



*Нитраты и
нитратоподобные
вещества*



Классификация нитратов по химической структуре

- Тринитраты: нитроглицерин; препараты депо нитроглицерина.
- Изосорбид динитраты: нитросорбид, кардикет, кардикет ретард, изокет
- Изосорбида-5 моонитраты



Классификация нитратов по времени действия:

- короткого действия (до 1 ч) - аэрозоли нитроглицерина и изосорбида динитрата, обеспечивают хорошую сохранность действующего вещества, обеспечивают быстрый эффект;
- умеренно пролонгированного действия (1-6 ч) - таблетированные препараты изосорбита динитрата (кардикет, кардикс, изо-мак ретард), начинают действовать через 10-20 минут, продолжительность эффекта составляет в среднем 3-4 часа;
- значительно пролонгированного действия (6-24 ч) - ретардные формы изосорбида динитрата и изосорбида-5-мононитрата.



Классификация нитратов по характеру лекарственной формы:

- всасывающиеся через слизистую рта - таблетки нитроглицерина под язык, аэрозоли нитроглицерина и изосорбида динитрата, которые оказывают быстрое и надежное действие;
- для приема внутрь - различные таблетки, капсулы изосорбида динитрата, нитроглицерина, изосорбида моонитрата;
- кожного применения - мази и пластыри нитроглицерина ;
- в/в введения - ампулы с раствором нитроглицерина и изосорбида динитрата (перлинганит 0,1% - 10 мл; изокет 10 мл) растворяют в 200 мл глюкозы, вводят в/в капельно со скоростью 10 капель/мин.



Механизм действия нитратов:

Нитраты взаимодействуют с SH-группами гладкомышечных клеток сосудистой стенки, что ведет к высвобождению оксида азота (NO) - мощного эндотелиального релаксирующего фактора. Оксид азота вызывает активацию гуанилатциклазы, что приводит к увеличению в гладкомышечных клетках цГМФ, а следовательно к снижению содержания в клетке ионов кальция, а следовательно, вазодилатации, улучшение микроциркуляции.



Основные механизмы антиангинального действия вазодилататоров:

- Расширяя вены, нитраты уменьшают преднагрузку на сердце, снижается конечное диастолическое давление и ударный объем сердца.
- Дилатация артериол ведет к уменьшению нагрузки на сердце и увеличение сердечного выброса при уменьшении потребности миокарда в кислороде.
- Коронаролитический эффект способствует перераспределению кровоснабжения в сторону ишемизированных отделов миокарда, особенно субэндокардиальных отделов.
- Фибринолитический эффект реализуется путем высвобождения активатора плазминогена из сосудистой стенки.
- Дезагрегантное и сосудорасширяющий эффект осуществляется за счет выделения нитратами простаглицлина I₂.
- Нитраты проявляют спазмолитическое действие на мышцы внутренних органов

Лекарственная форма	Путь введения	Разовая доза	Начало действия	Продолжительность действия
Нитроглицерин	Сублингвально	0,5 мг	40–50 сек	10–15 мин
	Аэрозоль	0,4 мг	40–50 сек	10–15 мин
	Буккально	1–3 мг	2 мин	3–5 ч
	Мазь	7,5–15 мг	15 мин	6 ч
	Пластырь	5 мг	30 мин	7–24 ч
	Внутривенно, раствор	25 мг/мин	3 мин	Введение
Изосорбид-5- мононитрат	Per os	10 мг	30 мин	12 ч
Изосорбид- динитрат	Per os	10 мг	20 мин	6–8 ч
	Сублингвально	2,5–10 мг	5 мин	1,5–5 ч
	Мазь	50 мг	30–40 мин	12 ч
	Аэрозоль	1,25–3,75 мг	2 мин	0,5–1 ч
	Внутривенно, капельно	1–15 мг/ч	3 мин	Введение

MedicalPlanet.ru

избранное по медицине



Показания к применению нитратов:

- купирование или профилактика приступов стабильной и нестабильной стенокардии
- инфаркт миокарда
- спазм коронарных артерий при коронароангиографии
- хроническая сердечная недостаточность



Противопоказания

Повышенная чувствительность к нитроглицерину и другим нитросоединениям; гиповолемия; выраженная артериальная гипотензия (систолическое давление < 90 мм рт.ст.); острый инфаркт миокарда с локализацией в правом желудочке; повышенное внутричерепное давление (в результате травмы головы или кровоизлияния в мозг); тампонада сердца; гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия; констриктивный перикардит, закрытоугольная глаукома, токсический отек легких; анемия; острая сосудистая недостаточность (шок, сосудистый коллапс). Силденафил. Одновременное применение ингибитора фосфодиэстеразы типа 5 силденафила, поскольку силденафил потенцирует гипотензивное действие нитратов (перерыв между приемами должен составлять не менее 48 ч).



Побочное действие нитратов

Нитраты имеют много побочных эффектов. Преимущественно они объясняются повышением венозного кровенаполнения головного мозга и его кавернозных синусов - головная боль, шум в ушах, тошнота, рвота, гипотония; универсальная вазодилатация - ортостатический коллапс, рефлексорная тахикардия (повышение ЧСС более, чем на 10-15 уд / мин от исходной), что возникает из-за активации симпатического отдела нервной системы и может увеличить потребность миокарда в кислороде; метгеминемия как следствие преобразований оксида азота и связи с гемоглобином; обострения глаукомы, контактный дерматит, синдром отмены.

Головная боль (нитратная) возникает в начале лечения, обусловлена расширением сосудов головного мозга. При возникновении резкой боли головы, тошноты, рвоты, головокружения следует предусмотреть индивидуальную непереносимость нитратов. При плохой переносимости нитратов можно назначить молсидимин.

Ко всем лекарственным форм нитратов, особенно пластырей, может развиваться обратная перекрестная толерантность, связанная с истощением сульфгидрильных групп гладких мышц кровеносных сосудов.

Механизм действия нитратоподобных веществ (молсидомин, сиднофарм):

Нитратоподобные средства - молсидимин (корватон, сиднофарм) - относятся к группе сиднониминов. Это неактивное вещество, которое после биотрансформации в печени метаболизируется в вещество, которое выделяет NO. Таким образом, сосудорасширяющий эффект молсидимина осуществляется без участия SH-групп, поэтому толерантности к нему не развивается. Молсидимин тормозит образование тромбксана A₂, адгезию и агрегацию тромбоцитов, стимулирует образование простациклина I₂, который действует как сосудорасширяющее и дезагрегантное.



Молсидомин

Показания

Профилактика приступов стенокардии.

Хроническая сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы.

Для профилактики приступов стенокардии препарат обычно применяют по 4 - 12 мг в сутки после еды.

Терапию начинают с 1 - 2 мг 4 - 6 раз в сутки в течение 1 - 2 суток, после чего увеличивают дозу до 2 - 4 мг 2 - 3 раза в сутки при необходимости.

Противопоказания.

Кардиогенный шок.

Артериальная гипотензия.

Беременность (особенно I триместр).

Период кормления грудью.

Глаукома, особенно закрытоугольная форма.

Острая стадия инфаркта миокарда, особенно со снижением артериального давления.





Спасибо за внимание!