

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ВАЗИТРЕН

(VAZITREN)

Склад:

діюча речовина: пентоксифілін;

1 мл розчину містить пентоксифіліну 20 мг;

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

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвний прозорий розчин.

Фармакотерапевтична група. Периферичні вазодилататори. Код АТХ С04А D03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Пентоксифілін є похідним метилксантину. Механізм дії пентоксифіліну пов'язують із 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 поліпшує її реологічні властивості. Крім того, пентоксифілін чинить слабку міотропну судинорозширювальну дію, дещо зменшує загальний периферичний судинний опір та має позитивний іотропний ефект. Внаслідок застосування пентоксифіліну покращується мікроциркуляція та постачання тканин киснем, найбільше - в 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 в концентрації, що перевищує у 2 рази концентрацію незміненої речовини і перебуває з нею у стані зворотної біохімічної рівноваги. У зв'язку з цим 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 % введеної дози виводиться з калом. У пацієнтів із тяжкими порушеннями функції нирок екскреція метаболітів уповільнена. У пацієнтів із порушеннями функції печінки відзначено подовження періоду напіввиведення пентоксифіліну.

Клінічні характеристики.

Показання.

Атеросклеротична енцефалопатія; ішемічний церебральний інсульт; дисциркуляторна енцефалопатія; порушення периферичного кровообігу, зумовлені атеросклерозом, цукровим діабетом (включно з діабетичною ангіопатією), запаленням; трофічні розлади у тканинах, які пов'язані з ураженням вен або порушенням мікроциркуляції (посттромбофлебітичний синдром, трофічні виразки, гангрена, відмороження); облітеруючий ендартеріт; ангіонейропатії (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.

Пентоксифілін протипоказаний пацієнтам:

- із підвищеною чутливістю до пентоксифіліну, до інших метилксантинів або до будь-якої з допоміжних речовин препарату Вазитрен;
- з масивною кровотечею (ризик посилення кровотечі);
- з обширним крововиливом у сітківку ока, при крововиливах у мозок (ризик посилення кровотечі).

Якщо під час лікування пентоксифіліном відбувається крововилив у сітківку ока, застосування лікарського засобу слід одразу припинити:

- у гострий період інфаркту міокарда;
- з виразкою шлунка та/або кишковими виразками;
- з геморагічним діатезом.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Ефект зниження рівня цукру у крові, властивий інсуліну або пероральним антидіабетичним засобам, може посилюватися. Тому пацієнти, які отримують медикаментозне лікування при

цукровому діабеті, мають перебувати під ретельним спостереженням.

Відомо про випадки підвищення антикоагулянтної активності у пацієнтів, які одночасно отримували лікування пентоксифіліном та антивітаміними К. Коли призначається або змінюється дозування пентоксифіліну, рекомендується проводити контроль антикоагулянтної активності у цієї групи пацієнтів.

Пентоксифілін може посилювати гіпотензивну дію антигіпертензивних засобів та інших препаратів, які можуть викликати зниження артеріального тиску.

Супутнє застосування пентоксифіліну і теофіліну у деяких пацієнтів може призводити до зростання рівня теофіліну у крові. Тому можливе збільшення частоти та посилення проявів побічних реакцій теофіліну.

У деяких пацієнтів одночасне застосування з ципрофлоксацином може призводити до підвищення концентрації пентоксифіліну в сироватці крові. Як наслідок, може зростати частота і вираженість побічних реакцій, пов'язаних з одночасним застосуванням препаратів.

Потенціальний адитивний ефект з інгібіторами агрегації тромбоцитів: через підвищений ризик виникнення кровотечі одночасне застосування інгібіторів агрегації тромбоцитів (наприклад, клопідогрелю, ептіфібатиду, тирофібану, епопростенолу, ілопросту, абциксимабу, анагреліду, НПЗП, крім селективних інгібіторів ЦОГ-2, ацетилсаліцилатів [АСК/ЛАС], тиклопідину, дипіридамолу) з пентоксифіліном слід проводити з обережністю.

Одночасне застосування з циметидином може підвищувати концентрацію пентоксифіліну та метаболіту I у плазмі крові.

Особливості застосування.

При перших ознаках розвитку анафілактичної/анафілактоїдної реакції слід негайно припинити інфузію пентоксифіліну та звернутися за допомогою до лікаря.

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

У хворих, які страждають на діабет і отримують лікування інсуліном або пероральними гіпоглікемічними засобами, при застосуванні високих доз пентоксифіліну 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 антидіабетичних засобів і особливо ретельно доглядати за пацієнтом.

Хворим на системний червоний вовчак (СЧВ) або на інші захворювання 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 загальний аналіз 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:

- з тяжкою серцевою аритмією;
- з артеріальною гіпотензією;
- з вираженим атеросклерозом церебральних та коронарних судин, особливо при супутній артеріальній гіпертензії та порушеннях серцевого ритму (у цих пацієнтів при прийомі препарату можливі напади стенокардії, аритмії та артеріальна гіпертензія);
- з нирковою недостатністю (кліренс креатиніну нижче 30 мл/хв);
- з тяжкою печінковою недостатністю;
- з високою схильністю до кровотеч, зумовленою, наприклад, лікуванням антикоагулянтами або порушеннями згортання крові (щодо кровотеч див. розділ «Протипоказання»);
- які нещодавно перенесли оперативне лікування (підвищений ризик виникнення кровотечі, у зв'язку з чим потрібен систематичний контроль рівня гемоглобіну та гематокриту);
- для яких зниження артеріального тиску становить високий ризик (наприклад, пацієнтів з тяжкою ішемічною хворобою серця або стенозом судин, які постачають кров до мозку);
- які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та антивітаміними К або інгібіторами агрегації тромбоцитів (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та антидіабетичними засобами (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та ципрофлоксацином (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та теофіліном (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Через відсутність достатнього досвіду застосування не слід призначати пентоксифілін під час вагітності.

Період годування груддю. Пентоксифілін у незначних кількостях проникає у грудне молоко. Якщо призначається лікування пентоксифіліном, годування груддю необхідно припинити.

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

Спосіб застосування та дози.

Внутрішньовенні інфузії є найбільш ефективними 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 прозорий.

Рекомендуються такі схеми лікування дорослих:

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 краплинної 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. За такої схеми введення дозу визначають із розрахунку 0,6 мг/кг/годину. 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 застосовують шляхом внутрішньовенної ін'єкції по 5 мл (100 мг). Ін'єкцію виконують повільно, протягом 5 хвилин, положення пацієнта – лежачи.

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

Порядок роботи з ампулою:

1. Відокремити одну ампулу від блоку і струснути її, утримуючи за горлечко (Рис. 1).
2. Стиснути ампулу рукою (при цьому не повинно відбуватися виділення препарату) і обергальними рухами звернути і відокремити голівку (Рис. 2).
3. Через отвір, що утворився, негайно з'єднати шприц з ампулою (Рис. 3).
4. Перевернути ампулу і повільно втягнути в шприц її вміст (Рис. 4).
5. Надіти голку на шприц.



Рис. 1

Рис. 2

Рис. 3

Рис.4

Діти.

Не застосовувати.

Передозування.

Симптоми. Початковими симптомами гострого передозування пентоксифіліном є нудота, запаморочення або зниження артеріального тиску. Крім того, можуть розвиватися такі симптоми, як гарячка, збудження, відчуття жару (припливи), тахікардія, втрата свідомості, арефлексія, аритмія, тоніко-клонічні судоми та блювота кольору кавової гущі як ознака шлунково-кишкової кровотечі.

Лікування. З метою лікування гострого передозування і попередження виникнення ускладнень необхідне загальне і специфічне інтенсивне медичне спостереження і запровадження терапевтичних заходів.

Побічні реакції.

Лабораторні показники: підвищення рівня трансаміназ.

З боку серця: аритмія, тахікардія, стенокардія, зниження артеріального тиску, підвищення артеріального тиску.

З боку кровотворної та лімфатичної системи: тромбоцитопенія з тромбоцитопенічною пурпурою та апластична анемія (часткове або повне припинення утворення всіх клітин крові, панцитопенія), що може мати летальний наслідок, лейкопенія/нейтропенія.

З боку нервової системи: запаморочення, головний біль, асептичний менінгіт, тремор, парестезія, судоми.

З боку шлунково-кишкового тракту: шлунково-кишкові розлади, відчуття тиску у шлунку, метеоризм, нудота, блювання, діарея, запор, гіперсалівація.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: свербіж, почервоніння шкіри і кропив'янка, токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла), синдром Стівенса-Джонсона, висипання.

З боку судин: відчуття жару (припливи), кровотечі, периферичні набряки.

З боку імунної системи: анафілактичні реакції, анафілактоїдні реакції, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм та анафілактичний шок.

З боку печінки і жовчовивідних шляхів: внутрішньопечінковий холестааз.

Психічні розлади: збудження та порушення сну, галюцинації.

З боку органів зору: порушення зору, кон'юнктивіт, крововиливи у сітківку, відшарування сітківки.

Загальні порушення: гіпоглікемія, підвищена пітливість, підвищення температури тіла.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: <https://aisf.dec.gov.ua>.

Термін придатності.

2,5 роки.

Умови зберігання.

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

Несумісність.

Препарат не слід змішувати в одній ємкості з іншими розчинами, за винятком розчинів, зазначених у розділі «Спосіб застосування та дози».

Упаковка. По 5 мл в ампулі поліетиленовій. По 5 або 50 ампул у пачці з картону.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ «ФАРМАСЕЛ».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 07408, Київська обл., Броварський р-н, с. Квітневе, вул. Прорізна, 3.