

## **Склад**

*діюча речовина:* ізосорбїду динїтрат;

1 таблетка містить ізосорбїду динїтрату 5 мг;

*допоміжні речовини:* крохмаль кукурудзяний; лактоза, моногїдрат; сорбїт (D-сорбїт) (E 420); магнію стеарат.

## **Лїкарська форма**

Таблетки сублінгвальні.

*Основні фізико-хімічні властивості.*

Таблетки білого кольору, з плоскою поверхнею, з фаскою.

## **Фармакотерапевтична група**

Код АТХ.

Засоби, що вливають на серцево-судинну систему. Кардіологічні препарати. Вазодилататори, що застосовуються у кардіології. Органічні нїтрати. Ізосорбїду динїтрат. Код АТХ C01D A08.

## **Фармакодинаміка**

Периферичний вазодилататор із переважним впливом на венозні судини. Антиангінальний засіб. Механїзм дії пов'язаний із вивільненням активної речовини – оксиду азоту. У гладких м'язах судин оксид азоту активує гуанїлатциклазу та підвищує рівень циклічного 3',5'-гуанозинмонофосфату, що спричиняє розслаблення гладких м'язів. Під впливом ізосорбїду динїтрату артеріоли та прекапілярні сфінктери розслабляються меншою мірою, ніж великі артерії і вени. Дія ізосорбїду динїтрату пов'язана, головним чином, зі зменшенням потреби міокарда в кисні за рахунок зменшення переднавантаження (розширення периферичних вен і зменшення припливу крові до правого передсердя) та післянавантаження (зменшення загального периферичного судинного опору), а також із безпосередньою коронаророзширювальною дією. Ізосорбїду динїтрат сприяє перерозподілу коронарного кровотоку у ділянці зі зниженим кровопостачанням. Підвищує толерантність до фізичних навантажень у пацієнтів з ішемічною хворобою серця, стенокардією. При серцевій недостатності препарат сприяє розвантаженню

міокарда за рахунок зменшення переднавантаження, знижує тиск у малому колі кровообігу.

## **Фармакокінетика**

При сублінгвальному застосуванні ізосорбїду динїтрат швидко всмоктується і виявляє гемодинамічний та антиангінальний ефект через 2–5 хвилин (тобто купірування нападу стенокардії спостерігається через 2–5 хвилин після застосування, що зумовлено особливостями виробництва сублінгвальної форми препарату). Максимальна концентрація активної речовини в плазмі досягається через 5–6 хвилин. Максимальний ефект таблеток ізосорбїду динїтрату при сублінгвальному застосуванні настає на 10–15 хвилині. Тривалість терапевтичної дії препарату становить 60–120 хвилин. Препарат короткої дії. Ізосорбїду динїтрат метаболізується з утворенням активного метаболіту ізосорбїду-5-мононїтрату, період напіввиведення якого становить 5 годин, а також ізосорбїду-2-мононїтрату з періодом напіввиведення 2,5 години. Період напіввиведення ізосорбїду динїтрату при сублінгвальному застосуванні препарату становить 1 годину. Від 80 до 100 % застосованої разової дози виводиться із сечею протягом 24 годин, переважно у формі метаболітів. Особливе значення має ця форма у хворих із малою системною біодоступністю таблеток ізосорбїду динїтрату при прийомі внутрішньо.

## **Показання**

Купірування та профілактика нападів стенокардії.

Для запобігання нападів стенокардії препарат застосовують перед очікуваним фізичним або емоційним навантаженням.

## **Протипоказання**

- Гіперчутливість до компонентів препарату;
- виражена артеріальна гіпотензія (сistolічний артеріальний тиск – менше 90 мм рт. ст., діастолічний артеріальний тиск – менше 60 мм рт. ст.);
- гостра судинна недостатність (колапс, шок);
- гіпертрофічна обструктивна кардіоміопатія;
- констриктивний перикардит;
- тампонада серця;
- токсичний набряк легень;
- стани, що супроводжуються підвищенням внутрішньочерепного тиску (у тому числі геморагічний інсульт, черепно-мозкова травма);
- закритокутова глаукома з високим внутрішньоочним тиском;

- кровотечі, гіповолемія (іzosорбїду динїтрат, знижуючи венозне повернення, може спровокувати синкопе);
- первинні легеневі захворювання (через ризик виникнення гіпоксемії, що може бути спричинена перерозподїлом кровотоку у зонї гіпервентиляції), легеневе серце;
- тяжка анемія;
- гострий інфаркт міокарда з низьким тиском шлуночкового наповнення;
- тяжкі порушення функцій печінки та/або нирок, гіпертиреоз;
- одночасне застосування інгібіторів фосфодїестерази, наприклад силденафілу, тадалафілу, варденафілу.

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій**

Гіпотензивні препарати (наприклад  $\beta$ -адреноблокатори, інгібітори ангіотензинперетворюючого ферменту, антагоністи кальцію, вазодилататори), фенотіазини, інші нітрати/нітрити, хінїдин, новокаїнамід, циклічні антидепресанти, інгібітори моноаміноксидази, наркотичні анальгетики – потенціювання гіпотензивної дії іzosорбїду динїтрату, можливий розвиток ортостатичного колапсу.

*Дизопірамід* – можливе зменшення ефективності іzosорбїду динїтрату.

*Гепарин* – можливе зниження його антикоагулянтного ефекту.

Гідралазин – поліпшується серцевий викид при серцевій недостатності при комбінованому застосуванні з іzosорбїду динїтратом.

*Атронін та інші препарати*, що мають М-холїноблокуючу дію (наприклад етацизин, етмозин) – можливе зменшення судинорозширювальної дії іzosорбїду динїтрату та підвищення внутрішньочного тиску.

*Донатори сульфгідрильних груп* (каптоприл, ацетилцистеїн, унітіол) – відновлюють знижену чутливість до препарату.

*Інгібітори фосфодїестерази* (силденафіл) – застосування з нітратами забороняється через можливий розвиток неконтрольованої артеріальної гіпотензії.

*Симпатоміметичні засоби* (адреналін, ефедрин, норадреналін, гістамін, ацетилхолін, нафтизин, мезатон, ізадрин та ін. антигіпертензивні препарати) – можливе зниження антиангінального ефекту іzosорбїду динїтрату.

### **Особливості застосування**

З обережністю застосовувати для лікування пацієнтів із порушеннями мозкового кровообігу, з аортальним і/або мітральним стенозом; пацієнтів, схильних до ортостатичної гіпотензії; хворих із симптомами ішемії в різних судинних руслах, які виникають на фоні зниження артеріального тиску. У період лікування, особливо у разі поступового збільшення дози, необхідний контроль артеріального тиску та частоти серцевих скорочень. Частий прийом високих доз може спричинити виникнення «нітратної» толерантності до ізосорбїду динітрату або перехресної толерантності до інших нітратів. Для подолання толерантності до ізосорбїду динітрату (при можливості – відміна нітратів) рекомендується не збільшувати кратність прийому або дозу препарату, а утриматися від його прийому на 16–24 години, замінивши його на цей час іншими антиангінальними засобами, і потім продовжити лікування у вигляді монотерапії у звичайних дозах або у поєднанні з іншими препаратами (перерви при регулярному прийомі препарату рекомендується робити через 4–6 тижнів). Виникнення «нітратного» головного болю на початку лікування можна попередити поступовим підвищенням дози або призначенням валідолу та ненаркотичних анальгетиків (ацетилсаліцилова кислота, парацетамол, анальгін). Під час лікування препаратом слід утриматися від вживання алкоголю.

Препарат слід з обережністю призначати пацієнтам з гіпотиреозом, гіпотермією, при недостатньому харчуванні, супутніх захворюваннях та при прийомі інших ліків.

Відмінити препарат слід, поступово зменшуючи дозу. Для попередження артеріальної гіпотензії та «нітратного» головного болю лікування слід починати з мінімальної дози. Лікування препаратом може спричинити розвиток ортостатичних реакцій, що частіше виникають при одночасному вживанні алкоголю або інших вазодилататорів. У пацієнтів із дефіцитом глюкозо-6-фосфатдегідрогенази можливий розвиток гострого гемолізу (фавізму) при застосуванні ізосорбїду динітрату.

Прийом ізосорбїду динітрату може впливати на результати колориметричного визначення холестеролу.

### **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами**

У період лікування не рекомендується керувати транспортними засобами та займатися іншими потенційно небезпечними видами діяльності, оскільки при регулярному застосуванні ізосорбїду динітрату знижується здатність до концентрації уваги та швидкість психомоторних реакцій.

## **Застосування у період вагітності або годування груддю**

Даних стосовно безпеки застосування ізосорбїду динїтрату у період вагітності недостатньо. У I триместрі вагітності застосування препарату протипоказане. У II-III триместрах вагітності препарат слід застосовувати тільки з урахуванням співвідношення очікуваної користі для матері і потенційного ризику для плода.

При необхідності застосування препарату грудне годування слід припинити.

## **Спосіб застосування та дози**

ІЗО-МІК® 5 МГ застосовувати сублінгвально (під язик). Разова доза становить 5-10 мг.

Для купірування нападу стенокардії або перед очікуваним емоційним та фізичним навантаженням, яке звичайно спричиняє напад, 1 таблетку препарату покласти під язик і потримати у роті до її розчинення. При необхідності можна повторити прийом препарату через 10-15 хвилин.

## **Діти**

Досвід застосування дітям відсутній.

## **Передозування**

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

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

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

*Лікування:* при артеріальній гіпотензії пацієнту слід надати горизонтального положення з піднятими нижніми кінцівками. Якщо артеріальний тиск не нормалізується, проводять корекцію об'єму циркулюючої крові, у тяжких випадках показане введення допаміну та симпатоміметиків. Застосування епінефрину (адреналіну) протипоказано.

При метгемоглобінемії, залежно від тяжкості стану, можуть застосовуватися 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, трансфузійна терапія, гемодіаліз.

## **Побічні реакції**

*З боку серцево-судинної системи:* можлива рефлекторна тахікардія, короткочасна гіперемія обличчя, артеріальна гіпотензія; в окремих випадках – 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:* можливі нудота, блювання, поява відчуття легкого печіння язика, сухість у роті, печія, запор.

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

*Алергічні реакції:* можливе шкірне висипання, 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, слабкість, припливи, периферичний набряк, гематологічні побічні ефекти, включаючи метгемоглобінемію, випадок гемолітичної анемії, індукованої ізосорбїду динітратом, у пацієнта з супутньою недостатністю глюкозо-6-фосфатдегідрогенази.

Були описані випадки розвитку толерантності до ізосорбїду динітрату, а також перехресної толерантності 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 кліренсу осмотично вільної води у хворих на цироз печінки, особливо з асцитом.

## **Термін придатності**

4 роки.

### **Умови зберігання**

Зберігати при температурі не вище 30 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

### **Упаковка**

По 50 таблеток у банці у пачці з картону.

### **Категорія відпуску**

За рецептом.

### **Виробник**

ТОВ НВФ «МІКРОІМ».

### **Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності**

Україна, 93000, Луганська обл., м. Рубіжне, вул. Леніна, буд. 33.

### **Джерело інструкції**

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).