

Пентоксифілін

Склад:

діюча речовина: пентоксифілін;

1 мл розчину містить: пентоксифіліну 20 мг;

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

Лікарська форма Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина.

Фармакотерапевтична група

Периферичні вазодилататори. Код АТС C04A D03.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка

Пентоксифілін є похідним метилксантину. Механізм дії пентоксифіліну пов'язаний з пригніченням фосфодіестерази і накопиченням цАМФ у клітинах гладкої мускулатури судин, клітинах крові, а також в інших тканинах і органах. Пентоксифілін гальмує агрегацію тромбоцитів і еритроцитів, підвищує їх гнучкість, зменшує підвищену концентрацію фібриногену у плазмі крові та підсилює фібриноліз, що зменшує в'язкість крові і покращує її реологічні властивості. Крім того, пентоксифілін спричиняє слабку міотропну судинорозширювальну дію, дещо зменшує загальний периферичний судинний опір та має позитивний інотропний ефект. Внаслідок застосування пентоксифіліну поліпшується мікроциркуляція та постачання тканин киснем, найбільше - у кінцівках, центральній нервовій системі, помірно - у нирках. Препарат незначно розширює коронарні судини.

Фармакокінетика

Головний фармакологічно активний метаболіт 1-(5-гідроксигексил)-3,7-диметилксантин (метаболіт I) 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 та його метаболіт слід розглядати як активне ціле.

Період напіввиведення пентоксифіліну становить 1,6 години.

Пентоксифілін метаболізується повністю, понад 90 % виводиться нирками у вигляді некон'югованих водорозчинних полярних метаболітів. Менше 4 % застосованої дози виводиться з калом. У пацієнтів із тяжкими порушеннями функції нирок екскреція метаболітів уповільнена. У пацієнтів із

порушеною функцією печінки відзначено подовження періоду напіввиведення пентоксифіліну.

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 ендартеріт; 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;
- 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 інфаркт міокарда;
- виразка шлунка та/або кишкові виразки.
-

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування пентоксифіліну та антигіпертензивних препаратів (зокрема інгібіторів ангіотензиперетворювального ферменту) посилює дію останніх, тому потребує відповідного корегування доз гіпотензивних препаратів.

Антикоагулянти, препарати, що зменшують коагуляцію крові. Одночасний прийом пентоксифіліну і препаратів, що зменшують коагуляцію крові, підвищує можливість кровотечі, тому слід частіше контролювати протромбіновий час. У постмаркетинговому періоді 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.

Циметидин. При одночасному введенні циметидину відбувається значне підвищення концентрації пентоксифіліну у сироватці крові. Необхідно уважно стежити за можливим виникненням ознак передозування пентоксифіліну. Інші антагоністи H₂-рецепторів (фамотидин, ранітидин і нізатидин) значно менше впливають на метаболізм пентоксифіліну.

Теофілін. Одночасне введення пентоксифіліну і теофіліну може призвести до збільшення концентрації теофіліну у сироватці крові. Тому необхідно стежити за концентрацією теофіліну у сироватці крові, у разі необхідності - зменшувати його дозу.

Кеторолак, мелоксикам. Одночасне застосування пентоксифіліну і кеторолаку може призвести до збільшення протромбінового часу і підвищити ризик кровотечі. Ризик кровотечі може також збільшуватися при супутньому застосуванні пентоксифіліну і мелоксикаму. Тому одночасне лікування цими препаратами не рекомендується.

Ципрофлоксацин. Ципрофлоксацин гальмує метаболізм пентоксифіліну у печінці, тому одночасне застосування пентоксифіліну і ципрофлоксацину може призвести до збільшення концентрації пентоксифіліну у сироватці крові. При необхідності проведення одночасного лікування пентоксифіліном і ципрофлоксацином рекомендується вдвічі зменшити дозу пентоксифіліну.

Інсулін та пероральні протидіабетичні препарати. Великі внутрішньовенні дози пентоксифіліну можуть посилити гіпоглікемічні ефекти інсуліну та пероральних протидіабетичних препаратів, тому слід відповідно корегувати дозування інсуліну або гіпоглікемічного препарату.

Нітрати. Пентоксифілін посилює дію нітратів.

Еритроміцин. Немає даних про можливу взаємодію пентоксифіліну і еритроміцину. Однак при сумісному застосуванні пентоксифіліну і еритроміцину відзначається підвищення плазматичного рівня теофіліну з проявами токсичних реакцій.

Особливості застосування.

При перших ознаках розвитку анафілактичної/анафілактоїдної реакції лікування препаратом слід припинити та звернутися за допомогою до лікаря.

У разі застосування пентоксифіліну пацієнтам із хронічною серцевою недостатністю попередньо слід досягти фази компенсації кровообігу.

У пацієнтів, 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.

Особливо уважне спостереження необхідне за пацієнтами, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та ципрофлоксацином (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Хворим на системний червоний вовчак (СЧВ) 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 таких пацієнтів при прийомі 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»).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Пентоксифілін не слід застосовувати у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Даних немає, проте слід враховувати імовірність виникнення побічних реакцій з боку центральної нервової системи.

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 крапельної інфузії становить 60-360 хвилин, тобто введення 100 мг пентоксифіліну має тривати щонайменше 60 хвилин. Інфузія може бути доповнена пероральним прийомом пентоксифіліну (400 мг) із розрахунку, що максимальна добова доза (інфузійна і пероральна) становить 1200 мг.

2. При тяжкому стані пацієнта (особливо при постійному болю, при гангрені або трофічних виразках) можливе проведення інфузії пентоксифіліну протягом 24 годин. При такій схемі введення дозу визначати з 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 застосовувати шляхом внутрішньовенної ін`єкції по 5 мл

(100 мг). Ін`єкцію виконувати повільно, протягом 5 хвилин, положення пацієнта - лежачи.

Тривалість парентерального курсу лікування визначається лікарем, який проводить лікування. Після поліпшення стану пацієнта рекомендовано продовжити лікування, застосовуючи таблетовану форму препарату.

Діти.

Досвід застосування препарату дітям відсутній.

Передозування.

Симптоми: слабкість, нудота, запаморочення, зниження/підвищення артеріального тиску, непритомний стан, тахікардія, сонливість або збудження, втрата свідомості, гіпертермія, арефлексія, тоніко-клонічні судоми, ознаки шлунково-кишкової кровотечі - блювання (блювотні маси кольору кавової гущі), гарячка, відчуття жару (припливи).

Лікування: при появі перших симптомів передозування (пітливість, нудота, ціаноз) негайно припинити застосування препарату, необхідно забезпечити більш низьке положення голови і верхньої частини тулуба, контролювати вільну прохідність дихальних шляхів. Проводити симптоматичну терапію, особливу увагу слід приділити підтримці артеріального тиску і функції дихання. Для купірування судомних нападів вводити діазепам.

Побічні реакції

З боку серцево-судинної системи: тахікардія, периферичний набряк, почервоніння обличчя або відчуття жару (припливи), стенокардія, нетиповий біль у грудях, артеріальна гіпотензія, артеріальна гіпертензія, задишка, відчуття нестачі повітря, аритмія, серцебиття.

З боку крові та лімфатичної системи: тромбоцитопенія з тромбоцитопенічною пурпурою, лейкопенія, панцитопенія (що може мати летальний наслідок), подовження протромбінового часу, гіпофібриногенемія, анемія, апластична анемія, кровотечі (наприклад, із судин шкіри, слизових оболонок, шлунка, кишечника, носа).

З боку нервової системи: головний біль, мігрень, запаморочення, асептичний менінгіт (при застосуванні високих доз), тремор рук, безсоння, збудження, неспокій, відчуття страху, втрата свідомості, порушення сну, галюцинації, потемніння в очах, заміління кінцівок, гіпергідроз, судоми, парестезії.

З боку органів чуття: порушення зору, скотома, сльозотеча, кон'юнктивіти, біль у вухах, крововиливи у сітківку, відшарування сітківки.

З боку шлунково-кишкового тракту: шлунково-кишкові розлади, відчуття тиску у шлунку, переповнення шлунку, діарея, нудота, блювання (у т.ч. неодноразове), метеоризм, епігастральний біль, анорексія, атонія кишечника, запор, сухість у горлі, спрага.

З боку метаболізму: гіпоглікемія, гіпокаліємія.

З боку імунної системи: алергічні реакції (анафілактичні/анафілактоїдні реакції до шоку, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм, почервоніння шкіри, свербіж, висипання, кропив'янка), токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла), синдром Стівенса-Джонсона.

З боку гепатобіліарної системи: внутрішньопечінковий холестаза, підвищення активності ферментів печінки, загострення холециститу, холестатичний гепатит.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: підвищене потовиділення, гіперемія шкіри обличчя та верхньої частини грудної клітки, набряки, макулопапульозні висипання, дерматит, підвищена ламкість нігтів.

Зміни у місці введення: біль у місці введення, гіперемія, набряк, висипання.

Інші: порушення смаку, підвищене слиновиділення, нездужання, болі у горлі/шиї, ларингіт, закладеність носа, збільшення/зменшення маси тіла, озноб, гарячка, гіпертермічний синдром.

Лабораторні показники: підвищення активності печінкових трансаміназ (АЛТ, АСТ, ЛДГ) і лужної фосфатази.

Більшість побічних реакцій пов'язані з дозуванням. Їх можна звести до мінімуму або зовсім уникнути при зменшенні дози.

Якщо мають місце тяжкі побічні реакції, лікування слід припинити.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморозувати. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Не слід змішувати препарат з іншими лікарськими засобами в одній ємкості, за винятком розчинів, зазначених у розділі «Спосіб застосування та дози».

Упаковка.

По 5 мл в ампулі; по 10 ампул у коробці; по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 1 або 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13

Інструкція препарату Пентоксифілін представлена виключно з ознайомчою метою. Кваліфіковану допомогу в призначенні Пентоксифіліну з метою лікування, його дозування, схему лікування, протипоказання і сумісність з іншими медикаментами, може надати тільки ваш особистий лікар. Пам'ятайте, самолікування небезпечно для вашого здоров'я!