

Состав

действующее вещество: пентоксифиллин;

1 мл раствора содержит пентоксифиллина 20 мг;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Периферические вазодилататоры. Производные пурина. Код АТХ С04А D03.

Фармакодинамика

Пентоксифиллин является производным метилксантина. Механизм действия пентоксифиллина связан с угнетением фосфодиэстеразы и накоплением цАМФ в клетках гладкой мускулатуры сосудов, клетках крови, а также в других тканях и органах. Пентоксифиллин тормозит агрегацию тромбоцитов и эритроцитов, повышает их гибкость, уменьшает повышенную концентрацию фибриногена в плазме крови и усиливает фибринолиз, что уменьшает вязкость крови и улучшает ее реологические свойства. Кроме того, пентоксифиллин вызывает слабую миотропное сосудорасширяющее действие, несколько уменьшает общее периферическое сосудистое сопротивление и имеет положительный инотропный эффект. В результате применения пентоксифиллина улучшается микроциркуляция и снабжение тканей кислородом, больше всего - в конечностях, ЦНС, умеренно - в почках. Препарат незначительно расширяет коронарные сосуды.

Фармакокинетика

Главный фармакологически активный метаболит 1- (5-гидроксигексил) -3,7-диметилксантин (метаболит I) определяется в плазме крови в концентрации, превышающей в 2 раза концентрацию неизмененного вещества и находится с ним в состоянии обратной биохимического равновесия. Поэтому пентоксифиллин и его метаболит следует рассматривать как активное целое. Период полувыведения пентоксифиллина составляет 1,6 часа. Пентоксифиллин

метаболизируется полностью, более 90% выводится почками в виде неконъюгированных водорастворимых полярных метаболитов. Менее 4% дозы выводится с калом. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек экскреция метаболитов замедлена. У пациентов с нарушением функции печени отмечено удлинение периода полувыведения пентоксифиллина.

Показания

Атеросклеротическая энцефалопатия ишемический церебральный инсульт дисциркуляторная энцефалопатия нарушения периферического кровообращения, обусловленные атеросклерозом, сахарным диабетом (в том числе с диабетической ангиопатией), воспалением; трофические расстройства в тканях, связанные с поражением вен или нарушением микроциркуляции (посттромбофлебитический синдром, трофические язвы, гангрена, отморожения) облитерирующий эндартериит; ангионейропатия (болезнь Рейно); нарушение кровообращения глаза (острая, подострая, хроническая недостаточность кровообращения в сетчатке и сосудистой оболочке глаза) нарушение функции внутреннего уха сосудистого генеза, сопровождающиеся снижением слуха.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность допентоксифиллину, другим компонентам лекарственного средства или к другим препаратам группы метилксантинов;
- массивные кровотечения (риск усиления кровотечения);
- кровоизлияния в сетчатку глаза, мозг; если во время ликувания пентоксифилином происходит кровоизлияние в сетчатку глаза, применение лекарственного средства следует сразу прекратить;
- геморрагический диатез;
- острый инфаркт миокарда;
- язва желудка и / или кишечные язвы;
- беременность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Одновременное применение пентоксифиллина и антигипертензивных препаратов (в частности ингибиторов ангиотензинперетворювального фермента) усиливает действие последних, поэтому требует соответствующей корректировки доз гипотензивных препаратов. Антикоагулянты, препараты, уменьшающие коагуляцию крови.

Одновременный прием пентоксифиллина и препаратов, уменьшающих коагуляцию крови, повышает возможность кровотечения, поэтому следует чаще контролировать протромбиновое время. В постмаркетинговом периоде сообщалось о случаях повышения антикоагулянтной активности у пациентов, которые одновременно получали лечение пентоксифиллином и антивитаминами К. Когда назначается или меняется дозирование пентоксифиллина, рекомендуется проводить контроль антикоагулянтной активности в этой группе пациентов. Циметидин.

При одновременном введении циметидина происходит значительное повышение концентрации пентоксифиллина в сыворотке крови. Необходимо внимательно следить за возможным возникновением признаков передозировки пентоксифиллина. Другие антагонисты H₂ рецепторов (фамотидин, ранитидин и низатидин) значительно меньше влияют на метаболизм пентоксифиллина.

Теofilлин. Одновременное введение пентоксифиллина и теofilлина может привести к повышению концентрации теofilлина в сыворотке крови. Поэтому необходимо следить за концентрацией теofilлина в сыворотке крови, в случае необходимости - уменьшать дозу.

Кеторолак, мелоксикам. Одновременное применение пентоксифиллина и кеторолака может привести к увеличению протромбинового времени и повысить риск кровотечения. Риск кровотечения может также увеличиваться при одновременном применении пентоксифиллина и мелоксикама. Поэтому одновременное лечение этими препаратами не рекомендуется.

Ципрофлоксацин. Ципрофлоксацин тормозит метаболизм пентоксифиллина в печени, поэтому одновременное применение пентоксифиллина и ципрофлоксацина может привести к увеличению концентрации пентоксифиллина в сыворотке крови. При необходимости проведения одновременного лечения пентоксифиллином и ципрофлоксацином рекомендуется вдвое уменьшить дозу пентоксифиллина.

Инсулин и пероральные противодиабетические препараты. Большие внутривенные дозы пентоксифиллина могут усилить гипогликемические эффекты инсулина и пероральных противодиабетических препаратов, поэтому следует соответственно корректировать дозировку инсулина или гипогликемического препарата.

Нитраты. Пентоксифиллин усиливает действие нитратов.

Эритромицин. Нет данных о возможном взаимодействии пентоксифиллина и эритромицина. Однако при совместном применении пентоксифиллина и

эритромицина отмечается повышение плазменного уровня теофиллина с проявлениями токсических реакций.

Ингибиторы агрегации тромбоцитов. Из-за повышенного риска возникновения кровотечения одновременное применение ингибиторов агрегации тромбоцитов (например, клопидогреля, эптифибатида, тирофибан, эпопростенола, илопроста, абциксимаба, анагрелида, нестероидные противовоспалительные средства (НПВС), кроме селективных ингибиторов ЦОГ-2, ацетилсалицилатов (ацетилсалициловой кислоты (АСК) / лизина ацетилсалицилата (ЛАС), тиклопидина, дипиридамола) с пентоксифиллином следует проводить с осторожностью.

Особенности применения

При первых признаках развития анафилактические / анафилактоидные реакции лечение следует прекратить и обратиться за помощью к врачу. В случае применения пентоксифиллина пациентам с хронической сердечной недостаточностью предварительно следует достичь фазы компенсации кровообращения. У пациентов, страдающих диабетом и получающих лечение инсулином или пероральными гипогликемическими средствами, при применении высоких доз препарата возможно усиление влияния этих препаратов на уровень сахара в крови (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

В этих случаях следует уменьшить дозу инсулина или пероральных противодиабетических средств и особенно тщательно ухаживать за пациентом. Особенно внимательное наблюдение необходимо за пациентами, которые одновременно получают лечение пентоксифиллином и ципрофлоксацином (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»). Больным системной красной волчанкой (СКВ) или с другими заболеваниями соединительной ткани пентоксифиллин можно назначать только после тщательного анализа возможных рисков и пользы.

Поскольку во время лечения пентоксифиллином существует риск развития апластической анемии, нужен регулярный контроль общего анализа крови. У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 30 мл / мин) или тяжелой дисфункцией печени выведение пентоксифиллина может быть замедленное. Нужен надлежащий мониторинг. Особенно внимательное наблюдение необходимо для: пациентов с тяжелыми сердечными аритмиями; пациентов с инфарктом миокарда; пациентов с артериальной гипотонией; пациентов с выраженным атеросклерозом церебральных и коронарных сосудов, особенно при сопутствующей артериальной гипертензии и нарушениях

сердечного ритма.

У таких пациентов при приеме препарата возможны приступы стенокардии, аритмии и артериальная гипертензия; пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина ниже 30 мл / мин); пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью, пациентов с высокой склонностью к кровотечениям, обусловленной, например, лечением антикоагулянтами или нарушениями свертывания крови.

По кровотечениям- см. раздел «Противопоказания»; пациентов с язвой желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе, пациентов, недавно перенесших оперативное лечение (повышенный риск возникновения кровотечения, в связи с чем требуется систематический контроль уровня гемоглобина и гематокрита) пациентов, для которых снижение артериального давления составляет высокий риск (например, пациентов с тяжелой ишемической болезнью сердца или стенозом сосудов, которые поставляют кровь к мозгу) пациентов, которые одновременно получают лечение пентоксифиллином и антивитаминами К (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»); пациентов, которые одновременно получают лечение пентоксифиллином и гипогликемическими средствами (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Важная информация о вспомогательных веществах.

Это лекарственное средство содержит 9 мг / мл натрия. Следует соблюдать осторожность при применении у пациентов, которые придерживаются натрий-контролируемой диеты.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Данных нет, однако следует учитывать вероятность возникновения побочных реакций со стороны центральной нервной системы.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Опыт применения лекарственного средства беременным женщинам недостаточен. Поэтому не следует назначать препарат в период беременности.

Кормление грудью

Пентоксифиллин в незначительных количествах проникает в грудное молоко. Если назначается лечение пентоксифиллином, необходимо прекратить кормление грудью.

Способ применения и дозы

Внутривенные инфузии являются наиболее эффективными формами парентерального введения препарата, которые лучше переносятся. Режим дозирования определяется врачом и зависит от степени тяжести циркуляторных нарушений, массы тела и переносимости лечения. Инфузию можно проводить только в случае, если раствор является прозрачным. Рекомендовано взрослым такие схемы лечения

1. Инфузия 100-600 мг пентоксифиллина в 100-500 мл раствора Рингера лактата, 0,9% раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы 1-2 раза в сутки. Продолжительность внутривенной инфузии составляет 60-360 минут, то есть введение 100 мг пентоксифиллина должно длиться не менее 60 минут.

Инфузия может быть дополнена пероральным приемом пентоксифиллина (400 мг) из расчета, что максимальная суточная доза (инфузионная и пероральная) составляет 1200 мг.

2. При тяжелом состоянии пациента (особенно при постоянной боли, при гангрене или трофических язвах) возможно проведение инфузии пентоксифиллина в течение 24 часов. При такой схеме введения дозу определять из расчета 0,6 мг / кг / час. Рассчитанная таким образом суточная доза для пациента с массой тела 70 кг составляет 1000 мг, для пациента с массой тела 80 кг - 1150 мг.

Независимо от массы тела пациента максимальная суточная доза составляет 1200 мг. Объем инфузионных растворов рассчитывается индивидуально с учетом сопутствующих заболеваний, состояния пациента и составляет в среднем 1-1,5 л в сутки.

3. В отдельных случаях препарат применять путем внутривенной инъекции по 5 мл (100 мг). Инъекцию выполнять медленно, в течение 5 минут, положение пациента - лежа.

Продолжительность парентерального курса лечения определяется врачом, который проводит лечение. После улучшения состояния пациента рекомендовано продолжить лечение, применяя таблетированную форму препарата.

Дети

Опыт применения лекарственного средства у детей отсутствует.

Передозировка

Симптомы: слабость, тошнота, головокружение, снижение / повышение артериального давления, обморочное состояние, аритмия, тахикардия, сонливость или возбуждение, потеря сознания, гипертермия, арефлексия, тонико-клонические судороги, признаки желудочно-кишечного кровотечения - рвота (рвотные массы цвета кофейной гущи), лихорадка, ощущение жара (приливы).

Лечение: при появлении первых симптомов передозировки (потливость, тошнота, цианоз) немедленно прекратить применение препарата. Необходимо обеспечить более низкое положение головы и верхней части туловища, контролировать свободную проходимость дыхательных путей. Проводить симптоматическую терапию, особое внимание следует уделить поддержке артериального давления и функции дыхания. Для купирования судорожных припадков вводить диазепам.

Побочные реакции

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, периферические отеки, покраснение лица или ощущение жара (приливы), стенокардия, нетипичная боль в груди, артериальная гипотензия, артериальная гипертензия, одышка, ощущение нехватки воздуха, аритмия, сердцебиение.

Со стороны крови и лимфатической системы: тромбоцитопения с тромбоцитопенической пурпурой, лейкопения, панцитопения (что может иметь летальный исход), удлинение протромбинового времени, гипофибриногенемия, анемия, апластическая анемия, кровотечения (например, из сосудов кожи, слизистых оболочек, желудка, кишечника, носа).

Со стороны нервной системы: головная боль, мигрень, головокружение, асептический менингит (при применении высоких доз), тремор рук, бессонница, возбуждение, беспокойство, чувство страха, потеря сознания, нарушение сна, галлюцинации, потемнение в глазах, онемение конечностей, гипергидроз, судороги, парестезии.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, скотома, слезотечение, конъюнктивит, боль в ушах, кровоизлияния в сетчатку, отслойка сетчатки.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: желудочно-кишечные расстройства, ощущение давления в желудке, переполнения желудка, диарея, тошнота, рвота (в т.ч. неоднократное), метеоризм, боль в области эпигастрия, анорексия, атония кишечника, запор, сухость в горле, жажда.

Со стороны метаболизма: гипогликемия, гипокалиемия. Со стороны иммунной системы: аллергические реакции (анафилактические / анафилактоидные реакции в шок, ангионевротический отек, бронхоспазм, покраснение кожи, зуд, сыпь, крапивница), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны пищеварительной системы: внутрипеченочный холестаз, повышение активности ферментов печени, обострение холецистита, холестатический гепатит.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: повышенное потоотделение, гиперемия кожи лица и верхней части грудной клетки, отеки, макулопапулезные высыпания, дерматит, повышенная ломкость ногтей. Изменения в месте введения боль в месте введения, гиперемия, отек, сыпь.

Другие: нарушение вкуса, повышенное слюноотделение, недомогание, боли в горле / шее, ларингит, заложенность носа, увеличение / уменьшение массы тела, озноб, лихорадка, гипертермический синдром.

Лабораторные показатели: повышение активности печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ, ЛДГ) и щелочной фосфатазы. Большинство побочных реакций связаны с дозировкой. Их можно свести к минимуму или вовсе избежать при уменьшении дозы. Если имеют место тяжелые побочные реакции, лечение следует прекратить.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства является важной процедурой. Это позволяет продолжать мониторинг соотношения «польза / риск» для соответствующего лекарственного средства. Медицинским работникам необходимо сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл в ампуле; по 5 ампул в контурной ячеечной упаковке; по 2 контурные ячеечные упаковки в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЗАО «Фармацевтическая фирма» Дарница ».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).