

ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ
УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО ОБРАЗОВАНИЯ
«ПЕРМСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ
ИМЕНИ АКАДЕМИКА Е.А. ВАГНЕРА

Кафедра фармакологии

**Органические нитраты: препараты группы нитроглицерина и
изосорбида. Механизм антиангинального действия.
Сравнительная характеристика препаратов по путям введения,
длительности и выраженности эффектов. Показания к
применению. Побочные эффекты.**

Работу выполнила:

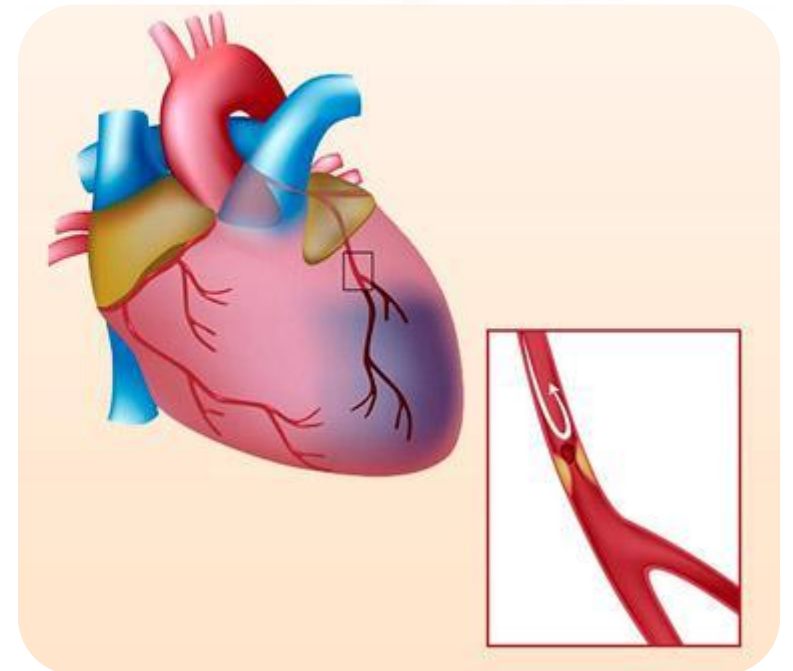
Левицкая Анастасия Сергеевна,
стоматологический факультет
группа СТ-19-04

Преподаватель:

К.м.н., старший преподаватель
Волков А. Г.

Пермь, 2021

Органические нитраты –
антиангинальные препараты,
относятся к веществам,
повышающим доставку
кислорода к миокарду и
снижающим потребность в
кислороде.



Группы препаратов

Группа нитроглицерина

- *Длительного и короткого действия:*

- Сустанг,
- Нитронг,
- Тринитролонг,
- Нитро-мазь,
- Нитро-диск

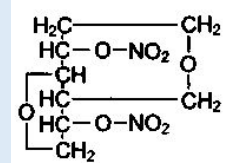


Группа изосорбида

Изосорбида динитрат:

- *короткого действия*

- нитросорбид
- изокет
- изомак



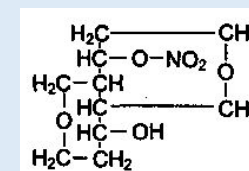
- *продленного действия*

- кардикет
- изомак - ретард

Изосорбида моонитрат:

- *короткого действия*

- моно-мак
- Моночинкве
- эфокс



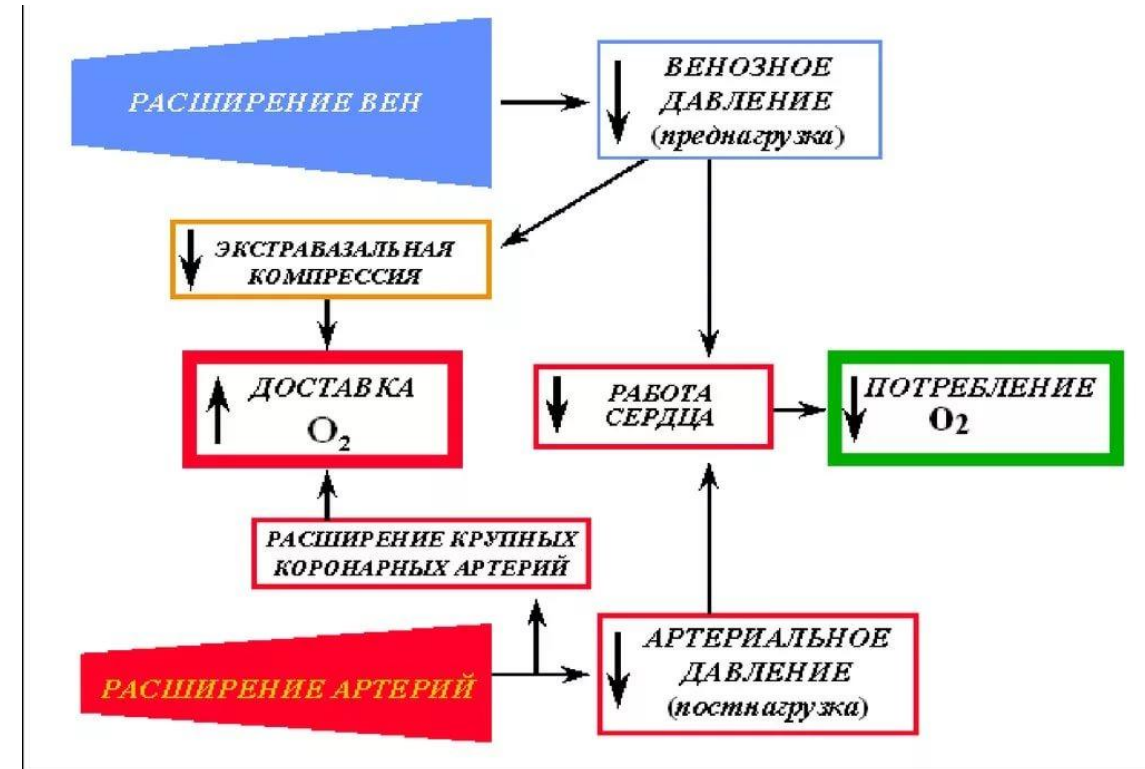
- *продленного действия*

- моно-мак-депо
- эфокс-лонг



Механизм антиангинального действия

1. **Расширяют** вены большого круга кровообращения – **снижается** преднагрузка на сердце - **облегчается** работа сердца - **снижается** потребность в кислороде;
2. **Снижается** заполнение камер сердца кровью - **понижается** давление крови на стенки предсердий и желудочков (**снижение** экстравазальной компрессии) - **расширяются** субэндокардиальные сосуды и **повышается** доставка кислорода в зоны ишемии
3. **Расширяют** артерии большого круга кровообращения – **снижается** постнагрузка на сердце - **облегчается** работа сердца - **снижается** потребность в кислороде
4. **Расширяют** крупные коронарные артерии, \uparrow ПЦ и \downarrow ТХА2 - **повышается** доставка кислорода к миокарду и **снижается** опасность тромбообразования



Механизм антиангинального действия



Нитраты используются в разнообразных лекарственных формах, которые определяют путь введения, скорость наступления и длительность эффекта. Если нужно предупредить приступ стенокардии, срок наступления действия не играет решающей роли. При купировании - фактор времени может иметь абсолютное значение. С учетом этих требований, выпускаемые лекарственные формы нитратов позволяют осуществить выбор препаратов по конкретным показаниям.



Нитраты растворимы в жирах и хорошо проникают через слизистые и кожу. Для введения нитратов через СОПР препараты выпускаются в форме таблеток, спиртовых растворов, растворов в масле в капсулах, аэрозолей, полимерных десневых пленок. Для кожного применения нитраты изготавливаются в форме мазей, аэрозолей, пластырей-дисков. Эффект при применении кожных форм развивается не быстро, но продолжается до 8 – 12 – 24 ч.

Для приема внутрь созданы специальные микрокапсулированные формы веществ, содержащие гранулы с разной скоростью резорбции, что позволяет назначать их с разными промежутками времени: от 1 до 3 – 4 раз в сутки.



Сравнительная характеристика препаратов по путям введения, длительности и выраженности эффектов

Препарат	Путь введения	Начало действия	Пик действия	Длительность действия	Применение при ИБС	
					купирование приступа	предупреждение приступов
Нитроглицерин (таблетки, капсулы, раствор)	Под язык	1–2 мин	2–5 мин	10–30 мин	+	–
Тринитролонг (пленки)	Буккально	2–3 мин	30–60 мин	3–5 ч	+	+
Нитромазь	Трансдермально	15–30 мин	1–2 ч	3–8 ч	–	+
Нитродерм (пластырь)	То же	60–120 мин	2–10 ч	до 24 ч	–	+
Сустанк форте (таблетки)	Внутри	20–30 мин	45–120 мин	4–6 ч	–	+
Изосорбида динитрат: таблетки	Под язык	3–10 мин	20–40 мин	1–2 ч	+ –	+
	Внутри	30–50 мин	1,5–2 ч	4–6 ч	–	+
	аэрозоль	Под язык	1–2 мин	2–5 мин	1 ч	+
Изосорбида моонитрат (таблетки)*	Внутри	30–45 мин	60 мин	8–10 ч	–	+
Молсидомин (таблетки)	Под язык	5–10 мин	30–60 мин	5–7 ч	+ –	+
	Внутри	20–30 мин	1–2 ч	4–6 ч	–	+

То есть для получения более быстрого эффекта нужно выбирать сублингвальный или трансбуккальный путь введения, так как ЛС поступает непосредственно в кровь, обходя воздействия в ЖКТ и печени.

Сравнительная характеристика препаратов по путям введения, длительности и выраженности эффектов

	Нитроглицерин (НТГ)	Изосорбида-динитрат (ИЗДН)	Изосорбида-мононитрат (ИЗМН)
Эффект первого прохождения через печень	Есть	Есть	Отсутствует
Биодоступность при пероральном приеме	10 – 15% (сублингвально 50%)	Низкая (внутри до 22%, сублингвально до 50%)	Высокая (100% при приеме внутри)
Период полувыведения ($T_{1/2}$)	2 – 4 мин	30 – 40 мин	4 – 6 ч
Продолжительность действия	Короткое	Среднее	Длительное

Показания к применению

1. Купирование приступа стенокардии:

- *Препараты нитроглицерина короткого д-я (эффект через 2-3 мин, длительность до 30 мин)*
 - Таблетки сублингвальные
 - Капсулы с маслян. р-ром
 - Спрей - на СОПР
 - Спиртовой раствор
- *Пленки на десну (длительность 3-5 часов)*
- *Раствор для в/венного капельного введения*

2. Предупреждение приступа стенокардии, систематическое лечение ИБС

- *Препараты нитроглицерина длительного действия (3-6 часов)*
 - Сустак, Нитронг (мите, форте)- микрокапсулированные таблетки внутрь, биодоступность 10%;
 - Тринитролонг (пленки на десну), мази, диски;
- *Препараты изосорбидов (4-24 часа)*
 - Динитраты –таблетки внутрь, биодоступность 20-30%;
 - Мононитраты - таблетки внутрь, биодоступность 100%

Редко для снятия колики, бронхоспазма

Побочные эффекты

- Чувство жара, гиперемия лица, головная боль, головокружение
- Снижение АД, коллапс
- Рефлекторная тахикардия
- Развитие привыкания
- Синдром отдачи при резкой отмене