

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування|вживання| препарату
НІТРОГЛІЦЕРИН
(NITROGLYCERIN)

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: glyceryl trinitrate;

1 таблетка містить 0,5 мг нітрогліцерину;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, лактоза, аспартам Е 951, поліпластолон XL, магнію стеарат.

Лікарська форма.

Таблетки сублінгвальні.

Таблетки білого або білого з жовтуватим відтінком кольору, з плоскою поверхнею. Можлива шорстка поверхня таблетки.

Назва і місцезнаходження виробника.

ТОВ НВФ «Мікрохім».

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

Фармакотерапевтична група.

Вазодилататори, що застосовуються в кардіології. Органічні нітрати. Код АТС С01D А02.

Нітрогліцерин, прийнятий сублінгвально, абсорбується слизовою оболонкою і надходить, в основному, у системний кровотік. Всмоктується 60 - 75 % прийнятої дози. Через 2 - 4 хв після прийому досягається максимальна концентрація в плазмі - 2,3 мкг/л, через 8 хв - знижується на 50 % і вже через 20 хв нітрогліцерин майже не визначається в крові. Швидко метаболізується в печінці. Нітроєфіри багатоатомних спиртів швидко піддаються денітрації. Денітровані метаболіти, наприклад 1,2- та 3,4-динітрати, діють слабше і мають триваліший період напіввиведення порівняно з нітрогліцерином. Період напіврозпаду нітрогліцерину - майже 30 хв. Відщеплення нітрогруп відбувається послідовно як шляхом утворення неорганічних ніпритів, так і з утворенням нітрапів. З органічної частини молекули нітроєфірів утворюються спирти, альдегіди та органічні кислоти. Через 4 години після введення в організм нітроєфірів вихідний продукт майже не визначається. Найактивніше метаболізується в печінці, нирках та крові. Нітроєфіри розщеплюються двома шляхами: за допомогою глутатіонзалежної редуктази, яка локалізована, в основному, в розчинній фракції гепатоцитів, та за допомогою ферменту, який не потребує відновленого глутатіону. Препарат метаболізується, в першу чергу, в артеріо-венозному судинному руслі, дифундує в клітини гладких м'язів, де перетворюється на оксид азоту. Незначна частина препарату, переважно під впливом глутатіон-S редуктази, біотрансформується в печінці до ди-, мононітратів і гліцерину. При прийманні внутрішньо більша частина препарату метаболізується в печінці (ефект "першого проходження"). Значна частина динітрату і мононітрату утворює кон'югати з глюкуроною кислотою. Екскреція метаболітів нітрогліцерину відбувається, головним чином, нирками, частина метаболітів екскретується через легені з видихуванням повітрям. Загальний кліренс нітрогліцерину становить 25 - 30 л.

Період напіввиведення - 4 - 5 хв. Період напіввиведення метаболітів - 4 години. При сублінгвальному застосуванні ефект розвивається через 1 - 5 хв, триває від 8 - 15 до 45 хв.

Нітрогліцерин діє безпосередньо на гладкі м'язи переважно венозних та артеріальних судин через нітратний рецептор, що знаходиться у гладком'язовій оболонці стінки судин. Нітрогліцерин у гладких м'язах ферментативно перетворюється, утворюючи оксид азоту (NO), який стимулює активність гуанілатциклази. Вона відповідає за утворення циклічного гуанозин-3'5'-монофосфату (цГМФ), який є медіатором релаксації. Впливає на процеси центральної регуляції судинного тонуусу та

діяльність серця. Сприяє вивільненню катехоламінів у мозку та серці, що призводить до центрального пригнічення симпатичного та вазомоторного тону, непрямой симпатоміметичної дії на міокард, зміни конформації тропонін-тропоміозинового комплексу. Характер та інтенсивність дії нітрогліцерину на серце та периферичні судини залежить від взаємодії центральних та периферичних процесів. Пригнічення вазоконстрикторних рефлексів на коронарні судини, яке є результатом центрального пригнічення больових імпульсів, сприяє купіруванню нападів болю при стенокардії. Антиангінальна дія нітрогліцерину обумовлена нормалізуючим впливом на обмін електролітів та енергетику міокарда, а саме: на ключові показники дихального ланцюга - співвідношення окиснених та відновлених форм нікотинамідних коферментів, активність НАД-залежних дегідрогеназ. Впливає на діяльність серця та системну гемодинаміку. Під впливом нітрогліцерину збільшується ретроградний кровотік внаслідок розширення та збільшення кількості функціонуючих колатералей. Непряма симпатоміметична дія, а також кумуляція циклічного АМФ у міокарді призводять до посилення його скоротливості. Крім цього, оксид азоту ефективно пригнічує як агрегацію, так і адгезію тромбоцитів. Зниження периферичного опору і зменшення венозного повернення — ефекти, пов'язані з розслабленням гладких м'язів судин, зменшенням перед- та післянавантаження на серце. Розширення вен призводить до зменшення кількості крові, яка надходить до серця, зниження переднавантаження, а розширення артерій — до зменшення загального периферичного опору та зниження постнавантаження, що в кінцевому результаті проявляється полегшенням роботи серця та покращанням коронарного кровообігу. Відбувається перерозподіл кровообігу в міокарді на користь вогнища ішемії, посилюється іонотропна функція міокарда. Знижується кінцево-діастолічний тиск у лівому шлуночку та розміри серця, що покращує кровопостачання найуразливішої до ішемії субендокардіальної ділянки міокарда. Послаблення периферичного венозного та артеріального опору та тиску наповнення серця кров'ю сприяє зменшенню витрат енергії лівим шлуночком та потреби міокарда в кисні. Тиск у легневих капілярах знижується, що обумовлює призначення нітрогліцерину при інфаркті міокарда з набряком легень, а також при серцевій недостатності. При ішемічній гіпокінезії окремих ділянок міокарда відновлюється його скоротливість. Менінгеальні судини розширюються, судини внутрішніх органів звужуються, знижується тиск у системі легеневої артерії внаслідок вазодилатації та системного ефекту нітрогліцерину. Нітрогліцерин розслабляє гладкі м'язи бронхів, жовчних шляхів, травного тракту та сечовивідних шляхів. При експериментальному дослідженні не було виявлено тератогенної чи токсичної дії на ембріон.

Показання для застосування.

Лікування стенокардії (для купірування нападів стенокардії та короточасної профілактики), у комплексному лікуванні інфаркту міокарда та гострої лівошлуночкової недостатності.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до нітрогліцерину, до допоміжних компонентів препарату, нітратів. Артеріальна гіпотензія (сistolічний тиск - нижче 90 мм рт. ст.), судинний колапс, шок, гострий інфаркт міокарда з низьким тиском наповнення лівого шлуночка, закритокутова форма глаукоми, геморагічний інсульт, гіпертрофічна кардіоміопатія, токсичний набряк легень, зі станами, що супроводжуються зниженням тиску заповнення лівого шлуночка (ізольований мітральний стеноз, констриктивний перикардит), гіпертрофічна кардіоміопатія, одночасний прийом силденафілу (Віагри), первинна легенева гіпертензія, травма голови, аортальний стеноз, брадикардія. Період вагітності і годування груддю. Дитячий вік.

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Ризик розвитку метгемоглобінемії, що проявляється ціанозом і зміною кольору крові, зростає при тривалому безконтрольному прийомі нітрогліцерину, прийомі високих доз препарату хворими з печінковою недостатністю. При розвитку метгемоглобінемії нітрогліцерин необхідно терміново відмінити і застосувати антидот - метилтіонінію хлорид (метиленовий синій). За необхідності подальшого застосування нітратів - обов'язковий контроль за вмістом

метгемоглобіну.

Для зниження ризику розвитку побічних ефектів необхідно: бути обережними при одночасному застосуванні з лікарськими засобами, що мають виражені гіпотензивні та вазодилатуючі властивості; відмовитися від вживання алкоголю, обмежити перебування в приміщеннях з високою температурою навколишнього середовища (лазня, сауна, гарячий душ), уникати прийому декількох таблеток одночасно або послідовно за короткий проміжок часу після першого прийому.

Таблетку не можна розжовувати, оскільки через слизову оболонку порожнини рота в системний кровотік може надійти надмірна кількість діючої речовини.

Безконтрольне застосування препарату може призвести до розвитку толерантності, що виражається у зменшенні тривалості і вираженості ефекту і необхідності підвищення дози для досягнення терапевтичного ефекту. Після перерви в лікуванні чутливість до нітратів відновлюється. З метою запобігання розвитку толерантності рекомендується щодня витримувати інтервал між прийомом нітратів (8-12 годин).

Перед застосуванням препарату вперше проконсультуйтеся з лікарем!

Особливі застереження.

Обов'язково повідомте лікаря про Вашу попередню реакцію на прийом препаратів цієї групи. При прийомі нітрогліцерину можливі значне зниження артеріального тиску, запаморочення при миттєвому переході у вертикальне положення з положення лежачи або сидячи, при застосуванні алкоголю, виконанні фізичних вправ та в спекотну погоду. До нітрогліцерину, як і до інших органічних нітратів, при частому застосуванні може розвинутися звикання, яке потребує підвищення дозування.

Вираженість головного болю при прийомі препарату може бути зменшена шляхом зниження його дози та/або у разі одночасного прийому валідолу.

З обережністю слід застосовувати пацієнтам з вираженим церебральним атеросклерозом, порушенням мозкового кровообігу, при схильності до ортостатичної гіпотензії, при тяжкій анемії, у пацієнтів літнього віку, а також у хворих з гіповолемією і при виражених порушеннях функції печінки та нирок, гіпертиреозі, аортальному й мітральному стенозі; гострому інфаркті міокарда - ризик зниження артеріального тиску і розвитку тахікардії, які можуть посилити ішемію. Під час гострого періоду інфаркту міокарда і при розвитку гострої серцевої недостатності ретельно контролюють геодинаміку. При гіпертрофічній кардіоміопатії можливе частішання та/або обважнення нападів стенокардії.

У період лікування не можна вживати алкоголь, необхідно бути обережними при виконанні фізичних вправ у положенні лежачи на спині, оскільки можливе посилення ортостатичних гіпотензивних ефектів.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування у період вагітності та годування груддю можливе за призначенням лікаря тільки тоді, коли очікувана користь для матері переважає можливий ризик для плода або дитини.

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

При керуванні транспортними засобами та механізмами, що потребують підвищеної уваги, слід пам'ятати, що прийом нітрогліцерину може призвести до зниження швидкості реакції.

Діти.

Досвід клінічного застосування препарату у дітей відсутній, тому препарат протипоказаний дітям віком до 18 років.

Спосіб застосування та дози.

При стенокардії нітрогліцерин слід приймати сублінгвально відразу після виникнення нападу.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Звичайна доза препарату - 1 таблетка, для багатьох хворих зі стабільною стенокардією ефективною є і менша доза. Тому, якщо біль швидко минає, залишок таблетки, яка не встигла повністю розчинитися, рекомендується виплюнути. Ефект дії нітрогліцерину проявляється вже через 30 с - 2 хв; 75 % хворих відзначають покращання у перші 3 хв, а ще 15 % - протягом 4 -5 хв. При відсутності антиангінальної дії протягом перших 5 хв необхідно прийняти ще 1 таблетку. За відсутності терапевтичного ефекту після прийому 2-3 таблеток необхідно негайно викликати лікаря (вірогідність розвитку інфаркта міокарда). Нітрогліцерин діє протягом 45 хв. При частих нападах стенокардії призначають пролонговані препарати нітрогліцеринового ряду. Однак, якщо напад стенокардії розвивається при лікуванні пролонгованими нітратами, для зняття гострого нападу необхідно застосовувати нітрогліцерин. Толерантність до сублінгвальних форм нітрогліцерину розвивається рідко, проте при її виникненні у деяких хворих дозу препарату слід поступово збільшувати, доводячи її до 2 - 3 таблеток.

Передозування.

Симптоми: ціаноз губ, нігтів або долонь, запаморочення, непритомність, головний біль, задишка, виражена слабкість, часте серцебиття, нудота та блювання, артеріальна гіпотензія, підвищена температура тіла, судоми, підвищене потовиділення, підвищений внутрішньочерепний тиск (мозкові симптоми до розвитку судом та коми). При появі симптомів передозування необхідно негайно перевести хворого у горизонтальне положення, підняти йому ноги. У тяжких випадках призначають плазмозамінники, симпатоміметики, кисень. При метгемоглобінемії препаратом вибору є метиленовий синій.

Побічні ефекти.

Нечіткість зору, головний біль (особливо на початку застосування препарату, при тривалій терапії послаблюється), запаморочення та відчуття слабкості, ортостатична гіпотензія, метгемоглобінемія, артеріальна гіпотензія, гіперемія обличчя. Можливі алергічні реакції. Сухість у ротовій порожнині, нудота, блювання. Висипи на шкірі, свербіж.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Якщо Ви приймаєте будь-які інші лікарські засоби, обов'язково проконсультуйтеся з лікарем щодо можливості застосування препарату.

При одночасному застосуванні з інгібіторами АПФ, блокаторами кальцієвих каналів, діуретиками, трициклічними антидепресантами, інгібіторами MAO, силденафілом, опіоїдними анальгетиками, етанолом, етанолвмісними препаратами посилюється гіпотензивна дія нітрогліцерину; з бета-адреноблокаторами, блокаторами кальцієвих каналів, інгібіторами АПФ спостерігається посилення, а з симпатоміметичними засобами - пригнічення антиангінальної дії; з дигідроерготаміном можливе підвищення його концентрації у плазмі крові; з хінідином або новокаїнамідом - може спричинити ортостатичний колапс; при застосуванні з гепарином можливе послаблення антикоагулянтної дії. Атропін та інші препарати, що чинять холіноблокаторну дію, можуть знизити ефект нітрогліцерину внаслідок зниження секреції та біоасвоєння препарату. Фенобарбітал активує метаболізм нітратів у печінці.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 30 °С, подалі від вогню.

Упаковка.

По 40 таблеток у банці полімерній.

УТВЕРЖДЕНО

Сторінка 5 з 5. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України

Категорія відпуску.

Без рецепта.