

## Состав и форма выпуска

Спрей дозированный в виде прозрачного бесцветного раствора с запахом спирта.

1 доза (42.25 мг) содержит: изосорбида динитрат 1,25 мг.

*Вспомогательные вещества:* макрогол 400, этанол 100%.

## Фармакологическое действие

Периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Антиангинальное средство. Механизм действия связан с высвобождением активного вещества оксида азота в гладкой мускулатуре сосудов. Оксид азота вызывает активацию гуанилатциклазы и повышает уровень цГМФ, что в конечном счете приводит к расслаблению гладких мышц. Под влиянием изосорбида динитрата артериолы и прекапиллярные сфинктеры расслабляются в меньшей степени, чем крупные артерии и вены. Это частично обусловлено рефлекторными реакциями, а также менее интенсивным образованием оксида азота из молекул активного вещества в стенках артериол.

Действие изосорбида динитрата связано главным образом с уменьшением потребности миокарда в кислороде за счет уменьшения преднагрузки (расширение периферических вен и уменьшение притока крови к правому предсердию) и постнагрузки (уменьшение ОПСС), а также с непосредственным коронарорасширяющим действием. Способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровоснабжением.

Повышает толерантность к физической нагрузке у пациентов с ИБС, стенокардией. При сердечной недостаточности способствует разгрузке миокарда за счет уменьшения преднагрузки. Снижает давление в малом круге кровообращения.

## Фармакокинетика

При приеме внутрь после всасывания из ЖКТ изосорбид динитрат подвергается эффекту \\\\"первого прохождения\\\\\" через печень.  $C_{\max}$  в плазме крови достигается через 1 ч. При буккальном применении изосорбид динитрат быстро всасывается,  $C_{\max}$  активного вещества в плазме достигается через 5-6 мин.

Метаболизируется с образованием активного метаболита изосорбида-5-мононитрата,  $T_{1/2}$  которого составляет 5 ч, а также изосорбида-2-мононитрата с  $T_{1/2}$  2.5 ч.

$T_{1/2}$  изосорбида динитрата, в зависимости от применяемой лекарственной формы, варьирует от 20 мин до 4 ч. Выводится почками и через кишечник.

## **Показания препарата Изокет**

Для приема внутрь, сублингвально, буккально: купирование и профилактика приступов стенокардии, восстановительное лечение после инфаркта миокарда. Хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии), некоторые формы легочной гипертензии, легочного сердца (в составе комбинированной терапии).

Для впрыскивания в полость рта: купирование и профилактика приступов стенокардии; как средство скорой помощи при остром инфаркте миокарда и острой левожелудочковой недостаточности на догоспитальном этапе. Профилактика и лечение спазма коронарных артерий при использовании сердечного катетера.

Для в/в введения: острый инфаркт миокарда, в т.ч. осложненный острой левожелудочковой недостаточностью; нестабильная стенокардия; отек легких.

Для кожного применения: профилактика приступов стенокардии.

## **Режим дозирования**

При приеме внутрь разовая доза составляет 10-120 мг, частота приема 1-5 раз/сут, в зависимости от показаний и применяемой лекарственной формы.

При сублингвальном или буккальном применении разовая доза - 5-10 мг, частота приема зависит от показаний и реакции пациента на лечение.

При впрыскивании в полость рта применяют 1-3 дозы с интервалом около 30 сек на фоне задержки дыхания. При остром инфаркте миокарда и острой сердечной недостаточности начальная доза составляет 1-3 впрыскивания. Если через 5 мин не наступает улучшения, впрыскивание можно повторять при условии постоянного контроля АД и ЧСС. Для профилактики коронарного спазма в случае катетеризации следует применить 1-2 дозы непосредственно перед процедурой.

При в/в введении режим дозирования зависит от клинической ситуации и применяемой лекарственной формы.

Для кожного применения начальная доза - 1 г на ночь, перед сном, а при необходимости и утром.

Продолжительность лечения определяется в каждом случае индивидуально.

## **Побочное действие**

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* головокружение, головная боль, тахикардия, преходящая гиперемия лица, ощущение жара, артериальная гипотензия; в отдельных случаях - усиление приступов стенокардии (парадоксальная реакция).

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, появление ощущения легкого жжения языка, сухость во рту.

*Со стороны нервной системы:* сонливость, нечеткость зрения; редко - ишемия мозга и коллапс.

*Аллергические реакции:* кожная сыпь.

## **Противопоказания к применению**

Выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт.ст., диастолическое АД менее 60 мм рт.ст.), коллапс, шок, острый инфаркт миокарда с выраженной артериальной гипотензией, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, констриктивный перикардит, тампонада сердца, токсический отек легких, состояния, сопровождающиеся повышением внутричерепного давления (в т.ч. геморрагический инсульт, черепно-мозговая травма), закрытоугольная глаукома, одновременный прием силденафила (ингибитора ФДЭ), повышенная чувствительность к нитратам.

## **Применение при беременности и кормлении грудью**

Применение изосорбида динитрата при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

## **Применение у пожилых пациентов**

С осторожностью применяют у пожилых пациентов.

## **Особые указания**

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями мозгового кровообращения, с аортальным и/или митральным стенозом; у пациентов, склонных к ортостатической гипотензии; у пожилых пациентов. В период лечения, особенно в случае постепенного увеличения дозы, необходим контроль АД и ЧСС.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

В период лечения не рекомендуется водить транспортные средства и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, т.к. при регулярном применении изосорбид динитрат снижает способность к концентрации внимания и скорость психомоторных

реакций.

## **Лекарственное взаимодействие**

При одновременном применении с адсорбентами, вяжущими и обволакивающими средствами уменьшается абсорбция изосорбида динитрата.

При одновременном применении антигипертензивных средств, периферических вазодилататоров, блокаторов кальциевых каналов, бета-адреноблокаторов, антипсихотических средств (нейролептиков), трициклических антидепрессантов, ингибиторов ФДЭ, этанола возможно усиление гипотензивного эффекта.

При одновременном применении с антихолинергическими средствами возможны нарушения памяти и внимания у пациентов пожилого возраста.

При одновременном применении с симпатомиметическими средствами возможно снижение антиангинального эффекта изосорбида динитрата.

При одновременном применении с дигидроэрготамином возможно повышение концентрации и усиление действия дигидроэрготаминина.

При одновременном применении с норэпинефрином уменьшается терапевтическое действие норэпинефрина.

При одновременном применении с силденафилом возникает риск развития тяжелой артериальной гипотензии и инфаркта миокарда.

## **Условия отпуска из аптек**

По рецепту.

## **Условия хранения**

При температуре не выше 25 °С.

*Хранить в недоступном для детей месте.*

## **Срок годности**

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.