

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ПЕНТОКСИФІЛІН-ЗДОРОВ'Я
(PENTOXIFYLLINE-ZDOROVYE)

Склад:

діюча речовина: pentoxifylline;

1 мл розчину містить пентоксифіліну 20 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що впливають на серцево-судинну систему. Периферичні вазодилататори. Похідні пурину. Пентоксифілін. Код АТС C04A D03.

Клінічні характеристики.

Показання. Атеросклеротична енцефалопатія; ішемічний церебральний інсульт; дисциркуляторна енцефалопатія; порушення периферичного кровообігу, зумовлені атеросклерозом, цукровим діабетом (у т.ч. з діабетичною ангіопатією), запаленням; трофічні розлади у тканинах, пов'язані з ураженням вен або порушенням мікроциркуляції (посттромбофлебітичний синдром, трофічні виразки, гангрена, відмороження); облітеруючий ендартерит; ангіонейропатія (хвороба Рейно); порушення кровообігу ока (гостра, підгостра, хронічна недостатність кровообігу у сітківці і судинній оболонці ока); порушення функції внутрішнього вуха судинного генезу, які супроводжуються зниженням слуху.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до пентоксифіліну, інших компонентів препарату або до інших препаратів групи метилксантинів, таких як теофілін, кофеїн, холіну теофілінат, амінофілін або теобромін;
- масивні кровотечі (ризик посилення кровотечі);
- крововиливи у сітківку ока, мозок; якщо під час лікування пентоксифіліном відбувається крововилив у сітківку ока, застосування лікарського засобу слід одразу припинити;
- геморагічний діатез;
- гострий період інфаркту міокарда;
- виразка шлунка та/або кишкові виразки.

Спосіб застосування та дози. Внутрішньовенні інфузії є найефективнішими формами парентерального введення препарату, які краще переносяться. Режим дозування визначається лікарем і залежить від ступеня тяжкості циркуляторних порушень, маси тіла і переносимості лікування. Інфузію можна проводити тільки у випадку, якщо розчин є прозорим.

Рекомендовано дорослим такі схеми лікування:

1. Внутрішньовенна інфузія 100-600 мг пентоксифіліну у 100-500 мл розчину Рінгера лактату, 0,9 % розчину натрію хлориду або 5 % розчину глюкози 1-2 рази на добу. Тривалість внутрішньовенної краплинної інфузії становить 60-360 хвилин, тобто введення 100 мг пентоксифіліну повинно тривати щонайменше 60 хвилин. Інфузія може бути доповнена пероральним прийомом Пентоксифіліну-Здоров'я (400 мг) із розрахунку, що максимальна добова доза (інфузійна і пероральна) становить 1200 мг.

2. При тяжкому стані пацієнта (особливо у разі постійного болю, гангрені або трофічних виразок) можливе проведення інфузії Пентоксифіліну-Здоров'я протягом 24 годин. При такій схемі введення дозу визначають із розрахунку 0,6 мг/кг/год. Розрахована таким чином добова доза для пацієнта з масою тіла 70 кг становить 1000 мг, для пацієнта з масою тіла 80 кг – 1150 мг. Незалежно від маси тіла пацієнта максимальна добова доза становить 1200 мг.

Об'єм інфузійного розчину розраховується індивідуально, з урахуванням супутніх захворювань, стану пацієнта, та становить у середньому 1-1,5 л на добу.

3. В окремих випадках препарат застосовують шляхом внутрішньовенної ін'єкції по 5 мл (100 мг). Ін'єкцію виконують повільно, протягом 5 хвилин, положення пацієнта – лежачи.

Пацієнти літнього віку. Для пацієнтів літнього віку немає потреби в коригуванні дозування.

Тривалість парентерального курсу лікування визначає лікар, який проводить лікування. Після поліпшення стану пацієнта рекомендовано продовжити лікування, застосовуючи таблетовану форму препарату Пентоксифілін-Здоров'я.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: стенокардія, тахікардія, аритмії, зниження артеріального тиску, підвищення артеріального тиску, відчуття жару (припливи), кровотечі, периферичний набряк.

З боку системи крові та лімфатичної системи: лейкопенія; тромбоцитопенія з тромбоцитопенічною пурпурою і апластична анемія (часткове чи повне припинення утворення всіх клітин крові, панцитопенія), що може мати летальний наслідок; у пацієнтів з підвищеною схильністю до кровоточивості – кровотечі (з судин шкіри, слизових оболонок, шлунка, кишечника).

З боку нервової системи: запаморочення, головний біль, збудження та порушення сну, тремор, парестезії, судоми, галюцинації, асептичний менінгіт.

З боку органів зору: порушення зору, кон'юнктивіт, крововиливи у сітківку, відшарування сітківки.

З боку травної системи: шлунково-кишкові розлади, відчуття тиску і переповнення у шлунку, нудота, блювання, метеоризм, діарея, атонія кишечника, загострення холециститу.

З боку шкіри: свербіж, почервоніння шкіри, кропив'янка, токсичний епідермальний некроліз, синдром Стівенса-Джонсона.

З боку імунної системи: анафілактичні/анафілактоїдні реакції з розвитком ангіоневротичного набряку, бронхоспазму, анафілактичного шоку.

З боку гепатобіліарної системи: внутрішньопечінковий холестаз, підвищення рівня трансаміназ, лужної фосфатази, лактатдегідрогенази.

Інші: першіння у горлі, ларингіт, грипоподібний синдром, закладеність носа, гіпоглікемія, підвищена пітливість, підвищення температури тіла.

Передозування. Початковими симптомами гострого передозування пентоксифіліном є нудота, запаморочення або зниження артеріального тиску. Крім того, можуть розвиватися такі симптоми як гарячка, збудження, відчуття жару (припливи), втрата свідомості, арефлексія, тоніко-клонічні судоми та блювота кольору кавової гущі (як ознака шлунково-кишкової кровотечі).

Лікування: специфічний антидот невідомий. З метою лікування гострого передозування і попередження виникнення ускладнень необхідне загальне і специфічне інтенсивне медичне спостереження і вжиття терапевтичних заходів.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Препарат не рекомендується призначати у період вагітності або годування груддю. При необхідності застосування годування груддю слід припинити.

Діти. Досвід застосування препарату дітям відсутній.

Особливості застосування. При перших ознаках розвитку анафілактичної/анафілактоїдної реакції лікування препаратом Пентоксифілін-Здоров'я слід припинити та звернутися за допомогою до лікаря.

У разі застосування препарату Пентоксифілін-Здоров'я пацієнтам із хронічною серцевою недостатністю попередньо слід досягти фази компенсації кровообігу.

У хворих, які страждають на діабет і отримують лікування інсуліном або пероральними антидіабетичними засобами, при застосуванні високих доз препарату можливе посилення впливу цих препаратів на рівень цукру у крові (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»). У цих випадках слід зменшити дозу інсуліну або пероральних протидіабетичних засобів і особливо ретельно доглядати за пацієнтом.

Хворим на системний червоний вовчак або з іншими захворюваннями сполучної тканини пентоксифілін можна призначати тільки після ґрунтовного аналізу можливих ризиків і користі.

Оскільки під час лікування пентоксифіліном існує ризик розвитку апластичної анемії, потрібен регулярний контроль загального аналізу крові.

У пацієнтів із нирковою недостатністю (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв) або тяжкою дисфункцією печінки виведення пентоксифіліну може бути уповільнене. Потрібен належний моніторинг.

Особливо уважне спостереження необхідне для:

- пацієнтів із тяжкими серцевими аритміями;
- пацієнтів з інфарктом міокарда;
- пацієнтів з артеріальною гіпотензією;
- пацієнтів з вираженим атеросклерозом церебральних та коронарних судин, особливо при супутній артеріальній гіпертензії та порушеннях серцевого ритму. У цих пацієнтів при застосуванні препарату можливі напади стенокардії, аритмії та артеріальна гіпертензія;
- пацієнтів із нирковою недостатністю (кліренс креатиніну нижче 30 мл/хв);
- пацієнтів із тяжкою печінковою недостатністю;
- пацієнтів із високою схильністю до кровотеч, зумовленою, наприклад, лікуванням антикоагулянтами або порушеннями згортання крові. Щодо кровотеч – див. розділ «Протипоказання»;
- пацієнтів із виразкою шлунка та дванадцятипалої кишки в анамнезі, пацієнтів, які нещодавно перенесли оперативне лікування (підвищений ризик виникнення кровотечі, у зв'язку з чим потрібен систематичний контроль рівня гемоглобіну та гематокриту);
- пацієнтів, для яких зниження артеріального тиску становить високий ризик (наприклад пацієнтів з тяжкою ішемічною хворобою серця або стенозом судин, які постачають кров до мозку);
- пацієнтів, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та антивітамінами К (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- пацієнтів, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та протидіабетичними засобами (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. При дотриманні рекомендованого режиму дозування препарат не впливає на здатність керувати транспортними засобами і механізмами, проте необхідно враховувати можливість побічних реакцій з боку нервової системи.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Препарат потенціює дію гіпоглікемічних препаратів (інсуліну і пероральних засобів). Тому пацієнти, які отримують медикаментозне лікування при цукровому діабеті, мають перебувати під ретельним наглядом.

Повідомлялося про випадки підвищення антикоагулянтної активності у пацієнтів, які одночасно отримували лікування пентоксифіліном та антивітамінами К. Коли призначається або змінюється дозування пентоксифіліну, рекомендується проводити контроль антикоагулянтної активності у цієї групи пацієнтів.

Може посилювати гіпотензивну дію антигіпертензивних засобів та інших препаратів, які викликають зниження артеріального тиску.

Одночасне застосування з теофіліном у деяких пацієнтів може призвести до збільшення рівня останнього у крові і внаслідок цього – до збільшення частоти та посилення проявів побічних реакцій теофіліну.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Пентоксифілін – антиагрегаційний, поліпшуючий мікроциркуляцію, ангіопротекторний, судинорозширювальний засіб. Похідне метилксантину.

Механізм дії обумовлений інгібуванням фосфодіестерази, що призводить до підвищення рівня цАМФ у клітинах гладкої мускулатури судин, у формених елементах крові та інших тканинах і органах. Знижує концентрацію внутрішньоклітинного кальцію. Блокує аденозинові рецептори.

Гальмує агрегацію тромбоцитів і еритроцитів, підвищує їх еластичність, пригнічує тромбоутворення, знижує підвищену концентрацію фібриногену у плазмі і підсилює фібриноліз, що зменшує в'язкість крові і покращує її реологічні властивості.

Виявляє слабку міотропну, судинорозширювальну дію, дещо зменшує загальний периферичний судинний опір і має позитивний інотропний ефект, покращуючи постачання тканин киснем (найбільшою мірою – у кінцівках і центральній нервовій системі, помірно – у нирках). Виявляє помірний антиангінальний ефект, обумовлений розширенням коронарних артерій. Дилатує судини легенів і покращує оксигенацію крові. Підвищує тонус дихальної мускулатури (міжреберних м'язів і діафрагми). При оклюзії уражених периферичних артерій (переміжній кульгавості) призводить до подовження дистанцій ходьби, усунення нічних судом литкових м'язів і болю у спокої.

Фармакокінетика. Швидко і рівномірно розподіляється по тканинах. Зв'язуючись з мембранами

еритроцитів, піддається у них біотрансформації. Потім інтенсивно біотрансформується у печінці при «першому проходженні», утворюючи два основні метаболіти.

Головний фармакологічно активний метаболіт 1-(5-гідроксигексил)-3,7-диметилксантин визначається у плазмі крові у концентрації, що перевищує у 2 рази концентрацію незміненої речовини і перебуває з ним у стані зворотної біохімічної рівноваги. Тому пентоксифілін і його метаболіт слід розглядати як активне ціле.

Екскретується переважно нирками (90-94 %), а також через кишечник, в основному – у вигляді метаболітів. Виділяється у грудне молоко. $T_{1/2}$ пентоксифіліну становить 1,6 години.

У пацієнтів з тяжкими порушеннями функції нирок екскреція метаболітів уповільнена; з порушеннями функції печінки – подовжений $T_{1/2}$ пентоксифіліну і підвищена його біодоступність.

Терапевтична концентрація зберігається протягом 8-12 годин після введення.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий безбарвний або зі злегка жовтуватим відтінком розчин.

Несумісність. Препарат не слід змішувати з іншими розчинами в одній ємкості за винятком розчинів, зазначених у розділі «Спосіб застосування та дози».

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Розчин для ін'єкцій 20 мг/мл по 5 мл в ампулах № 5 у коробці; № 5, № 5x2 у блістерах у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Місцезнаходження. Україна, 61013, м. Харків, вул. Шевченка, 22.