

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ПЕНТОКСИФИЛЛИН

Регистрационный номер: ЛСР-003008/08

Торговое наименование: Пентоксифиллин

Международное непатентованное наименование: пентоксифиллин

Лекарственная форма: таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Одна таблетка содержит:

Действующее вещество: пентоксифиллин — 100 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат — 40,0 мг, повидон К-17 (поливинилпирролидон низкомолекулярный) — 9,2 мг, крахмал картофельный — 7,5 мг, метилцеллюлоза — 1,7 мг, стеариновая кислота — 1,6 мг. *Оболочка:* Акрил-из белый [метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] (тип С) — 40,00 %, тальк — 37,25 %, титана диоксид — 15,00 %, триэтилцитрат — 4,80 %, кремния диоксид коллоидный безводный — 1,25 %, натрия гидрокарбонат — 1,20 %, натрия лаурилсульфат — 0,50 %] — 9,998 мг, краситель азорубин (кармуазин) — 0,002 мг.

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета. На поперечном разрезе таблетки: ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: вазодилатирующее средство.

Код АТХ: C04AD03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Пентоксифиллин уменьшает вязкость крови и улучшает реологические свойства крови (текучесть) за счет:

- улучшения нарушенной деформируемости эритроцитов;
- уменьшения агрегации тромбоцитов и эритроцитов;

- снижения концентрации фибриногена;
- снижения активности лейкоцитов и уменьшения адгезии лейкоцитов к эндотелию сосудов.

В качестве действующего вещества препарат Пентоксифиллин содержит производное ксантина — пентоксифиллин. Механизм его действия связан с ингибированием фосфодиэстеразы и накоплением циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) в клетках гладкой мускулатуры сосудов и форменных элементах крови.

Оказывая слабое миотропное сосудорасширяющее действие, пентоксифиллин несколько уменьшает общее периферическое сосудистое сопротивление и незначительно расширяет коронарные сосуды.

Пентоксифиллин обладает слабым положительным инотропным эффектом на сердце.

Улучшает микроциркуляцию в зонах нарушенного кровообращения.

Лечение препаратом Пентоксифиллин приводит к улучшению симптоматики нарушений мозгового кровообращения.

При окклюзионных заболеваниях периферических артерий применение пентоксифиллина приводит к удлинению дистанции ходьбы, устранению ночных судорог в икроножных мышцах и исчезновению болей в покое.

Фармакокинетика

После приема внутрь пентоксифиллин быстро и почти полностью всасывается.

Пентоксифиллин подвергается эффекту «первичного прохождения» через печень. Абсолютная биодоступность исходной субстанции составляет 19 ± 13 %. Концентрация основного активного метаболита 1-(5-гидроксигексил)-3,7-диметилксантина (метаболит I) в плазме крови в 2 раза превышает концентрацию исходного пентоксифиллина. Метаболит I находится с пентоксифиллином в обратимом биохимическом редокс-равновесии. Поэтому пентоксифиллин и метаболит I рассматриваются вместе как активная единица. Вследствие этого доступность активной субстанции значительно больше.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) пентоксифиллина после приема внутрь составляет 1,6 ч.

Пентоксифиллин полностью метаболизируется и более чем 90 % выводится через почки в форме неконъюгированных водорастворимых метаболитов.

Пациенты с нарушениями функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек выведение метаболитов замедляется.

Пациенты с нарушениями функции печени

У пациентов с нарушениями функции печени $T_{1/2}$ пентоксифиллина удлиняется и абсолютная биодоступность увеличивается.

Показания к применению

- окклюзионная болезнь периферических артерий атеросклеротического или диабетического генеза (например, «перемежающаяся» хромота, диабетическая ангиопатия);
- трофические нарушения (например, трофические язвы голеней, гангрена);
- нарушения мозгового кровообращения (последствия церебрального атеросклероза, как, например, снижение концентрации внимания, головокружение, ухудшение памяти), ишемические и постинсультные состояния;
- нарушения кровообращения в сетчатой и в сосудистой оболочке глаза;
- отосклероз, дегенеративные изменения на фоне патологии сосудов внутреннего уха и снижения слуха.

Противопоказания

- гиперчувствительность к пентоксифиллину, другим производным метилксантинам или любому вспомогательному веществу препарата;
- массивные кровотечения (риск усиления кровотечения);
- обширные кровоизлияния в сетчатую оболочку глаза (риск усиления кровотечения);
- кровоизлияния в головной мозг;
- острый инфаркт миокарда;
- непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- беременность и период грудного вскармливания;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность препарата не установлена).

С осторожностью

- тяжелые нарушения ритма сердца (риск ухудшения аритмии);
- артериальная гипотензия (риск дальнейшего снижения артериального давления);
- хроническая сердечная недостаточность;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки;
- нарушения функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин) (риск кумуляции и повышенный риск развития побочных эффектов);
- тяжелые нарушения функции печени (риск кумуляции и повышенный риск развития побочных эффектов);
- недавно перенесенные оперативные вмешательства;
- повышенный риск развития кровотечений (например, при нарушениях в системе свертывания крови (риск развития более тяжелых кровотечений));

- одновременное применение с антикоагулянтами (в т.ч., непрямыми антикоагулянтами [антагонистами витамина К]);
- одновременное применение с ингибиторами агрегации тромбоцитов (клопидогрел, эптифибатид, тирофибан, эпопростенол, илопрост, абциксимаб, анагрелид, НПВП [кроме селективных ингибиторов циклооксигеназы-2], ацетилсалициловая кислота, тиклопидин, дипиридамол);
- одновременное применение с гипогликемическими средствами (инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь);
- одновременное применение с ципрофлоксацином;
- одновременное применение с теофиллином.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Препарата Пентоксифиллин не рекомендуется к применению при беременности (так как недостаточно данных).

Период грудного вскармливания

Пентоксифиллин проникает в грудное молоко в незначительных количествах. При необходимости применения препарата следует прекратить грудное вскармливание (учитывая отсутствие опыта применения).

Способ применения и дозы

Внутрь, после приема пищи, не разжевывая и не разламывая, запивая достаточным количеством воды.

Дозировка устанавливается врачом в соответствии с индивидуальными особенностями пациента.

Обычная доза составляет: 1 таблетка 3 раза в сутки с последующим медленным повышением дозы до 200 мг 2–3 раза в сутки. Максимальная разовая доза — 400 мг. Максимальная суточная доза — 1200 мг.

У пациентов с нарушенной функцией почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин) дозировка может быть снижена до 1–2 таблеток в сутки.

Уменьшение дозы, с учетом индивидуальной переносимости, необходимо у пациентов с тяжелым нарушением функции печени.

Лечение может быть начато малыми дозами у пациентов с низким артериальным давлением, а также у лиц, находящихся в группе риска ввиду возможного снижения артериального давления (пациенты с тяжелой формой ишемической болезни сердца или гемодинамически значимыми стенозами сосудов головного мозга). В этих случаях доза может быть увеличена только постепенно.

Побочное действие

Нарушения со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, асептический менингит, судороги.

Нарушения со стороны психики: агитация, нарушение сна, тревога.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: лейкопения/нейтропения, тромбоцитопения, панцитопения, гипофибриногенемия.

Нарушения со стороны иммунной системы: анафилактические/анафлактоидные реакции, ангионевротический отек, анафилактический шок, бронхоспазм.

Нарушения со стороны органа зрения: нарушение зрения, скотома.

Нарушения со стороны сердца: тахикардия, аритмия, стенокардия, снижение артериального давления.

Нарушения со стороны сосудов: «приливы» крови к кожным покровам, кровотечения (в том числе, кровотечения из сосудов кожи, слизистых оболочек, желудка, кишечника).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: ксеростомия (сухость полости рта), анорексия, атония кишечника, чувство давления и переполнения в области желудка, тошнота, рвота, диарея, запор, гиперсаливация (повышенное слюноотделение).

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: внутрипеченочный холестаз, повышение активности «печеночных» трансаминаз, повышение активности щелочной фосфатазы.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: кожный зуд, кожная сыпь, эритема (покраснение кожи), крапивница, отеки, повышенная ломкость ногтей.

Передозировка

Симптомы: головокружение, слабость, тошнота, тахикардия, снижение артериального давления, покраснение кожных покровов, потеря сознания, повышение температуры тела, агитация, рефлексия, тонико-клонические судороги, рвота «кофейной гущей», аритмии.

Лечение: специфический антидот препарата неизвестен. При передозировке необходимо проводить симптоматическое лечение. Особое внимание должно быть направлено на поддержание артериального давления и функции дыхания. Судорожные припадки снимают введением диазепама.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С гипотензивными средствами

Пентоксифиллин повышает риск развития артериальной гипотензии при одновременном применении с гипотензивными средствами (например, ингибиторы ангиотензин-

превращающего фермента (АПФ)) или другими лекарственными средствами, обладающими потенциальным антигипертензивным эффектом (например, нитраты).

С гипогликемическими средствами (инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь)

Гипогликемическое действие инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь может усиливаться при одновременном применении пентоксифиллина (повышенный риск развития гипогликемии). Необходим строгий контроль состояния таких пациентов, включая регулярный гипогликемический контроль.

С лекарственными средствами, влияющими на свертывающую систему крови

Пентоксифиллин может усиливать действие лекарственных средств, влияющих на свертывающую систему крови (непрямые и прямые антикоагулянты, тромболитики, антибиотики, такие как цефалоспорины).

При одновременном применении пентоксифиллина и непрямых антикоагулянтов (антагонистов витамина К) в постмаркетинговых исследованиях отмечались случаи усиления антикоагулянтного действия (риск развития кровотечений). Поэтому в начале приема пентоксифиллина или изменения его дозы рекомендуется контролировать степень выраженности антикоагулянтного действия у пациентов, принимающих данную комбинацию препаратов, например, проводить регулярный контроль МНО (международное нормализованное отношение).

С циметидином

Циметидин повышает концентрацию пентоксифиллина и активного метаболита I в плазме крови (риск возникновения побочных эффектов).

С другими ксантинами

Совместное назначение с другими ксантинами может приводить к чрезмерному нервному возбуждению.

С теофиллином

У некоторых пациентов при одновременном применении пентоксифиллина и теофиллина отмечается увеличение концентрации теофиллина в плазме крови. В дальнейшем это может приводить к увеличению или усилению побочных реакций, связанных с теофиллином.

С ципрофлоксацином

У некоторых пациентов при одновременном применении пентоксифиллина и ципрофлоксацина отмечается увеличение концентрации пентоксифиллина в плазме крови. В дальнейшем это может приводить к увеличению или усилению побочных реакций, связанных с применением данной комбинации.

С ингибиторами агрегации тромбоцитов

При одновременном применении пентоксифиллина с ингибиторами агрегации тромбоцитов (клопидогрел, эптифибатид, тирофибан, эпопростенол, илопрост, абциксимаб, анагрелид, НПВП [кроме селективных ингибиторов циклооксигеназы-2], ацетилсалициловая кислота, тиклопидин, дипиридамол) возможно развитие потенциального аддитивного действия, увеличивающего риск развития кровотечения. Поэтому из-за риска развития кровотечения следует с осторожностью применять пентоксифиллин одновременно с вышеперечисленными ингибиторами агрегации тромбоцитов.

Особые указания

Лечение следует проводить под контролем артериального давления.

Пациенты с выраженными нарушениями функции почек при приеме пентоксифиллина нуждаются в особенно тщательном врачебном наблюдении. В случае если в период применения препарата у пациентов возникают кровоизлияния в сетчатку глаза, то препарат немедленно отменяют.

У пациентов с сахарным диабетом, принимающих гипогликемические средства, назначение в больших дозах может вызвать гипогликемию (требуется коррекция дозы).

При назначении одновременно с антикоагулянтами необходимо тщательно следить за показателями свертывающей системы крови.

У пациентов, недавно перенесших оперативное вмешательство, необходим систематический контроль уровня гемоглобина и гематокрита.

У пожилых людей может потребоваться уменьшение дозы (повышение биодоступности и снижение скорости выведения).

Пациентам с низким и нестабильным артериальным давлением необходимо уменьшить дозу пентоксифиллина.

Курение может снижать терапевтическую эффективность препарата.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Учитывая возможные побочные эффекты (например, головокружение), следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях потенциально опасными видами деятельности.

Форма выпуска

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой, 100 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку или по 60 таблеток во флакон полимерный.

По 6, 12 контурных ячейковых упаковок или по 1 флакону полимерному вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

При уничтожении неиспользованных упаковок препарата специальных мер предосторожностей не требуется.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение:

АО «Фармпроект», Россия,

192236, г. Санкт-Петербург, ул. Софийская, д. 14, лит. А.

Тел./факс: +7 (812) 331 93 10

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей:

АО «Фармпроект», Россия,

192236, г. Санкт-Петербург, ул. Софийская, д. 14, лит. А.

Тел./факс: +7 (812) 331 93 10

Управляющий

АО «Фармпроект»



С.С.Саакян