

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

КСАНТИНОЛУ НІКОТИНАТ
(XANTINOL NICOTINATE)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить ксантинолу нікотинату у перерахуванні на 100 % речовину – 150 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат (гранулак-70); крохмаль картопляний; повідон; кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або майже білого кольору, круглої форми з плоскою поверхнею, рискою та фаскою.

Фармакотерапевтична група. Периферичні вазодилататори. Похідні пурину.

Код АТХ C04A D02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Судинорозширювальний, антиагрегаційний, антиатеросклеротичний засіб, поєднує властивості теофіліну та нікотинової кислоти.

Блокує аденозинові рецептори і фосфодіестеразу, підвищуючи рівень циклічної аденозинмонофосфорної кислоти у клітині, субстратно стимулює синтез нікотинаденін-динуклеотиду та нікотинаденіндинуклеотидфосфату. Чинить судинорозширювальну дію, знижуючи загальний периферичний опір судин і поліпшуючи мікроциркуляцію, оксигенацію і живлення тканин, зменшує в'язкість крові; активує мозковий кровообіг; гальмує агрегацію тромбоцитів, активує фібриноліз; посилює скорочення серця. При тривалому застосуванні здатний затримувати розвиток атеросклеротичних змін, знижує рівень холестерину та атерогенних ліпідів, підвищує активність ліпопротеїнази. При тривалому застосуванні може знижувати артеріальний тиск.

Фармакокінетика.

Добре всмоктується у травному тракті, біотрансформується з утворенням ксантинолу та нікотинової кислоти. Екскретується нирками – головним чином – у вигляді нетоксичних метаболітів. Терапевтична концентрація у плазмі крові 10-20 мг/кг. Період напіввиведення – приблизно 5 годин.

Клінічні характеристики.

Показання. У складі комплексної терапії при таких захворюваннях і станах: порушення мозкового кровообігу, атеросклероз коронарних і мозкових судин, облітеруючий атеросклероз судин нижніх кінцівок, хвороба Рейно, хвороба Бюргера, облітеруючий ендартеріт, гострий артеріальний тромбоз, діабетичні ангіопатія та ретинопатія, гострий тромбофлебіт (поверхневих і глибоких вен), посттромбофлебітичний синдром, трофічні виразки нижніх кінцівок, пролежні, мігрень, синдром Мен'єра, дерматози (порушення трофіки судинного генезу), гіперхолестеринемія, гіпертригліцеридемія.

Препарат у даній лікарській формі застосовувати наприкінці гострої фази процесу.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до будь-яких компонентів препарату, а також до теофіліну та нікотинової кислоти;
- гостра та хронічна серцева недостатність II-III ступеня;
- гострий інфаркт міокарда;
- гостра ниркова недостатність;
- гостра серцева недостатність або тяжка застійна серцева недостатність;
- гостра кровотеча;
- виразка шлунка і дванадцятипалої кишки у стадії загострення;
- глаукома;
- мітральний стеноз.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Щоб уникнути різкого зниження артеріального тиску, препарат не можна призначати у комплексі з гіпотензивними засобами (бета-адреноблокаторами, альфа-адреноблокаторами, симпатолітиками, гангліоблокаторами, алкалоїдами ріжків). При сумісному застосуванні зі строфантином та іншими серцевими глікозидами можливе виникнення брадикардії та аритмій. Препарат також несумісний з інгібіторами MAO, алкоголем та кавою. Посилює антикоагулянтний ефект гепарину, стрептокінази, фібринолізину.

З особливою обережністю застосовувати одночасно з нікотиновими пластирами, оскільки можливе виникнення припливів, відчуття жару і пульсації в голові.

Особливості застосування. При необхідності одночасного застосування серцевих глікозидів з метою запобігання розвитку брадикардії та аритмії лікування слід проводити під контролем електрокардіограми.

Через 10-15 хвилин після прийому таблетки можливе відчуття тепла, яке може бути пов'язане з парестезією і припливами. Ці реакції можуть тривати 10-20 хвилин або довше і інтенсивність їх може зменшуватися через кілька днів після початку прийому Ксантинолу нікотинату.

Обережно призначати хворим з артеріальною гіпертензією або лабільним артеріальним тиском при одночасному призначенні гіпотензивних препаратів або серцевих глікозидів через можливий ризик значного зниження артеріального тиску та/або розвитку аритмії. Внаслідок судинорозширювального ефекту препарату може виникнути постуральна гіпотензія. Внаслідок можливого підвищення рівня трансаміназ і лужної фосфатази при тривалому застосуванні Ксантинолу нікотинату необхідна обережність при його призначенні хворим із печінковою або нирковою недостатністю.

З обережністю застосовувати при вираженому атеросклерозі коронарних і церебральних судин, тахісистолічних порушеннях серцевого ритму, у хворих літнього віку.

У хворих на цукровий діабет, які приймають Ксантинолу нікотинат, слід частіше, ніж зазвичай, визначати рівень глюкози в крові.

При тривалому застосуванні високих доз препарату можлива зміна толерантності до глюкози, підвищення рівня печінкових ферментів, зміна біохімічних показників крові, що потребує відміни препарату.

З особливою обережністю призначають Ксантинолу нікотинат пацієнтам, які нещодавно перенесли захворювання печінки. Сюди належать і пацієнти з

синдромом Жильбера, чутливі до дії на печінку ніотинової кислоти і схильні до більш вираженого підвищення вмісту некон'югованого білірубіну.

Необхідно проводити базові дослідження для визначення наявності підвищеного рівня ліпідів у сироватці крові. Щоб визначити рівень ліпідів у сироватці крові, потрібно проводити регулярний моніторинг. У разі недостатнього клінічного відклику застосування препарату необхідно припинити.

Оскільки препарат містить лактозу, його не слід застосовувати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Пацієнтам з виразковою хворобою в анамнезі слід призначати Ксантинолу нікотинат з крайньою обережністю і уникати, по можливості, призначення максимальних доз. Нікотинат сприяє вивільненню гістаміну з тучних клітин і посилює секрецію соляної кислоти у шлунку. Тому необхідно дотримуватися обережності хворим з підвищеною чутливістю до подразнення шлунково-кишкового тракту, з бронхіальною астмою та зі схильністю до алергії.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Препарат не призначають у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Необхідно дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами, враховуючи можливість розвитку запаморочення.

Спосіб застосування та дози.

Призначати дорослим внутрішньо після їди. Таблетки ковтати, не розжовуючи.

Початкова доза зазвичай становить 1 таблетку (150 мг) 3 рази на добу. При необхідності разову дозу збільшити до 2-3 таблеток (300-450 мг) 3 рази на добу, потім, по мірі поліпшення стану, дозу знижувати до 1 таблетки 2-3 рази на добу. Максимальна добова доза за умови доброї переносимості терапії становить 12 таблеток (1800 мг).

Курс лікування визначає лікар залежно від перебігу захворювання та переносимості препарату.

При гострих порушеннях мозкового та периферичного кровообігу перевагу віддають ін'єкційній формі препарату.

Діти. Ефективність і безпека застосування препарату у дитячому віці не встановлені, тому препарат не слід застосовувати цій категорії пацієнтів.

Передозування. Симптоми: різко виражені артеріальна гіпотензія, тахікардія, відчуття жару, поколювання та почервоніння шкірних покривів голови і шиї, відчуття стискання в голові, слабкість, запаморочення, непритомність, нудота, блювання, діарея, гастралгія.

Лікування: хворого слід укласти; зазначені симптоми зазвичай минають самостійно через

10-15 хвилин і не потребують спеціального лікування. Наявність вираженої артеріальної гіпотензії вимагає проведення симптоматичної терапії.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: алергічні реакції, включаючи шкірні висипання (уртикарні, еритематозно-папульозні), свербіж, відчуття жару, поколювання, гіперемія шкіри у верхній частині тіла, особливо шиї та голови, у поодиноких випадках – ангіоневротичний набряк.

З боку центральної та периферичної нервової системи: підвищена втомлюваність, слабкість, запаморочення, головний біль.

З боку серцево-судинної системи: припливи, відчуття жару, артеріальна гіпотензія; серцебиття, у поодиноких випадках можливе провокування нападів стенокардії, порушень серцевого ритму, розвитку синдрому обкрадання.

З боку травної системи: рідко – нудота, блювання, діарея, анорексія, гастралгія, здуття живота, метеоризм, дискомфорт у животі, печія, рецидивна виразка, підвищення активності печінкових трансаміназ та лужної фосфатази.

З боку кістково-м'язової системи: м'язові судоми, слабкість, артрити у зв'язку з виникненням подагри.

З боку шкіри та слизових оболонок: сухість шкіри, лущення епідермісу, пігментація, гіперкератоз.

З боку органів зору: нечіткість зору, набряки очей, екзофтальм, амбліопія, цистоподібні та плямисті набряки.

З боку ендокринної системи: при тривалому застосуванні високих доз – зниження толерантності до глюкози.

Біохімічні: підвищення лужної фосфатази, ЛДГ і BSE (формові елементи крові), підвищення рівня сечової кислоти, що сприяє виникненню подагри, гіперглікемія.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці, при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

Таблетки по 150 мг, по 10 таблеток у блістері, 6 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПАТ «Галичфарм» або ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

79024, Україна, м. Львів, вул. Опришківська, 6/8 або

01032, Україна, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

КСАНТИНОЛА НИКОТИНАТ
(XANTINOL NICOTINATE)

Состав:

действующее вещество: 1 таблетка содержит ксантинола никотината в пересчете на 100 % вещество – 150 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат (гранулак-70); крахмал картофельный; повидон; кальция стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета, круглой формы с плоской поверхностью, риской и фаской.

Фармакотерапевтическая группа. Периферические вазодилататоры. Производные пурина. Код АТХ С04А D02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Сосудорасширяющее, антиагрегационное, антиатеросклеротическое средство, сочетает свойства теофиллина и никотиновой кислоты.

Блокирует аденозиновые рецепторы и фосфодиэстеразу, повышая уровень циклической аденозинмонофосфорной кислоты в клетке, субстратно стимулирует синтез никотинадениндинуклеотида и никотинадениндинуклеотидфосфата. Оказывает сосудорасширяющее действие, снижая общее периферическое сопротивление сосудов и улучшая микроциркуляцию, оксигенацию и питание тканей, уменьшает вязкость крови; активизирует мозговое кровообращение; тормозит агрегацию тромбоцитов, активизирует фибринолиз; усиливает сокращения сердца. При длительном применении способен задерживать развитие атеросклеротических изменений, снижает уровень холестерина и атерогенных липидов, повышает активность липопротеинлипазы. При длительном применении может снижать артериальное давление.

Фармакокинетика.

Хорошо всасывается в пищеварительном тракте, биотрансформируется с образованием ксантинола и никотиновой кислоты. Выводится почками – главным образом – в виде нетоксичных метаболитов. Терапевтическая концентрация в плазме крови 10-20 мг/кг. Период полувыведения – примерно 5 часов.

Клинические характеристики.

Показания. В составе комплексной терапии при таких заболеваниях и состояниях: нарушение мозгового кровообращения, атеросклероз коронарных и мозговых сосудов, облитерирующий атеросклероз сосудов нижних конечностей, болезнь Рейно, болезнь Бюргера, облитерирующий эндартериит, острый артериальный тромбоз, диабетическая ангиопатия и ретинопатия, острый тромбофлебит (поверхностных и глубоких вен), посттромбофлебитический синдром, трофические язвы нижних конечностей, пролежни, мигрень, синдром Меньера, дерматозы (нарушение трофики сосудистого генеза), гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия.

Препарат в данной лекарственной форме применять в конце острой фазы процесса.

Противопоказания.

- Повышенная чувствительность к любым компонентам препарата, а также к теофиллину и никотиновой кислоте;
- острая и хроническая сердечная недостаточность II-III степени;
- острый инфаркт миокарда;
- острая почечная недостаточность;
- острая сердечная недостаточность или тяжелая застойная сердечная недостаточность;
- острое кровотечение;
- язва желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения;
- глаукома;
- митральный стеноз.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. Чтобы избежать резкого снижения артериального давления, препарат нельзя назначать в комплексе с гипотензивными средствами (бета-адреноблокаторами, альфа-адреноблокаторами, симпатолитиками, ганглиоблокаторами, алкалоидами спорыньи). При совместном применении с строфантином и другими сердечными гликозидами возможно возникновение брадикардии и аритмий. Препарат также несовместим с ингибиторами MAO, алкоголем и кофе. Усиливает антикоагулянтный эффект гепарина, стрептокиназы, фибринолизина.

С особой осторожностью применять одновременно с никотиновым пластырем, поскольку возможно возникновение приливов, ощущение жара и пульсации в голове.

Особенности применения. При необходимости одновременного применения сердечных гликозидов с целью предотвращения развития брадикардии и аритмии лечение следует проводить под контролем электрокардиограммы.

Через 10-15 минут после приема таблетки возможно ощущение тепла, которое может быть связано с парестезией и приливами. Эти реакции могут продолжаться 10-20 минут или дольше и интенсивность их может уменьшаться через несколько дней после начала приема Ксантинола никотината.

Осторожно назначать больным с артериальной гипертензией или лабильным артериальным давлением при одновременном назначении гипотензивных препаратов или сердечных гликозидов из-за возможного риска значительного снижения артериального давления и/или развития аритмии. Вследствие сосудорасширяющего эффекта препарата может возникнуть постуральная гипотензия. Вследствие возможного повышения уровня трансаминаз и щелочной фосфатазы при длительном применении Ксантинола никотината необходима осторожность при его назначении больным с печеночной или почечной недостаточностью.

С осторожностью применять при выраженном атеросклерозе коронарных и церебральных сосудов, тахисистолических нарушениях сердечного ритма, у больных пожилого возраста.

У больных сахарным диабетом, принимающих Ксантинола никотинат, следует чаще, чем обычно, определять уровень глюкозы в крови.

При длительном применении высоких доз препарата возможно изменение толерантности к глюкозе, повышение уровня печеночных ферментов, изменение биохимических показателей крови, что требует отмены препарата. С особой осторожностью назначают Ксантинола никотинат пациентам, которые недавно перенесли заболевания печени. Сюда относятся и пациенты с синдромом Жильбера, чувствительны к действию на печень никотиновой кислоты и склонны к более выраженному повышению содержания неконъюгированного билирубина.

Необходимо проводить базовые исследования для определения наличия повышенного уровня липидов в сыворотке крови. Чтобы определить уровень липидов в сыворотке крови, нужно проводить регулярный мониторинг. В случае недостаточного клинического отклика применение препарата необходимо прекратить.

Поскольку препарат содержит лактозу, его не следует применять пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Пациентам с язвенной болезнью в анамнезе следует назначать Ксантинола никотинат с крайней осторожностью и избегать, по возможности, назначение максимальных доз. Никотинат способствует высвобождению гистамина из тучных клеток и усиливает секрецию соляной кислоты в желудке. Поэтому необходимо соблюдать осторожность больным с повышенной чувствительностью к раздражению желудочно-кишечного тракта, с бронхиальной астмой и со склонностью к аллергии.

Применение в период беременности или кормления грудью. Препарат не назначают в период беременности или кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами, учитывая возможность развития головокружения.

Способ применения и дозы.

Назначать взрослым внутрь после еды. Таблетки глотать, не разжевывая.

Начальная доза обычно составляет 1 таблетку (150 мг) 3 раза в сутки. При необходимости разовую дозу увеличить до 2-3 таблеток (300-450 мг) 3 раза в сутки, затем, по мере улучшения состояния, дозу снижать до 1 таблетки 2-3 раза в сутки. Максимальная суточная доза при хорошей переносимости терапии составляет 12 таблеток (1800 мг).

Курс лечения определяет врач в зависимости от течения заболевания и переносимости препарата.

При острых нарушениях мозгового и периферического кровообращения предпочтение отдают инъекционной форме препарата.

Дети. Эффективность и безопасность применения препарата в детском возрасте не установлены, поэтому препарат не следует применять этой категории пациентов.

Передозировка. *Симптомы:* резко выраженные артериальная гипотензия, тахикардия, ощущение жара, покалывание и покраснение кожных покровов головы и шеи, ощущение сжатия в голове, слабость, головокружение, обморок, тошнота, рвота, диарея, гастралгия.

Лечение: больного следует уложить; указанные симптомы обычно проходят самостоятельно через 10-15 минут и не требуют специального лечения. Наличие выраженной артериальной гипотензии требует проведения симптоматической терапии.

Побочные реакции.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая кожные высыпания (уртикарные, эритематозно-папулезные), зуд, ощущение жара, покалывания, гиперемия кожи в верхней части тела, особенно шеи и головы, в единичных случаях – ангионевротический отек.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: повышенная утомляемость, слабость, головокружение, головная боль.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: приливы, чувство жара, артериальная гипотензия; сердцебиение, в единичных случаях возможно провоцирование приступов стенокардии, нарушений сердечного ритма, развития синдрома обкрадывания.

Со стороны пищеварительной системы: редко – тошнота, рвота, диарея, анорексия, гастралгия, вздутие живота, метеоризм, дискомфорт в животе, изжога, рецидивная язва, повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечные судороги, слабость, артриты в связи с возникновением подагры.

Со стороны кожи и слизистых оболочек: сухость кожи, шелушение эпидермиса, пигментация, гиперкератоз.

Со стороны органов зрения: нечеткость зрения, отеки глаз, экзофтальм, амблиопия, цистоподобные и пятнистые отеки.

Со стороны эндокринной системы: при длительном применении высоких доз – снижение толерантности к глюкозе.

Биохимические: повышение щелочной фосфатазы, ЛДГ и BSE (форменные элементы крови), повышение уровня мочевой кислоты, что способствует возникновению подагры, гипергликемия.

Срок годности. 4 года.

Условия хранения.

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

Таблетки по 150 мг, по 10 таблеток в блистере, 6 блистеров в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Галичфарм» или ПАО «Киевмедпрепарат».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

79024, Украина, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8 или

01032, Украина, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.