Склад

діюча речовина: пентоксифілін;

1 таблетка містить 600 мг пентоксифіліну;

допоміжні речовини: гіпромелоза 15000, гіпромелоза 5, кросповідон, целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, макрогол 6000, тальк, титану діоксид (Е 171), поліакрилатна дисперсія.

Лікарська форма

Таблетки ретард, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: довгасті, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою білого кольору, з розподільчою рискою з обох боків.

Фармакотерапевтична група

Периферичні вазодилататори. Код АТХ С04А D03.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка.

Препарат покращує мікроциркуляцію та реологічні властивості крові, чинить судинорозширювальну дію. Активна речовина – пентоксифілін – є похідною ксантину. Механізм дії пов’язаний з інгібуванням фосфодіестерази і накопиченням цАМФ у клітинах гладкої мускулатури судин, формених клітинах крові, інших тканинах та органах. Пентоксифілін гальмує агрегацію тромбоцитів і еритроцитів, підвищує їх еластичність, знижує рівень фібриногену в плазмі крові і посилює фібриноліз, що знижує в’язкість крові і поліпшує її реологічні властивості. Препарат поліпшує забезпечення тканин киснем у зонах порушеного кровообігу, передусім у кінцівках, центральній нервовій системі, менше – у нирках. Незначною мірою розширює коронарні судини.

Спеціальна форма пролонгованого вивільнення з таблетки забезпечує постійне та тривале підтримання ефекту, що дає можливість застосування з більшими інтервалами.

Фармакокінетика.

Властивості таблетки забезпечують безперервне вивільнення активної речовини та її рівномірне всмоктування зі шлунково-кишкового тракту. Препарат піддається метаболізму «першого проходження» в печінці, внаслідок чого утворюється низка фармакологічно активних метаболітів. Абсолютна біодоступність препарату становить в середньому 19,4 %. Вазоніт не зв’язується з білками плазми. Максимальна концентрація пентоксифіліну та його активних метаболітів в плазмі крові досягається через 3-4 години і зберігається на терапевтичному рівні близько 12 годин. Препарат виводиться головним чином із сечею, у вигляді метаболітів – 90 % виводиться нирками.

У пацієнтів з нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) виведення Вазоніту і його метаболітів затримується.

У пацієнтів з печінковою недостатністю період напіввиведення подовжується і абсолютна біодоступність підвищується.

Показання

Для подовження дистанції безбольової ходи у пацієнтів з хронічним оклюзійним ураженням периферичних артерій на стадії IIb за Фонтеном (переміжна кульгавість), коли інші заходи, такі як тренування ходи, ангіопластика та/або відновлювальні процедури, не можуть бути проведені або не показані.

Дисфункція внутрішнього вуха, спричинена розладами кровообігу (включаючи туговухість і раптову втрату слуху).

Протипоказання

Вазоніт протипоказаний:

- пацієнтам із підвищеною чутливістю до пентоксифіліну, до інших метилксантинів або до будь-якої з допоміжних речовин препарату;
- пацієнтам 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;
- пацієнтам із крововиливом у мозок чи іншою клінічно значущою кровотечею;
- пацієнтам у гострий період інфаркту міокарда;
- пацієнтам із виразкою шлунка та/або кишковими виразками;
- пацієнтам із геморагічним діатезом.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами

При одночасному призначенні із зазначеними нижче препаратами слід враховувати можливість лікарських взаємодій.

Засоби, які знижують артеріальний тиск.

Пентоксифілін може посилювати дію антигіпертензивних засобів, і зниження артеріального тиску може бути більш вираженим.

Антикоагулянти.

Пентоксифілін може посилювати вплив антикоагулянтів. Пацієнтам з підвищеною схильністю до розвитку кровотеч, наприклад тим, які отримують супутнє лікування антикоагулянтами, потрібен ретельний моніторинг (зокрема регулярний контроль МНС (міжнародне нормалізоване співвідношення), оскільки існує ризик розвитку більш тяжких кровотеч.

Пероральні протидіабетичні препарати, інсулін.

Можливе більш значне зниження рівня цукру в крові та розвиток гіпоглікемічних реакцій. Необхідно контролювати рівень цукру в крові через проміжки часу, які встановлюються для кожного пацієнта індивідуально.

Теофілін.

Концентрація теофіліну в крові може підвищуватися, і, як наслідок, можливе загострення побічних ефектів під час лікування захворювань дихального тракту.

Циметидин.

Можливе зростання рівня пентоксифіліну в плазмі та посилення дії пентоксифіліну.

Ципрофлоксацин.

Одночасне застосування препарату з ципрофлоксацином може збільшувати концентрацію пентоксифіліну в сироватці крові в окремих пацієнтів. У зв’язку з цим може зростати частота та вираженість побічних реакцій, пов’язаних з одночасним застосуванням цих препаратів.

Потенціальний адитивний ефект з інгібіторами агрегації тромбоцитів: через підвищений ризик виникнення кровотечі одночасне застосування інгібіторів агрегації тромбоцитів (наприклад, клопідогрелю, ептифібатиду, тирофібану, епопростенолу, ілопросту, абциксимабу, анагреліду, НПЗП (нестеро́їдні протизапальні препарати) , крім селективних інгібіторів ЦОГ-2, ацетилсаліцилатів [АСК/ЛАС], тиклопідин, дипіридамол) з пентоксифіліном слід

проводити з обережністю.

При одночасному застосуванні з *антиадренергічними* препаратами та гангліоблокаторами може спостерігатися значне зниження артеріального тиску. Одночасне застосування адренергічних речовин і ксантинів призводить до стимуляції центральної нервової системи.

Особливості щодо застосування

При перших ознаках розвитку анафілактичної/анафілактоїдної реакції лікування препаратом Вазоніт слід припинити та звернутися за допомогою до лікаря.

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

У хворих, які страждають на цукровий діабет і отримують лікування інсуліном або пероральними антидіабетичними засобами, при застосуванні високих доз препарату Вазоніт 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 з іншими захворюванням сполучної тканини пентоксифілін можна призначати тільки після ґрунтовного аналізу можливих ризиків і користі.

Оскільки під час лікування пентоксифіліном існує ризик розвитку апластичної анемії, потрібно регулярно проводити 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 із тяжкими серцевими аритміями;
- пацієнтів з інфарктом міокарда;
- пацієнтів з артеріальною гіпотензією;
- пацієнтів із 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.
- пацієнтів із нирковою недостатністю (кліренс креатиніну нижче 30 мл/хв);
- пацієнтів із тяжкою печінковою недостатністю;

- пацієнтів із високою схильністю до кровотеч, зумовленою, наприклад, лікуванням антикоагулянтами або порушеннями згортання крові. Щодо кровотеч – див. розділ «Протипоказання»;
- пацієнтів, які нещодавно перенесли оперативне лікування (підвищений ризик виникнення кровотечі, у зв’язку з чим потрібен систематичний контроль рівня гемоглобіну та гематокриту);
- пацієнтів, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та антивітамінами К або інгібіторами агрегації тромбоцитів (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- пацієнтів, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та протидіабетичними препаратами (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»);
- пацієнтів, які одночасно отримують лікування пентоксифіліном та ципрофлоксацином (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).
- пацієнтів, 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

Досвіду застосування препарату вагітним жінкам недостатньо . Через це рекомендується не застосовувати препарат Вазоніт у період вагітності.

Годування груддю

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

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

Не впливає.

Спосіб застосування та дози

Дозування визначає лікар індивідуально, залежно від характеру та перебігу захворювання.

Хронічне оклюзійне захворювання периферичних артерій на стадії IIb за Фонтеном (переміжна кульгавість).

Якщо не призначено інше дозування, застосовують по 1 таблетці 600 мг 1-2 рази на добу (600-1200 мг пентоксифіліну на добу).

Для пацієнтів з низьким або нестабільним рівнем артеріального тиску необхідна корекція дози.

Дозування для пацієнтів з нирковою недостатністю (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв) слід підбирати, враховуючи індивідуальну переносимість.

Для пацієнтів з тяжкими порушеннями функцій печінки потрібне зниження дози. Рішення про зниження дози приймає лікар, який в кожному окремому випадку повинен враховувати ступінь тяжкості хвороби і переносимість препарату.

Дисфункція внутрішнього вуха, спричинена розладами кровообігу (включаючи туговухість і раптову втрату слуху).

Якщо не призначено інше дозування, застосовують по 1 таблетці 600 мг один-два рази на добу (600-1200 мг пентоксифіліну на добу).

У випадках тяжких розладів кровообігу початок дії можна прискорити, призначивши таблетки у комбінації з парентеральним введенням пентоксифіліну. Загальна добова доза (парентерально + перорально) не повинна перевищувати 1200 мг пентоксифіліну.

Залежно від тяжкості симптомів можливе лікування або тільки пероральне, або комбіноване пероральне і парентеральне (внутрішньовенна інфузія), або тільки парентеральне (внутрішньовенна інфузія).

Для пацієнтів з низьким або нестабільним рівнем артеріального тиску може бути необхідна корекція дози.

Пацієнтам з нирковою недостатністю (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв) дози слід титрувати до 50-70 % від стандартної дози, з урахуванням індивідуальної переносимості.

Рішення про зниження дози пацієнтам з тяжкими порушеннями функцій печінки повинен прийняти лікар, враховуючи тяжкість хвороби та переносимість препарату в кожного окремого пацієнта.

Спосіб та тривалість застосування.

Таблетку слід ковтати цілою (не розжовуючи), запиваючи достатньою кількістю води. Тривалість застосування повинен встановлювати лікар залежно від клінічного стану кожного окремого хворого.

Примітка.

У разі прискореного проходження по шлунково-кишковому тракту (прийом проносних засобів, діарея, хірургічне вкорочення кишечнику) в окремих випадках з організму виводяться нерозчинені залишки таблетки. Якщо передчасне виведення відбувається лише час від часу, не слід приділяти цьому велику увагу.

Діти.

Через відсутність достатнього клінічного досвіду Вазоніт не можна призначати дітям (до 18 років).

Передозування

Симптоми. Запаморочення, нудота, зниження артеріального тиску, тахікардія, припливи, непритомність, підвищення температури, збудження, арефлексія, тонічно-клонічні судоми, аритмії, блювотні маси у вигляді кавової гущі як ознака шлунково-кишкової кровотечі, арефлексії та тоніко-клонічних судом.

Лікувальні заходи. Якщо передозування відбулося недавно, можна провести промивання шлунка або застосувати активоване вугілля, щоб перешкодити подальшій абсорбції.

Лікування має бути симптоматичним, оскільки специфічний антидот невідомий. Може бути необхідне спостереження у відділенні інтенсивної терапії, щоб запобігти ускладненням.

Невідкладні заходи у разі виникнення тяжких реакцій підвищеної чутливості (шоку). При перших ознаках тяжких реакцій (наприклад, шкірні реакції (кропив’янка), припливи, неспокій, головний біль, раптове спітніння, нудота) слід встановити венозний катетер. Разом зі звичайними заходами невідкладної допомоги, такими як розміщення хворого у лежачому положенні з піднятими ногами, забезпечення прохідності дихальних шляхів і введення кисню, показане екстренне медикаментозне лікування, зокрема внутрішньовенне заміщення об’єму рідини, епінефрин (адреналін) внутрішньовенно, глюкокортикоїди (наприклад, 250-1000 мг метилпреднізолону внутрішньовенно) і антагоністи гістамінових рецепторів.

Залежно від тяжкості клінічних симптомів може бути необхідне штучне дихання, а у разі зупинки кровообігу – відновлення життєвих функцій відповідно до звичайних рекомендацій.

Побічні ефекти

Нижче наведені побічні реакції, що виникали під час клінічних досліджень та у постмаркетинговий період. Частота виникнення невідома.

Системи органів	Побічні реакції
Лабораторні показники	Підвищення рівнів печінкових ферментів (трансаміна фосфатаза)
Порушення серцевої функції	Аритмія, тахікардія, стенокардія, зниження артеріаль підвищення артеріального тиску
Порушення функції кровотворної та лімфатичної системи	Тромбоцитопенія з тромбоцитопенічною пурпурою та анемія (часткове або повне припинення утворення во панцитопенія), що може мати летальний наслідок, лейкопенія/нейтропенія
Розлади нервової системи	Запаморочення, головний біль, асептичний менінгіт, парестезія, судоми, внутрішньочерепні крововиливи
Порушення функції шлунково-кишкового тракту	Шлунково-кишкові розлади, відчуття тиску у шлунку, нудота, блювання, діарея, запор, гіперсалівація , кров шлунково-кишечному тракті
Реакції з боку шкіри та підшкірних тканин	Свербіж, почервоніння шкіри і кропив’янка, токсичні епідермальний некроліз і синдром Стівенса-Джонсона кровотечі шкіри та слизової оболонки
Порушення з боку судин	Відчуття жару (припливи), кровотечі, периферичні на
Реакції з боку імунної системи	Анафілактичні реакції, анафілактоїдні реакції, ангіоне набряк, бронхоспазм та анафілактичний шок
Порушення з боку печінки і жовчовивідних шляхів	Внутрішньопечінковий холестаз
Психічні розлади	Збудження, порушення сну, галюцинації
Порушення з боку органів зору	Порушення зору, кон’юнктивіт, крововиливи у сітківк сітківки
Інші	Гіпоглікемія, підвищена пітливість, підвищення темп

Термін придатності

5 років.

Умови зберігання

Зберігати у сухому, захищеному від світла і недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °C.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері, по 2 блістери в коробці.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

Г.Л. Фарма ГмбХ/G.L. Pharma GmbH.