МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПЕКТРОЛ®

PEKTROL®

Регистрационный номер:

Торговое название: Пектрол®

Международное непатентованное название (МНН): изосорбида мононитрат

Лекарственная форма: таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой

Состав

(на одну таблетку)

Ядро

	40 мг	60 мг
Действующее вещество:		
Изосорбида мононитрат	40,000 мг	60,000 мг
Вспомогательные вещества:		
Гипромеллоза	68,266 мг	102,333 мг
Воск карнаубский	34,133 мг	51,167 мг
Стеариновая кислота очищенная	34,133 мг	51,167 мг
Лактозы моногидрат	25,446 мг	38,167 мг
Кремния диоксид коллоидный	1,333 мг	2,000 мг
Магния стеарат	1,000 мг	1,500 мг
Оболочка пленочная		
Тальк	1,866 мг	2,800 мг
Гипромеллоза	1,440 мг	2,167 мг
Титана диоксид	1,400 мг	2,100 мг
Магния стеарат	2,666 мг	4,000 мг
Макрогол 4000	0,300 мг	0,450 мг
Краситель железа оксид желтый (Е172)	0,033 мг	0,050 мг

Описание

Таблетки 40 мг. Круглые, слегка двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого с желтоватым оттенком цвета, с гравировкой на одной стороне таблетки «IM 40», с возможными вкраплениями.

Вид таблетки на поперечном разрезе: желтовато-белая шероховатая масса с белыми вкраплениями с оболочкой белого с желтоватым оттенком цвета.

Таблетки 60 мг. Овальные, слегка двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого с желтоватым оттенком цвета, с риской на обеих сторонах, с гравировкой на одной стороне таблетки «60», с возможными вкраплениями.

Вид таблетки на поперечном разрезе: желтовато-белая шероховатая масса с белыми вкраплениями с оболочкой белого с желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: вазодилатирующее средство - нитрат

Код АТХ: C01DA14

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Периферический вазодилататор с преимущественным влиянием на венозные сосуды. Стимулирует образование оксида азота (эндотелиального релаксирующего фактора) в эндотелии сосудов, вызывающего активацию внутриклеточной гуанилатциклазы, следствием чего является увеличение циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) (медиатор вазодилатации). Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет снижения преднагрузки и постнагрузки (уменьшает конечный диастолический объём 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 больных ишемической болезнью сердца (ИБС), стенокардией. Расширяет сосуды головного мозга, твердой мозговой оболочки, что может сопровождаться головной болью. К изосорбиду, как и к другим нитратам, развивается перекрестная толерантность. После отмены терапии (перерыва в лечении) чувствительность к нему быстро восстанавливается. Антиангинальный эффект наступает через 30-40 минут после приема внутрь и продолжается до 8-10 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь изосорбид быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного

тракта (ЖКТ). Обладает абсолютной биодоступностью (около 100 %), так как нет эффекта «первичного прохождения» через печень. Высвобождение изосорбида из таблеток не зависит от приема пищи, перистальтики или pH в просвете желудочно-кишечного тракта. Изосорбид имеет высокий объем распределения; менее 4 % связывается с белками плазмы крови. Терапевтическая концентрация (100 нг/мл) достигается через 30 минут после приема внутрь. Время достижения максимальной концентрации ($ТС_{max}$) в плазме крови - 1-1,5 ч. Подвергается денитрированию с образованием изосорбида или соединяется с глюкуронидом. Образованный неактивный 2-глюкоронид выводится через почки. Почечный клиренс 115 мл/мин. Период полувыведения ($Т_{½}$) составляет от 4 до 10 ч. При печеночной и почечной недостаточности фармакокинетика изосорбида существенно не изменяется.

Показания к применению

- ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стабильной стенокардии;
- хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к изосорбиду мононитрату, другим нитросоединениям и компонентам препарата; тяжелая артериальная гипотензия и гиповолемия (систолическое артериальное давление ниже 100 мм рт.ст., диастолическое артериальное давление ниже 60 мм рт.ст., центральное венозное давление ниже 4-5 мм рт.ст.); острая сердечная недостаточность, шок, сосудистый коллапс, левожелудочковая недостаточность с низким конечным диастолическим давлением, острый инфаркт миокарда (с выраженной артериальной гипотензией), кардиогенный шок, тяжелый аортальный и/или тяжелый митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия (ГОКМП), тампонада сердца, констриктивный перикардит, токсический отек легких, тяжелая анемия, одновременное применение с ингибиторами фосфодиэстеразы-5 (ФЭД-5) (силденафил, варденафил, тадалафил), период грудного вскармливания, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью: пролапс митрального клапана, аортальный и/или митральный стеноз, склонность к ортостатическим нарушениям сосудистой регуляции, пожилой возраст, тиреотоксикоз, закрытоугольная глаукома, тяжелая почечная недостаточность, печеночная недостаточность (риск развития метгемоглобинемии), заболевания, сопровождающиеся повышением внутричерепного давления (в том числе геморрагический инсульт, черепно-мозговая травма), гипотиреоз, недостаточное и неполное питание.

эффе

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат Пектрол® не рекомендуется при беременности.

Применение препарата Пектрол® возможно только в случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и/или ребенка.

При необходимости применения препарата Пектрол® грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Таблетки следует принимать внутрь, целиком, запивая водой за 1 ч до или через 2 ч после еды.

Начальная доза – 1 таблетка (40 мг) один раз в сутки, утром.

При необходимости доза может быть увеличена до 60 мг один раз в сутки.

В случае ночных приступов стенокардии таблетку следует принимать вечером.

Доза препарата и кратность приема устанавливается индивидуально в зависимости от тяжести заболевания. В зависимости от выраженности клинического эффекта с 3 - 5 дня терапии разовую дозу можно увеличивать до 60 - 80 мг (в особых случаях до 80 мг/сут) при той же кратности приема.

Лечение хронической сердечной недостаточности обычно начинают в стационаре, где доза подбирается с учетом терапевтического эффекта и побочного действия.

Препарат Пектрол® необходимо принимать по 1 таблетке (40 мг или 60 мг) один раз в сутки или по 1 таблетке (40 мг) два раза в сутки (1 таблетка утром и вторая приблизительно через 7 ч). Интервал между приемом последней дозы препарата вечером и первой дозы препарата на следующее утро - не менее 12 ч.

Побочное действие

Классификация частоты развития побочных эффектов Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто >1/10

часто от > 1/100 до < 1/10

нечасто от > 1/1000 до < 1/100

редко от >1/10000 до < 1/1000

очень редко от < 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

часто: «нитратная» головная боль, головокружение, преходящая гиперемия кожи лица, ощущение жара, тахикардия, выраженное снижение артериального давления (АД);

редко: преходящая гипоксемия, усиление приступов стенокардии (парадоксальная

реакция), ортостатический коллапс;

Со стороны пищеварительной системы:

нечасто: тошнота, рвота, возможно появление ощущения легкого жжения языка, сухость слизистой оболочки полости рта;

Со стороны нервной системы:

часто: скованность, сонливость, нечеткость зрения, снижение способности к быстрым психическим и двигательным реакциям (особенно в начале лечения);

-редко: ишемия головного мозга;

Аллергические реакции:

нечасто: ангионевротический отек, кожная сыпь, крапивница;

очень редко: эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона;

Прочие:

нечасто: развитие толерантности (в т.ч. перекрестной к другим нитратам).

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД с ортостатической вазодилатацией, рефлекторная тахикардия и головная боль. Может появиться слабость, головокружение, гиперемия кожи, тошнота, рвота, диарея. В высоких дозах (более 20 мг/кг массы тела) следует ожидать появления метгемоглобинемии, цианоза, диспноэ и тахипноэ из-за образования нитрит-ионов вследствие метаболизма изосорбида мононитрата. При очень высоких дозах препарата может повышаться внутричерепное давление с церебральными симптомами. При хронической передозировке выявляется повышение метгемоглобина.

Лечение: промывание желудка; при метгемоглобинемии в зависимости от степени тяжести применяется в/в аскорбиновая кислота в форме натриевой соли (ранее применялся метилтиония хлорид (метиленовый синий) по 0.1-0.15 мл/кг 1 % раствора до 50 мл); оксигенотерапия, гемодиализ, обменное переливание крови.

Симптоматическая терапия при выраженном снижении АД (эпинефрин и родственные ему соединения малоэффективны).

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Повышает концентрацию дигидроэрготамина в плазме крови.

Барбитураты ускоряют биотрансформацию и снижают концентрацию изосорбида мононитрата в крови.

При одновременном применении с вазодилататорами, антипсихотическими средствами (нейролептики), трициклическими антидепрессантами, новокаинамидом, этанолом, хинидином, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, диуретиками, дигидроэрготамином, ингибиторами ФЭД-5 (в т.ч. силденафил, варденафил,

тадалафил) возможно усиление гипотензивного эффекта.

При одновременном применении амиодарона, пропранолола, блокаторов «медленных» кальциевых каналов (верапамил, нифедипин и др.) и изосорбида мононитрата возможно усиление антиангинального эффекта.

Под влиянием бета-адреномиметиков, альфа-адреноблокаторов (дигидроэрготамин и др.) возможно снижение выраженности антиангинального эффекта (тахикардия, чрезмерное снижение АД).

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

Адсорбенты, вяжущие и обволакивающие средства уменьшают всасывание изосорбида мононитрата в желудочно-кишечном тракте.

Возможно уменьшение терапевтического эффекта норэпинефрина (норадреналина).

Особые указания

Препарат Пектрол® не предназначен для купирования приступов стенокардии.

В период терапии необходим контроль АД и частоты сердечных сокращений (ЧСС). В случае необходимости применения препарата на фоне артериальной гипотензии следует одновременно применять ЛС, обладающие положительным инотропным эффектом.

Правильное применение препарата Пектрол® обеспечивает наличие периода с низкой концентрацией нитрата, что необходимо для предупреждения развития толерантности к нитратам. Как и для всех нитратов, важно строго соблюдать режим дозирования и 12-часовой интервал между применением препарата Пектрол®. В этом случае достигается период с низкой концентрацией (менее 100 нг/л), при этом сохраняется терапевтический эффект.

Необходимо избегать резкой отмены препарата Пектрол® и снижать дозу постепенно.

Частое применение и высокие дозы могут вызывать развитие толерантности; в этом случае рекомендуется отмена препарата на 24-48 ч или делать перерыв на 3-5 дней после 3-6 недель регулярного приема, заменяя на это время изосорбид мононитрат другими антиангинальными ЛС.

При переводе пациента с терапии изосорбидом динитратом на препарат Пектрол® общая суточная доза должна быть рассчитана заранее. Известно, что 10 мг изосорбида мононитрата соответствуют 20 мг изосорбида динитрата.

Возможно развитие транзиторной гипоксемии, за счет перераспределения кровотока в гиповентилируемые альвеолярные сегменты.

В период применения препарата Пектрол® необходимо исключить употребление алкоголя.

Влияние на способность управления автотранспортом и и другими техническими устройствами: при применении препарата Пектрол® необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе со сложными техническими устройствами в связи с возможностью развития побочных эффектов.

Форма выпуска

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой, 40 мг и 60 мг.

По 10 таблеток помещают в контурную ячейковую упаковку из комбинированного материала ПВХ/ПВДХ (PVC/PVDC) и фольги алюминиевой.

По 3 или 10 контурных ячейковых упаковки помещают в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец РУ:

ООО «КРКА-РУС», 143500, Россия, Московская обл., г. Истра, ул. Московская, д.50

Тел.: (495) 994-70-70

Факс: (495) 994-70-78

Производитель:

Вальфарма С.А., Сан Марино (таблетки 40 мг)

Вальфарма Интернационал С.п.А., Италия (таблетки 60 мг)

При расфасовке и/или упаковке на российском предприятии указывается:

ООО "КРКА-РУС", 143500, Россия, Московская обл., г. Истра, ул. Московская, д. 50

Тел.: (495) 994-70-70

Факс: (495) 994-70-78

По всем вопросам обращаться по адресу Представительства в РФ:

123022, Москва, ул.2-я Звенигородская, д.13, стр. 41

Тел.: (495) 739-66-00, факс: (495) 739-66-01

Представитель фирмы Т.В. Тамкович