

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

Пентилін (Pentilin®)

Склад:

діюча речовина: 1 мл розчину містить 20 мг пентоксифіліну;

допоміжні речовини: динатрію едетат, натрію хлорид, натрію дигідрофосфат дигідрат, натрію гідрофосфат дигідрат, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Периферичні вазодилататори. АТС C04A D03.

Клінічні характеристики.

Показання.

Гострі порушення мозкового кровообігу (ішемічний напад).

Гострі порушення периферичного артеріального кровообігу (макро- і мікроциркуляції) внаслідок атеросклерозу, цукрового діабету і вазоспазму (переміжна кульгавість, діабетична мікро- і макроангіопатія, синдром Рейно).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до пентоксифіліну, будь-якого інгредієнта препарату та похідних ксантину, таких як теофілін, кофеїн, холіну теофілінат, амінофілін або теобромін.

Пентилін не слід застосовувати при гострому інфаркті міокарда, при масивних кровотечах, при значних крововиливах у сітківку, при крововиливах у мозок.

Вагітність та період годування груддю.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначають внутрішньовенно.

Режим дозування визначається лікарем і залежить від ступеня тяжкості циркуляторних порушень, маси тіла і переносимості лікування.

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 або 2 рази на добу. Тривалість внутрішньовенної краплинної інфузії становить від 60 хв до 360 хв, тобто введення 100 мг пентоксифіліну має тривати щонайменше 60 хв. При поліпшенні клінічних симптомів парентеральне лікування може бути доповнено пероральним прийомом таблеток Пентилін (400 мг) з 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 препарату протягом 24 годин. При такій схемі введення дозу визначають з розрахунку 0,6 мг/кг/год. Розрахована таким чином добова доза для пацієнта масою 70 кг становить 1000 мг, для пацієнта масою 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 1,0-1,5 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, пацієнт має перебувати у лежачому положенні. Тривалість парентерального курсу лікування визначає лікар, який проводить лікування. Після поліпшення стану пацієнта рекомендовано продовжити лікування, використовуючи таблетовану форму препарату Пентилін.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Дозування при нирковій недостатності

Якщо кліренс креатиніну становить менш ніж 30 мл/хв (0,5 мл/сек), дозу препарату підбирають індивідуально, знижуючи її приблизно на 30-50 %.

Дозування при печінковій недостатності

При вираженій печінковій недостатності слід зменшити дозування Пентиліну, розчину для ін'єкцій, залежно від індивідуальної переносимості препарату.

Пацієнти літнього віку

Для пацієнтів літнього віку немає потреби в коригуванні дозування.

Побічні реакції.

Побічні реакції, що можуть мати місце під час лікування пентоксифіліном, указані за частотою появи:

- дуже часто: >1/10,
- часто: >1/100, <1/10,
- нечасто: >1/1000, <1/100,
- рідко: >1/10 000, <1/1000,
- дуже рідко: <1/10 000, включаючи поодинокі випадки.

Частота появи побічних реакцій за окремими системами організму:

З боку серцево-судинної системи

- рідко: тахікардія;
- нечасто: почервоніння обличчя або відчуття жару (припливи);
- дуже рідко: нетиповий біль у грудях, артеріальна гіпотензія, стенокардія.

З боку кров'яної та лімфатичної систем

- поодинокі випадки: тромбоцитопенія, лейкопенія, подовження протромбінового часу, апластична анемія, кровотечі (наприклад, із судин шкіри, слизових оболонок, шлунка, кішківника).

З боку нервової системи

- рідко: головний біль, запаморочення, асептичний менінгіт (при застосуванні високих доз);
- поодинокі випадки: тремор рук, безсоння, неспокій.

З боку шлунково-кишкового тракту

- часто: відчуття тиску в шлунку, переповнення, діарея;
- нечасто: нудота, блювання, метеоризм, епігастральний біль.

З боку метаболізму

- дуже рідко: гіпоглікемія, гіпокаліємія.

З боку імунної системи

- поодинокі випадки: алергічні реакції (анафілактична реакція до шоку, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм, почервоніння шкіри).

З боку печінки та жовчного міхура

- дуже рідко: холестаза, підвищення активності ферментів печінки.

З боку шкіри та підшкірних тканин

- нечасто: кропив'янка, свербіж;
- дуже рідко: підвищене потовиділення.

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

Якщо мають місце тяжкі побічні реакції, то лікування слід припинити.

Передозування.

Першими симптомами передозування можуть бути: нудота, запаморочення, тахікардія, артеріальна гіпотензія. У подальшому можливі підвищення температури тіла, збудження, втрата свідомості, арефлексія, клоніко-тонічні судоми та як ознака шлунково-кишкової кровотечі – блювання типу «кавової гущі».

Лікування передозування

Введення препарату слід негайно припинити та у разі необхідності провести симптоматичне

лікування: підтримка або корегування артеріального тиску, підтримка дихання і усунення судом.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Пентилін не слід застосовувати під час вагітності. Під час лікування Пентиліном слід припинити годування груддю.

Діти.

Безпеку застосування пентоксифіліну для пацієнтів віком до 18 років не було встановлено, тому препарат не застосовують у педіатричній практиці.

Особливості застосування.

Для пацієнтів з лабільним або зниженим артеріальним тиском, або зі значним зниженням функції нирок (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв), для пацієнтів з групи особливого ризику щодо наслідків зниження артеріального тиску (наприклад, при тяжкому ступені ураження коронарних судин, вираженому стенозі магістральних судин мозку) необхідно розпочинати лікування з низких доз, підбирати дозу індивідуально і збільшувати її поступово з урахуванням переносимості лікування.

Відносним протипоказанням для парентерального застосування є виражений атеросклероз церебральних та коронарних судин, особливо при супутній артеріальній гіпертензії та порушеннях серцевого ритму. У цих пацієнтів при прийомі препарату можливі напади стенокардії, аритмії та артеріальної гіпертензії.

У пацієнтів з іншими захворюваннями і станами, які супроводжуються підвищеним ризиком виникнення кровотечі (стан після операції, виразки шлунка та дванадцятипалої кишки в анамнезі), необхідно перевіряти протромбіновий час, гематокрит і концентрацію гемоглобіну.

При інфаркті міокарда слід особливо ретельно зважувати показання для лікування Пентиліном, враховуючи всі можливі побічні реакції, що можуть виникати при застосуванні препарату.

У разі застосування Пентиліну у пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю попередньо слід досягти фази компенсації кровообігу.

Препарат слід призначати з обережністю пацієнтам з цукровим діабетом, оскільки застосування високих доз пентоксифіліну може посилити вплив інсуліну або пероральних антидіабетичних препаратів на рівень цукру в крові. У цих випадках слід зменшити дозу інсуліну або пероральних антидіабетичних препаратів і особливо ретельно контролювати стан пацієнта.

При порушенні функції нирок (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв.), дозу препарату підбирають індивідуально, знижуючи її приблизно на 30-50 %.

При вираженій печінковій недостатності слід зменшити дозування Пентиліну, розчину для ін'єкцій, залежно від індивідуальної переносимості препарату.

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

Пентилін має незначний вплив або не впливає на здатність керувати автомобілем та іншими механічними засобами. Проте в окремих пацієнтів він може спричинити запаморочення, і тому непрямим чином вплинути на зменшення психофізичної здатності керувати автомобілем та працювати з іншими механічними засобами. Доки пацієнти не з'ясують, як саме вони реагують на лікування, їм не рекомендується керувати автомобілем або працювати з іншими механічними засобами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

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

Антикоагулянти, препарати, що зменшують коагуляцію крові

Одночасний прийом пентоксифіліну та препаратів, що зменшують коагуляцію крові, підвищує

можливість кровотечі, тому слід частіше контролювати протромбіновий час.

Циметидин

При одночасному введенні циметидину відбувається значне підвищення концентрації пентоксифіліну у сироватці крові. Необхідно уважно стежити за можливою появою 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

Паралельне 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 підсилити гіпоглікемічні ефекти інсуліну та пероральних протидіабетичних препаратів, тому слід відповідно корегувати дозування інсуліну або гіпоглікемічного препарату.

Нітрати

Пентоксифілін посилює дію нітратів.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії пентоксифіліну пов'язують із пригніченням фосфодіестерази і накопиченням цАМФ у клітинах гладенької 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 посилює фібриноліз, що зменшує в'язкість крові і поліпшує 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 покращується мікроциркуляція та постачання тканин киснем, найбільше – в кінцівках, ЦНС, помірно – у нирках. Препарат незначно розширює коронарні судини.

Фармакокінетика.

Розподіл

Після застосування препарату пентоксифілін повільно вивільняється протягом 10-12 годин, тому постійний рівень у плазмі підтримується приблизно протягом 12 год.

Згідно з різними джерелами, об'єм розподілу, за яким пентоксифілін розподіляється дуже швидко після абсорбції, має діапазон від 168 ± 82,3 л до 376 ± 135 л. Пентоксифілін зв'язується з мембранами еритроцитів та швидко метаболізується. На даний момент не було повідомлень про жодне значне зв'язування пентоксифіліну з білками плазми.

Метаболізм

Головним чином пентоксифілін метаболізується в печінці та меншою мірою – в еритроцитах. Після повного поглинання пентоксифілін зазнає першопрохідного метаболізму. Абсолютна біологічна доступність пентоксифіліну становить 20-30 %. У процесі редукції (за допомогою □-кеторедуктази) пентоксифілін розпадається на фармакологічно активний метаболіт 1, а шляхом окиснення – на кілька інших метаболітів, серед яких важливе значення має фармакологічно активний метаболіт 5. Вміст

ЗАТВЕРДЖЕНО Сторінка 5 з 5. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України
головного активного метаболіту (1-(5-гідроксигексил)-3,7-диметилксантин) удвічі перевищує концентрації пентоксифіліну, обидві речовини, взаємно біохімічно збалансовані. Тому як пентоксифілін, так і його метаболіт вважаються активною одиницею, і біологічна доступність метаболіту помітно вища, ніж у пентоксифіліну.

Виведення

Період напіввиведення пентоксифіліну після перорального застосування становить приблизно 1,6 годин.

Пентоксифілін повністю метаболізується, і понад 90 % застосованої дози виводиться через нирки у формі некон'югованих, розчинних у воді полярних метаболітів. Приблизно 94 % та 4 % пентоксифіліну виділяються у вигляді метаболітів, відповідно з сечею та калом. Приблизно 2 % застосованої дози виділяється у вигляді незміненого пентоксифіліну. Виділення метаболітів відбувається із затримкою у пацієнтів з важкими порушеннями ниркової функції.

Період напіввиведення та абсолютна біологічна доступність пентоксифіліну може підвищуватись при порушенні функції печінки.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий безбарвний розчин, практично без видимих часток.

Несумісність.

Невідома.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 5 мл (100 мг) розчину для ін'єкцій в ампулі; по 5 ампул у блістері в картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. КРКА, д.д., Ново место.

Місцезнаходження. Шмар'єшка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія.