазини, інші нітрати/нітрити, хінідин, новокаїнамід, циклічні антидепресанти, інгібітори МАО, наркотичні анальгетики –

потенціювання гіпотензивної дії ізосорбїду динітрату, можливий розвиток ортостатичного колапсу.

Дизопірамід – можливе зменшення ефективності ізосорбїду динітрату.

Дигїдроерготамін – концентрація дигїдроерготаміну в крові може підвищуватися, що призводить до підсилення його гіпертензивної дії.

Норадреналін, ацетилхолін, гістамін – послаблення їх ефектів при застосуванні з нітратами, оскільки ізосорбїду динітрат може бути їх фізіологічним антагоністом.

Симпатоміметичні засоби (у т.ч. адреналін, ефедрин, норадреналін, нафтизин, мезатон, ізадрин) – можливе зниження антиангінального ефекту нітратів.

Гепарин – можливе зниження його антикоагулянтного ефекту.

Гідралазин – поліпшується серцевий викид при серцевій недостатності при комбінованому застосуванні з ізосорбїду динітратом.

Міотичні засоби – ізосорбїду динітрат зменшує їх ефективність.

Атропін та інші препарати, що мають М-холїноблокуючу дію (наприклад етацизин, етмозин) – можливе зменшення судинорозширювальної дії ізосорбїду динітрату та підвищення внутрішньоочного тиску.

Донатори сульфгїдрильних груп (каптоприл, ацетилцистеїн, унітіол) відновлюють знижену чутливість до препарату.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ізосорбїду динітрат – один з основних антиангінальних засобів з групи органічних нітратів, периферичний вазодилататор, що впливає переважно на венозні судини.

Як і всі органічні нітрати, ізосорбїду динітрат діє як донор оксиду азоту (NO). NO призводить до розслаблення гладких м'язів судин (переважно вен та системних артерій) шляхом стимуляції гуанїлатциклази і подальшого збільшення концентрації внутрішньоклітинного циклічного гуанїлатмонофосфату (цГМФ). Внаслідок цього стимулюється (цГМФ)-залежна протеїнкіназа і змінюється фосфорилювання різних протеїнів у клітинах гладких м'язів. Це призводить до дефосфорилювання легких ланцюжків міозину і зниження контрактильності.

Дія ізосорбїду динітрату пов'язана зі зменшенням потреби міокарда в кисні за рахунок зменшення переднавантаження (розширення периферичних вен та зменшення притоку крові до правого передсердя) та постнавантаження (зменшення загального периферичного опору судин), а також із безпосередньою коронаророзширювальною дією. Ізосорбїду динітрат сприяє перерозподілу коронарного кровообігу до ділянок зі зниженим кровопостачанням. Підвищує толерантність до фізичних навантажень у пацієнтів з ішемічною хворобою серця, стенокардією.

Застосування ізосорбїду динітрату поліпшує коронарну перфузію без розвитку «синдрому обкрадання». Виявляє антигіпертензивну дію. При тяжких формах серцевої недостатності внаслідок зниження тону периферичних венозних судин препарат зменшує навантаження на серце, тиск у судинах малого кола кровообігу, задишку.

Фармакокінетика.

Біодоступність після прийому всередину становить 22 % (ефект «першого проходження» через печінку). Початок дії відзначається через 15-40 хвилин, максимальний ефект розвивається через 1,5-2 години, загальна тривалість дії – 4-6 годин та більше. Метаболізується у печінці. Період напіввиведення – 4 години, може подовжуватися при курсовому застосуванні препарату. Виводиться із сечею майже повністю у вигляді метаболітів.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або білого з кремуватим відтінком кольору, з плоскою поверхнею, фаскою.

Термін придатності.

4 роки. Не застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С в оригінальній упаковці. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 50 таблеток у банці у пачці з картону або по 20 таблеток у банці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ НВФ «Мікрохім».

Місцезнаходження.

93009, Луганська обл., м. Рубіжне, вул. Леніна, 33,
Україна.