

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

КСАНТИНОЛУ НІКОТИНАТ
(XANTINOLI NICOTINAS)

Склад:

діюча речовина: 1 мл розчину містить ксантинолу нікотинату 150 мг;

допоміжна речовина: вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвна прозора рідина.

Фармакотерапевтична група. Периферичні вазодилататори. Похідні пурину.

Код АТХ C04A D02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ксантинолу нікотинат має властивості теофіліну та кислоти нікотинової: механізм дії реалізується завдяки блокаді активності фосфодіестерази, конкуренції з аденозином за рецептори, накопичення циклічного аденозинмонофосфату, стимуляції синтезу нікотинамідних коферментів і простагліцину у стінці судин. Препарат розширює периферичні кровоносні судини, покращує колатеральний та мозковий кровообіг, зменшує явища церебральної гіпоксії, знижує агрегацію тромбоцитів, покращує мікроциркуляцію у сітківці ока, посилює скорочення серця, покращує метаболічні процеси у мозковій тканині в післяопераційний період, знижує рівень холестерину, атерогенних ліпопротеїдів, сечової кислоти, фібриногену, посилює активність ліпопротеїнази, посилює фібриноліз.

Фармакокінетика.

В організмі препарат швидко перетворюється спочатку на теофілін та нікотинову кислоту і потім на продукти їх метаболізму. Екскретується, як правило, з сечею у вигляді метаболітів, при внутрішньом'язовому введенні ефект спостерігається через 5-10 хвилин.

Клінічні характеристики.

Показання. Облітеруючий атеросклероз судин нижніх кінцівок (переміжна кульгавість), хвороба Рейно, діабетична ангіопатія, ретинопатія, ангіоневропатія, гострий тромбоз, емболії кровоносних судин, мігрень, атеросклеротичні порушення мозкового кровообігу, післяопераційний період після усунення пухлин головного мозку, хвороба Мен'єра; трофічні виразки нижніх кінцівок, які погано загоюються; захворювання судин сітківки ока, дегенерація, відшарування сітківки ока.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до компонентів препарату, а також до теофіліну та нікотинової кислоти;
- гостра та хронічна серцева недостатність II-III ступеня;
- гострий інфаркт міокарда;
- гостра ниркова недостатність;
- гостра серцева недостатність або тяжка застійна серцева недостатність;
- гостра кровотеча;
- пептична виразка шлунка і дванадцятипалої кишки у стадії загострення;
- глаукома;

- мітральний стеноз.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Щоб уникнути різкого зниження артеріального тиску, препарат не можна призначати в комплексі з антигіпертензивними засобами (бета-адреноблокаторами, альфа-адреноблокаторами, симпатолітиками, гангліоблокаторами, алкалоїдами ріжків). При поєднанні з серцевими глікозидами підвищується ризик розвитку брадикардії та аритмії. Препарат також несумісний з інгібіторами MAO. Підсилює антикоагулянтний ефект гепарину, стрептокінази, фібринолізу.

З особливою обережністю застосовувати одночасно з нікотиновими пластирами, оскільки можливе виникнення припливів, відчуття жару і пульсації в голові.

Особливості застосування.

При необхідності одночасного застосування серцевих глікозидів з метою запобігання розвитку брадикардії та аритмії лікування слід проводити під контролем електрокардіограми.

Після застосування препарату можливе відчуття тепла, яке може бути пов'язане з парестезією і припливами. Ці реакції можуть тривати декілька хвилин або довше і інтенсивність їх може зменшуватися через кілька днів після початку прийому Ксантинолу нікотинату.

Обережно призначати хворим з артеріальною гіпертензією або лабільним артеріальним тиском при одночасному застосуванні гіпотензивних препаратів або серцевих глікозидів – через можливий ризик значного зниження артеріального тиску та/або розвитку аритмії. Внаслідок судинорозширювального ефекту препарату може виникнути постуральна гіпотензія.

Унаслідок можливого підвищення рівня трансаміназ і лужної фосфатази при тривалому застосуванні Ксантинолу нікотинату необхідна обережність при його призначенні хворим з печінковою або нирковою недостатністю.

З обережністю призначати при вираженому атеросклерозі коронарних і церебральних судин, тахісistolічних порушеннях серцевого ритму, а також хворим літнього віку.

З особливою обережністю призначають Ксантинолу нікотинат пацієнтам, які нещодавно перенесли захворювання печінки. Сюди належать і пацієнти з синдромом Жильбера, чутливі до дії на печінку нікотинової кислоти і схильні до більш вираженого підвищення вмісту некон'югованого білірубину.

Необхідно проводити базові дослідження для визначення наявності підвищеного рівня ліпідів у сироватці крові. Щоб визначити рівень ліпідів у сироватці крові, потрібно проводити регулярний моніторинг. У разі недостатнього клінічного відклику застосування препарату необхідно припинити.

Пацієнтам з виразковою хворобою в анамнезі слід призначати Ксантинолу нікотинат з крайньою обережністю і уникати, по можливості, призначення максимальних доз. Нікотинат сприяє вивільненню гістаміну з тучних клітин і посилює секрецію соляної кислоти в шлунку. Необхідно дотримуватися обережності хворим з бронхіальною астмою та зі схильністю до алергії.

При тривалому застосуванні високих доз препарату можлива зміна толерантності до глюкози, зміна біохімічних показників крові, що потребує

відміни препарату. У хворих на цукровий діабет необхідно частіше визначати рівень глюкози в крові. Хворим з імплантованим провідником ритму призначати препарат у менших дозах.

Препарат не слід застосовувати з алкоголем та кавою.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Препарат не призначати у період вагітності або годування груддю.

Здатність

впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Необхідно дотримуватись обережності при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами, враховуючи можливість розвитку запаморочення.

Спосіб застосування та дози. Призначати дорослим внутрішньовенно та внутрішньом'язово при гострих порушеннях мозкового та периферичного кровообігу.

Внутрішньовенно (дуже повільно!) вводити при гострих порушеннях периферичного та мозкового кровообігу. Дорослим призначати внутрішньовенно по 2 мл 15 % розчину 1-2 рази на добу, з переходом на внутрішньом'язові ін'єкції – по 2 мл 1-3 рази на добу. Одночасно призначати перорально по 2 таблетки Ксантинолу нікотинату 3 рази на добу.

У тяжких випадках вводити внутрішньовенно крапельно: 10 мл 15 % розчину препарату (1,5 г) розводити у 200 мл 500 мл 5 % розчину глюкози або 0,9 % розчину натрію хлориду. Введення здійснювати протягом 1-4 годин до 4 разів на добу. Курс лікування визначається індивідуально, орієнтовно до 21 дня, але можливе і більш тривале лікування. При порушеннях кровопостачання тканин внутрішньом'язово вводити по 2 мл 15 % розчину (0,3 г) 1-3 рази на добу, поступово збільшуючи дозу до 4-6 мл 15 % розчину 2-3 рази на добу. Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання (до 2-3 тижнів).

В офтальмологічній практиці дорослим застосовувати шляхом іонофорезу на очне яблуко – до 300 мг 1 раз на добу. Тривалість першої процедури 15 хвилин, тривалість наступних можна поступово збільшувати до 20-30 хвилин. Курс лікування – 15-20 днів.

Діти. Досвід застосування дітям відсутній.

Передозування.

Симптоми: тахікардія, відчуття жару, поколювання та почервоніння шкірних покривів голови та шиї, відчуття стискання в голові, слабкість, непритомність, нудота, блювання, діарея, гастралгія. При швидкому введенні можливе запаморочення, ядуха, біль за грудниною, виражена артеріальна гіпотензія.

Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості включаючи висип, кропив'янку, свербіж, озноб, гарячку, відчуття жару, гіперемію шкірних покривів, поколювання, у поодиноких випадках – ангіоневротичний набряк;

з боку центральної та периферичної нервової системи: підвищена втомлюваність, головний біль, запаморочення;

з боку травного тракту: рідко – нудота, блювання, діарея, анорексія, здуття живота, дискомфорт у животі, печія, рецидивна виразка, гастралгія, підвищення активності печінкових трансаміназ та лужної фосфатази;

з боку серцево-судинної системи: припливи, артеріальна гіпотензія, тахікардія, у поодиноких випадках можливе провокування нападів стенокардії, порушень серцевого ритму, розвитку синдрому обкрадання.

з боку кістково-м'язової системи: м'язові судоми, слабкість, артрити у зв'язку з виникненням подагри.

З боку шкіри та слизових оболонок: сухість шкіри, лущення епідермісу, пігментація, гіперкератоз.

З боку органів зору: нечіткість зору, набряки очей, екзофтальм, амбліопія, цистоподібні та плямисті набряки.

з боку дихальної системи: у поодиноких випадках – відчуття нестачі повітря, задишка;

з боку ендокринної системи: при тривалому застосуванні великих доз – зниження толерантності до глюкози;

Біохімічні: підвищення лужної фосфатази, ЛДГ і BSE (формові елементи крові), підвищення рівня сечової кислоти, що сприяє виникненню подагри, гіперглікемія;

інші: загальна слабкість, гіперурикемія;

загальні розлади та порушення у місці введення: гіперемія та свербіж у місці введення.

Поява цих симптомів при повторному прийомі препарату є протипоказанням для продовження лікування.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

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

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Препарат несумісний зі строфантином, інгібіторами MAO. Не змішувати в одному шприці з іншими лікарськими засобами.

Упаковка.

По 2 мл в ампулі, по 10 ампул у контурній чарунковій упаковці, по 1 контурній чарунковій упаковці в пачці;

по 2 мл в ампулі, по 10 ампул у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПАТ «Галичфарм».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 79024, м. Львів, вул. Опришківська, 6/8.

ИНСТРУКЦИЯ **по медицинскому применению лекарственного средства**

КСАНТИНОЛА НИКОТИНАТ **(XANTINOLI NICOTINAS)**

Состав:

действующее вещество: 1 мл раствора содержит ксантинола никотината 150 мг;

вспомогательное вещество: вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Периферические вазодилататоры. Производные пурина. Код АТХ C04A D02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Ксантинола никотинат имеет свойства теофиллина и кислоты никотиновой: механизм действия реализуется благодаря блокаде активности фосфодиэстеразы, конкуренции с аденозином за рецепторы, накоплением циклического аденозинмонофосфата, стимуляции синтеза никотинамидных коферментов и простациклина в стенках сосудов. Препарат расширяет периферические кровеносные сосуды, улучшает коллатеральное и мозговое кровообращение, уменьшает явления церебральной гипоксии, уменьшает агрегацию тромбоцитов, улучшает микроциркуляцию в сетчатке глаза, усиливает сокращения сердца, улучшает метаболические процессы в мозговой ткани в послеоперационном периоде, понижает уровень холестерина, атерогенных липопротеидов, мочевой кислоты, фибриногена, усиливает активность липопротеинлипазы, усиливает фибринолиз.

Фармакокинетика.

В организме препарат быстро преобразовывается вначале в теофиллин и никотиновую кислоту, потом в продукты их метаболизма. Экскретируется, как правило, с мочой в виде метаболитов, при внутримышечном введении эффект наблюдается через 5-10 минут.

Клинические характеристики.

Показания. Облитерирующий атеросклероз сосудов нижних конечностей (перемежающаяся хромота), болезнь Рейно, диабетическая ангиопатия, ретинопатия, ангионевропатия, острый тромбоз, острый тромбоз, эмболии кровеносных сосудов, мигрень, атеросклеротические нарушения мозгового кровообращения, послеоперационный период после удаления опухолей головного мозга, болезнь Меньера; плохо заживающие трофические язвы нижних конечностей; заболевание сосудов сетчатки глаза, дегенерация, отслоение сетчатки глаза.

Противопоказания.

- Повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также теофиллину и никотиновой кислоте;
- острая и хроническая сердечная недостаточность II-III степени;
- острый инфаркт миокарда;
- острая почечная недостаточность;

- острая сердечная недостаточность или тяжелая застойная сердечная недостаточность;
- острое кровотечение;
- пептическая язва желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения;
- глаукома;
- митральный стеноз.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. Во избежание резкого понижения артериального давления, препарат нельзя применять в комплексе с антигипертензивными средствами (бета-адреноблокаторами, альфа-адреноблокаторами, симпатолитиками, ганглиоблокаторами, алкалоидами спорыньи). При сочетании с сердечными гликозидами повышается риск развития брадикардии и аритмии. Препарат также несовместим с ингибиторами МАО. Усиливает антикоагулянтный эффект гепарина, стрептокиназы, фибринолизина.

С особой осторожностью применять одновременно с никотиновым пластырем, поскольку возможно возникновение приливов, ощущение жара и пульсации в голове.

Особенности применения.

При необходимости одновременного применения сердечных гликозидов с целью предотвращения развития брадикардии и аритмии лечение следует проводить под контролем электрокардиограммы.

После применения препарата возможно ощущение тепла, которое может быть связано с парестезией и приливами. Эти реакции могут продолжаться несколько минут или дольше и интенсивность их может уменьшаться через несколько дней после начала приема Ксантинола никотината.

Осторожно назначать больным с артериальной гипертензией или лабильным артериальным давлением при одновременном применении гипотензивных препаратов или сердечных гликозидов – в связи с возможным риском существенного снижения артериального давления и/или развития аритмии. Вследствие сосудорасширяющего эффекта препарата может возникнуть постуральная гипотензия.

В результате возможного повышения уровня трансаминаз и щелочной фосфатазы при длительном применении Ксантинола никотината необходима осторожность при его назначении больным с печеночной или почечной недостаточностью.

С осторожностью назначать при выраженном атеросклерозе коронарных и церебральных сосудов, тахисистолических нарушениях сердечного ритма, а также больным пожилого возраста.

С особой осторожностью назначают Ксантинола никотинат пациентам, которые недавно перенесли заболевания печени. Сюда относятся и пациенты с синдромом Жильбера, чувствительные к действию на печень никотиновой кислоты и склонные к более выраженному повышению содержания неконъюгированного билирубина.

Необходимо проводить базовые исследования для определения наличия повышенного уровня липидов в сыворотке крови. Чтобы определить уровень липидов в сыворотке крови, необходимо проводить регулярный мониторинг. В случае недостаточного клинического отклика применение препарата необходимо прекратить.

Пациентам с язвенной болезнью в анамнезе следует назначать Ксантинола никотинат с крайней осторожностью и избегать, по возможности, назначения максимальных доз. Никотинат способствует высвобождению гистамина из тучных клеток и усиливает секрецию соляной кислоты в желудке. Необходимо соблюдать осторожность больным с бронхиальной астмой и со склонностью к аллергии.

При длительном применении высоких доз препарата возможно изменение толерантности к глюкозе, изменение биохимических показателей крови, которая требует отмены препарата. У больных сахарным диабетом необходимо чаще определять уровень глюкозы в крови. Больным с имплантированным проводником ритма назначают препарат в меньших дозах.

Препарат не следует применять с алкоголем и кофе.

Применение в период беременности или кормления грудью. Препарат не назначают в период беременности или кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами, учитывая возможность развития головокружения.

Способ применения и дозы. Назначать внутривенно и внутримышечно при острых нарушениях мозгового и периферического кровообращения.

Внутривенно (очень медленно!) вводить при острых нарушениях периферического и мозгового кровообращения. Взрослым назначать внутривенно по 2 мл 15 % раствора 1-2 раза в сутки, переходя в последующем на внутримышечные инъекции – по 2 мл 1-3 раза в сутки. Одновременно назначать перорально по 2 таблетки Ксантинола никотината 3 раза в сутки. В тяжелых случаях вводить внутривенно капельно: 10 мл 15 % раствора препарата (1,5 г) разводить в 200 мл или 500 мл 5 % раствора глюкозы или 0,9 % раствора натрия хлорида. Введение осуществлять в течение 1-4 часов до 4 раз в сутки. Курс лечения определяется индивидуально, ориентировочно до 21 дня, но возможно и более длительное лечение. При нарушениях кровоснабжения тканей внутримышечно вводить по 2 мл 15 % раствора (0,3 г) 1-3 раза в сутки, постепенно увеличивая дозу до 4-6 мл 15 % раствора 2-3 раза в сутки. Длительность лечения зависит от течения заболевания (до 2-3 недель).

В офтальмологической практике взрослым применяют путем ионофореза на глазное яблоко – до 300 мг 1 раз в сутки. Продолжительность первой процедуры 15 минут, продолжительность следующих можно постепенно увеличивать до 20-30 минут. Курс лечения – 15-20 дней.

Дети. Опыт применения детям отсутствует.

Передозировка.

Симптомы: тахикардия, ощущение жара, покалывания и покраснения кожных покровов головы и шеи, ощущение сдавливания в голове, слабость, обморок, тошнота, рвота, диарея, гастралгия. При быстром введении возможны головокружение, одышка, боль за грудиной, выраженная артериальная гипотензия.

Лечение симптоматическое.

Побочные реакции.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности включая сыпь, крапивницу, зуд, озноб, лихорадку, ощущение жара, гиперемию кожных покровов, покалывание, в единичных случаях – ангионевротический отек;

со стороны центральной и периферической нервной системы: повышенная утомляемость, головная боль, головокружение;

со стороны пищеварительного тракта: редко – тошнота, рвота, диарея, анорексия, вздутие живота, дискомфорт в животе, изжога, рецидивирующая язва, гастралгия, повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы;

со стороны сердечно-сосудистой системы: приливы, артериальная гипотензия, тахикардия, в единичных случаях возможно провоцирование приступов стенокардии, нарушений ритма сердца, развития синдрома обкрадывания;

со стороны костно-мышечной системы: мышечные судороги, слабость, артриты в связи с возникновением подагры.

Со стороны кожи и слизистых оболочек: сухость кожи, шелушение эпидермиса, пигментация, гиперкератоз.

Со стороны органов зрения: нечеткость зрения, отеки глаз, экзофтальм, амблиопия, цистоподобные и пятнистые отеки.

Со стороны дыхательной системы: в единичных случаях – чувство нехватки воздуха, одышка;

со стороны эндокринной системы: при длительном применении высоких доз – снижение толерантности к глюкозе;

Биохимические: повышение щелочной фосфатазы, ЛДГ и BSE (форменные элементы крови), повышение уровня мочевой кислоты, что способствует возникновению подагры, гипергликемия.

прочие: общая слабость, гиперурикемия;

общие расстройства и нарушения в месте введения: гиперемия и зуд в месте введения.

Появление этих симптомов при повторном приеме препарата является противопоказанием для продолжения лечения.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Препарат несовместим со строфантином, ингибиторами МАО. Не смешивать в одном шприце с другими лекарственными препаратами.

Упаковка.

По 2 мл в ампуле, по 10 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке;

по 2 мл в ампуле; по 10 ампул в коробке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.