МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата

для медицинского применения

ИЗОКЕТ®

МИНЗДРАВ РОССИИ
П N012496/02-160916
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер: П №012496/02

Торговое наименование препарата: Изокет®

Международное непатентованное наименование: изосорбида динитрат

Лекарственная форма: спрей дозированный

Состав

100 г спрея дозированного содержат:

Активное вещество: изосорбида динитрат 2,946 г.

Вспомогательные вещества: макрогол 400 17,668 г, этанол 100 % 79,386 г.

Один флакона содержит: 12,7 г (15,0 мл) раствора препарата и 3,3 г (3,8 мл) избытка раствора препарата;

16,0 г (18,8 мл) раствора препарата содержит 471 мг изосорбида динитрата.

1 доза (42,45 мг раствора препарата) содержит 1,25 мг изосорбида динитрата.

Описание

Прозрачный бесцветный раствор с запахом спирта.

Фармакотерапевтическая группа: вазодилатирующее средство – нитрат.

Код АТХ: C01DA08

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Изосорбида динитрат - периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Механизм действия связан с высвобождением оксида азота (эндотелиального релаксирующего фактора) в эндотелии сосудов, вызывающего активацию внутриклеточной гуанилатциклазы, следствием чего является повышение уровня циклического гуанозинмонофосфата (медиатор вазодилатации). Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет снижения преднагрузки (уменьшает конечно-диастолический объем левого желудочка и снижает систолическое напряжение его стенок). Обладает коронарорасширяющим действием.

Снижает приток крови к правому предсердию, способствует снижению давления в малом круге кровообращения и регрессии симптомов при отеке легких. Способствует перераспределению коронарного кровотока в области со сниженным кровообращением. Повышает толерантность к физической нагрузке у пациентов с ишемической болезнью сердца, стенокардией.

Расширяет сосуды головного мозга, твердой мозговой оболочки, что может сопровождаться головной болью.

Как и к другим нитратам, развивается перекрестная толерантность. После отмены (перерыва в лечении) чувствительность к нему быстро восстанавливается.

Фармакокинетика

После распыления на слизистую оболочку полости рта эффект проявляется через 1-3 минут и продолжается 90 – 120 минут.

Абсорбция - высокая. Биодоступность через слизистую ротовой полости – 60%. Связь с белками плазмы крови – 30%. Период полувыведения составляет 30-60 минут. Метаболизируется в печени до двух активных метаболитов изосорбида-2-нитрат и изосорбида-5-нитрат, имеют периоды полувыведения от 1,5 до 2 часов или от 4 до 6 часов соответственно.

Выводится препарат почками (почти полностью в виде метаболитов).

Показания к применению

- Купирование приступов стенокардии.
- Профилактика приступов стенокардии.
- Острый инфаркт миокарда.
- Острая левожелудочковая недостаточность.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к изосорбиду динитрату, другим нитросоединениям или другим компонентам препарата.
- Острая сосудистая недостаточность (сосудистый коллапс).
- Тяжелая артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление ниже 90 мм рт. ст., диастолическое артериальное давление – ниже 60 мм рт.ст.).
- Кардиогенный шок, если невозможна коррекция конечного диастолического давления левого желудочка с помощью внутриаортальной контрпульсации или препаратов с положительным инотропным действием.
- Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.
- Кровоизлияние в мозг.
- Гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия.
- Констриктивный перикардит.
- Тампонада сердца.
- Тяжелая гиповолемия.
- Одновременный прием ингибиторов фосфодиэстеразы-5 (например, силденафил, варденафил или тадалафил), поскольку они потенцируют антигипертензивное действие нитратов.
- Одновременный прием со стимулятором растворимой гуанилатциклазы риоцигуатом.

- Тяжелая анемия.
- Тяжелый аортальный и субаортальный стеноз, тяжелый митральный стеноз.
- Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения не установлены).

С осторожностью

- Низкое давление наполнения левого желудочка, в том числе при остром инфаркте миокарда, нарушении функции левого желудочка (например, при левожелудочковой недостаточности). Необходимо избегать снижения систолического артериального давления менее 90 мм рт. ст.
- При аортальном и/или митральном стенозе легкой и умеренной степени.
- Склонность к ортостатическим нарушениям сосудистой регуляции.
- Заболевания, которые сопровождаются повышением внутричерепного давления (в том числе, геморрагический инсульт, черепно-мозговая травма).
- Пожилой возраст.
- Закрытоугольная глаукома (риск повышения внутриглазного давления).
- Тяжелая почечная недостаточность.
- Тяжелая печеночная недостаточность (риск развития метгемоглобинемии).
- Гипотиреоз.
- Недостаточное и неполноценное питание.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Фертильность

Данных о влиянии препарата Изокет® на фертильность человека нет.

Беременность

Адекватных и хорошо контролируемых клинических исследований безопасности применения изосорбида динитрата при беременности не проведено. В исследованиях репродуктивной токсичности, проведенных на крысах и кроликах в дозах, достигающих уровня материнской токсичности, не было выявлено признаков вредного воздействия изосорбида динитрата на плод. Поскольку в исследованиях на животных не всегда удается воспроизвести влияние препарата на человека.

Применение препарата Изокет® при беременности возможно только строго по назначению врача и в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода и/или ребенка. При этом проводится тщательное наблюдение за состоянием беременной и развитием плода.

Период грудного вскармливания

Имеются сведения о проникновении нитратов в грудное молоко, но точное содержание изосорбида динитрата в грудном молоке не определялось. Также сообщалось о возможном риске развития метгемоглобинемии у младенцев, поэтому при необходимости применения препарата в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Изокет® спрей применяется для распыления на слизистую оболочку полости рта. При первом применении и в случае, если после последнего применения Изокет® спрея прошло более суток, первую дозу спустить в воздух, т.к. она может быть не полной. Для гарантии необходимого эффекта необходимо непрерывно и до конца нажимать на распылитель. Спрей вдыхать не следует. При применении Изокет® спрея следует избегать попадания в глаза и на кожу.

Способ применения:

- Поднесите Изокет® спрей вплотную ко рту, держа его вертикально.
- Сделайте глубокий вдох.
- Выдохните.
- Впрысните 1 дозу (нажатием на распылитель) в рот (при этом может появится легкое жжение языка).
- После приема 1 дозы, закройте рот и в течение 30 секунд дышите через нос.

Пользуйтесь приведенной выше информацией в том случае, если Ваш врач не дал Вам других рекомендаций. Пожалуйста, придерживайтесь описанных условий применения, так как в противном случае Изокет® спрей может не оказать желаемого действия.

Для купирования приступа стенокардии или перед физической или эмоциональной нагрузкой, которая может вызвать приступ, нужно впрыснуть спрей в рот 1-3 раза с интервалом в 30 секунд между вспрыскиваниями на фоне задержки дыхания. Разовую дозу из 3 впрыскиваний для купирования приступа можно увеличивать только по настоятельной рекомендации врача.

При остром инфаркте миокарда или острой левожелудочковой недостаточности (принимают только под контролем артериального давления (АД), частоты сердечных сокращений и наблюдением врача) в начале 1-3 дозы с интервалами 30 с, при отсутствии эффекта в течение 10 мин еще 1 дополнительную дозу (только под контролем врача).

Применение у пожилых пациентов

Пожилым пациентам коррекция дозы не требуется.

Применение у детей

Эффективность и безопасность изосорбида динитрата у детей не установлены.

Побочное действие

Возможные побочные эффекты приведены ниже по системам организма и частоте возникновения (классификация Всемирной организации здравоохранения): очень часто (более 1/10), часто (более 1/100 и менее 1/10), нечасто (более 1/1 000 и менее 1/100), редко (более 1/10000 и менее 1/1000), очень редко (менее 1/10000), частота неизвестна (частота не может быть оценена по имеющимся данным).

Со стороны центральной нервной системы

Очень часто: головные боли ("нитратные" головные боли) в начале лечения, которые, как правило, исчезают при дальнейшем применении препарата.

Часто: сонливость, легкое головокружение.

Частота неизвестна: нечеткость зрения, заторможенность (особенно в начале лечения), ишемия мозга.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Часто: тахикардия, ортостатическая гипотензия.

Нечасто: «парадоксальное» усиление приступов стенокардии, коллапс (иногда сопровождающийся брадиаритмией и обмороком).

Частота неизвестна: выраженное снижение АД.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто: тошнота, рвота.

Очень редко: изжога.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: кожные аллергические реакции (в том числе сыпь), «приливы» крови к коже лица.

Очень редко: ангионевротический отек, синдром Стивенса-Джонсона.

Частота неизвестна: эксфолиативный дерматит.

Общие нарушения и нарушения в месте введения

Часто: астения, жжение на языке.

Частота неизвестна: сухость слизистой оболочки полости рта.

Длительное применение препарата может вызывать преходящую гипоксемию вследствие относительного перераспределения кровотока в гиповентилируемые альвеолярные участки (у пациентов с ишемической болезнью сердца – может приводить к гипоксии миокарда).

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД (менее 90 мм рт.ст.), бледность, повышенное потоотделение, «нитевидный» пульс, тахикардия, постуральное головокружение, пульсирующая головная боль, астения, тошнота, рвота, диарея; повышение внутричерепного давления (при применении высоких доз), метгемоглобинемия.

Лечение:

В легких случаях: перевод пациента в положение «лежа» с приподнятыми ногами или опущенным головным концом кровати;

В более тяжелых случаях: при выраженном снижении АД – восполнение объема циркулирующей крови (ОЦК), введение норэпинефрина (норадреналин) или др. вазоконстрикторов (применение эпинефрина (адреналина) не рекомендуется); при метгемоглобинемии – аскорбиновая кислота 1 г внутрь или 0,1 – 0,15 мл/кг 1% раствора в виде натриевой соли (не более 50 мл), оксигенотерапия, искусственная вентиляция легких, гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Применение изосорбида динитрата с гипотензивными средствами (например, бета-адреноблокаторами, диуретиками, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента), нейролептиками, трициклическими антидепрессантами, этанолом и этанолсодержащими средствами может привести к выраженному снижению артериального давления.

При одновременном применении с прокаинамидом, хинидином также возможно усиление антигипертензивного эффекта.

Одновременное применение препарата Изокет® со стимулятором растворимой гуанилатциклзы риоцигуатом может вызвать развитие артериальной гипотензии

При одновременном применении с амиодароном, пропранололом, блокаторами «медленных» кальциевых каналов (верапамилом, нифедипином и др.) возможно усиление антиангинального эффекта.

Под влиянием симпатомиметиков, альфа-адреноблокаторов (дигидроэрготамин и др.) возможно снижение выраженности антиангинального эффекта (чрезмерное снижение АД, и, как следствие – коронарной перфузии).

При одновременном применении с дигидроэрготамином возможно увеличение концентрации и усиление действия дигидроэрготамина.

При комбинированном применении с м-холиноблокаторами (атропин и др.) возрастает вероятность повышения внутриглазного давления.

Одновременное применение препарата Изокет® и ингибиторов фосфодиэстеразы-5 (в т.ч. силденафилом, тадалафилом, варденафилом) противопоказано в виду возможности выраженного снижения артериального давления.

Сапроптерин – кофактор синтазы оксида азота. Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении сапроптеринсодержащих лекарственных препаратов со всеми вазодилатирующими средствами действие которых связано с оксидом азота (NO), включая классических

донаторов NO (например, нитроглицерин, изосорбида динитрат, изосорбида-5 мононитрат) и других.

Следует учитывать, что приведенные данные также относятся к тем случаям, когда прием лекарства начат недавно.

Особые указания

При каждом нажатии на распылитель равное количество раствора распыляется в виде мельчайших капелек. Он легко проникает сквозь слизистую оболочку рта и в считанные секунды попадает в кровоток.

Изокет® спрей не содержит фреона, безвреден для окружающей среды. Еще одним преимуществом является прозрачность флакончика, позволяющая вовремя заметить необходимость замены.

В период терапии необходим контроль АД и ЧСС. Избегать резкой отмены препарата, дозу снижать постепенно. Частое применение и в высоких дозах могут вызывать развитие толерантности, в этом случае рекомендуется отмена на 24–48 часов, или после 3–6 недель регулярного приема делать перерыв на 3-5 дней, заменив на это время Изокет® спрей другими антиангинальными средствами.

Лечение с применением Изокет® не должно проводиться у пациентов, которые непосредственно перед его приемом принимали ингибиторы фосфодиэстеразы-5 (например, силденафил, тадалафил, варденафил).

Раствор содержит около 85 процентов этанола.

В период лечения Изокет® спреем следует исключить употребление алкоголя.

Пожалуйста, храните Изокет® спрей при комнатной температуре и проверяйте время от времени работу распылителя. Это особенно необходимо при длительном перерыве в его применении. На этикетке флакончика спрея, внизу, нанесена стрелка. Когда уровень жидкости во флакончике достигает верхнего края стрелки, необходимо приобрести следующий флакончик спрея.

Дальнейшее применение такого флакончика тоже возможно, до тех пор, пока при легком наклоне кончик засасывающей трубки еще погружен в жидкость.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

В период лечения необходимо воздержаться от управления транспортными средствами и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (риск развития сонливости). Данный эффект усиливается под воздействием алкоголя.

Форма выпуска

Спрей дозированный 1,25 мг/доза.

По 15 мл концентрата во флаконе из коричневого прозрачного стекла с насадкой для фиксации колпачка, дозаторным насосом с жестко закрепленным распылителем из белого пластика (головка спрея) и красным защитным колпачком.

Каждый флакон вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

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.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ЮСБ Фарма ГмбХ

Альфред-Нобель-Штрассе 10, 40789 Монхайм, Германия

Производитель

ЮСБ Мэньюфэкчуринг Айлэнд Лимитед

Шэннон Индастриал Истейт, Шэннон, Ко. Клэр, Ирландия

Выпускающий контроль качества

Эйсика Фармасьютикалз ГмбХ

Альфред Нобель Штрассе 10,

40789 Монхайм, Германия

или

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

141345, Московская область, Сергиево-Посадский муниципальный район, сельское поселение Березняковское, пос. Беликово, д. 11

Т./ф.: (495) 956-29-30

www.sotex.ru

Вопросы и претензии потребителей направлять по адресу

105082, Москва, Переведеновский пер., д.13, стр. 21.

Тел.: (495) 644-33-22, факс: (495) 644-33-29

Представитель компании Тюрин Н.Е.