

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ВИНПОЦЕТИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Винпоцетин

Международное непатентованное наименование: винпоцетин

Лекарственная форма: таблетки

Состав

Одна таблетка содержит:

Действующее вещество: винпоцетин — 5 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки, белого или белого с желтоватым оттенком цвета, с риской и фаской.

Линия разлома (риска) предназначена исключительно для разламывания с целью облегчения проглатывания, а не для деления на равные дозы.

Фармакотерапевтическая группа: психоаналептики; психостимуляторы, средства, применяемые при синдроме дефицита внимания с гиперактивностью, и ноотропные средства; другие психостимуляторы и ноотропные средства.

Код АТХ: N06BX18

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Механизм действия винпоцетина складывается из нескольких элементов: он улучшает мозговой кровоток и метаболизм головного мозга, оказывает благоприятное воздействие на реологические свойства крови.

Нейропротективное действие реализуется за счет снижения неблагоприятного цитотоксического влияния возбуждающих аминокислот. Блокирует потенциалзависимые Na^+ и Ca^{2+} каналы и NMDA и AMPA-рецепторы. Повышает нейропротективное действие аденозина. Винпоцетин стимулирует метаболизм головного мозга: он увеличивает захват и потребление глюкозы и кислорода. Повышает толерантность к гипоксии; увеличивает транспорт глюкозы, единственного источника энергии для ткани головного мозга, через гематоэнцефалический барьер; смещает метаболизм глюкозы в сторону энергетически

более выгодного аэробного пути. Селективно ингибирует Ca^{2+} -кальмодулинзависимую цГМФ-фосфодиэстеразу; повышает содержание циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) и циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) головного мозга, концентрацию аденозинтрифосфата (АТФ) и соотношение АТФ/АМФ в тканях головного мозга; усиливает обмен серотонина и норадреналина в головном мозге, стимулирует норадренергическую нейромедиаторную систему, а также оказывает антиоксидантное действие; в результате всех этих эффектов винпоцетин оказывает церебропротективное действие.

Уменьшает микроциркуляцию в головном мозге за счет ингибирования агрегации тромбоцитов, снижения патологически повышенной вязкости крови, повышения способности эритроцитов к деформации и ингибирования захвата аденозина; способствует переходу кислорода в клетки за счет снижения к нему сродства эритроцитов. Избирательно увеличивает мозговой кровоток за счет увеличения мозговой фракции сердечного выброса, снижения церебрального сосудистого сопротивления без существенного влияния на системные показатели кровообращения (артериальное давление (АД), сердечный выброс, частоту сердечных сокращений, общее периферическое сосудистое сопротивление); не вызывает эффект «обкрадывания». На фоне применения винпоцетина улучшается кровоснабжение поврежденных (но еще не некротизированных) участков ишемии с низкой перфузией («обратный эффект обкрадывания»).

Фармакокинетика

Всасывание

Винпоцетин быстро всасывается, после приема внутрь и через 1 ч достигает максимальной концентрации в крови ($C_{\max}$). Всасывание происходит главным образом в проксимальных отделах кишечника. Не подвергается метаболизму при прохождении через стенку кишечника.

Распределение

В доклинических исследованиях введения радиоактивно меченого винпоцетина внутрь он определялся в наивысших концентрациях в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечалась через 2–4 ч после приема внутрь. Количество радиоактивного изотопа в головном мозге не превышало такового в крови. Связь с белками в организме человека — 66 %. Объем распределения составляет $246,7 \pm 88,5$ л, что свидетельствует о значительном связывании с тканями. Биодоступность при приеме внутрь — 7 %. Клиренс составляет 66,7 %, что превышает плазменный объем печени (50 л/ч), метаболизм преимущественно внепеченочный.

Метаболизм

Основным метаболитом является аповинкаминовая кислота (АВК), доля которой у человека составляет 25–30 %. После приема винпоцетина внутрь площадь под кривой «концентрация–время» АВК в 2 раза больше таковой после внутривенного введения. Это свидетельствует о том, что АВК образуется в процессе метаболизма первого прохождения винпоцетина. Другими известными метаболитами являются гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, дигидрокси-АВК-глицинат, а также их конъюгаты с глюкуронидами и/или сульфатами. В доклинических исследованиях выявлено, что в неизменном виде винпоцетин выделяется в небольшом количестве.

При заболеваниях печени и почек коррекции дозы не требуется в связи с особенностью метаболизма винпоцетина — отсутствием кумуляции.

Выведение

При многократном приеме в дозе 5 и 10 мг кинетика винпоцетина линейная. Равновесные концентрации составляли $1,2 \pm 0,27$ нг/мл и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл соответственно. Период полувыведения у человека — $4,83 \pm 1,29$ ч. В исследованиях с радиоактивной меткой препарат выводился почками и через кишечник в пропорции 60 : 40. В доклинических исследованиях значительная часть радиоактивности выявлялась в желчи, но значимая кишечно-печеночная циркуляция не найдена. АВК выводится почками путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от принятой дозы и пути введения винпоцетина.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Пациенты пожилого возраста, пациенты с нарушением функции печени и почек

Выявлено, что фармакокинетика винпоцетина у пожилых пациентов значимо не отличается от таковой у молодых пациентов, кумуляция препарата отсутствует. Поэтому винпоцетин можно назначать пациентам с нарушениями функции печени и почек длительно и в обычных дозах.

Показания к применению

Неврология: симптоматическая терапия последствий ишемического инсульта, вертебробазилярной недостаточности, сосудистой деменции, атеросклероза сосудов головного мозга, посттравматической, гипертонической энцефалопатии. Для уменьшения выраженности неврологических и психических нарушений, связанных с нарушениями кровоснабжения головного мозга.

Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сетчатки и сосудистой оболочки глаза.

Отология: снижение слуха перцептивного типа, болезнь Меньера, ощущение шума в

ушах.

Противопоказания

- гиперчувствительность к винпоцетину или другим компонентам препарата;
- острая фаза геморрагического инсульта, тяжелая форма ишемической болезни сердца, тяжелые нарушения ритма сердца;
- беременность, период кормления грудью и применение у женщин с сохраненной детородной функцией, не использующих надежный метод контрацепции;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

С осторожностью

Синдром удлинённого интервала QT, прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Во время беременности и в период грудного вскармливания, а также у женщин с сохраненной детородной функцией, не использующих надежный метод контрацепции, применение винпоцетина противопоказано.

Беременность

Винпоцетин проникает через плацентарный барьер, но в плаценте и в крови плода его концентрация ниже, чем в крови беременной. Исследования на животных показали репродуктивную токсичность, включая пороки развития у крыс. В исследованиях на животных при введении больших доз возникали плацентарные кровотечения и спонтанные аборт, вероятно, в результате усиления плацентарного кровотока. Во время беременности применение винпоцетина противопоказано.

Период грудного вскармливания

Винпоцетин проникает в грудное молоко. В исследованиях с применением меченого винпоцетина радиоактивность грудного молока была в 10 раз выше, чем в крови матери. В течение 1 ч в грудное молоко проникает 0,25 % принятой дозы препарата. Поскольку винпоцетин проникает в грудное молоко, а данные о влиянии винпоцетина на детей грудного возраста отсутствуют, применение его во время грудного вскармливания противопоказано.

Женщины с детородным потенциалом

Женщины с сохраненной детородной функцией должны использовать надежный метод контрацепции во время применения винпоцетина. В противном случае прием винпоцетина противопоказан.

Способ применения и дозы

Внутрь, после еды.

Обычно суточная доза составляет 15–30 мг (по 5–10 мг 3 раза в день).

Начальная суточная доза составляет 15 мг. Максимальная суточная доза — 30 мг.

Пациенты с нарушением функции почек и печени

При заболеваниях почек и печени препарат назначают в обычной дозе, отсутствие кумуляции позволяет проводить длительные курсы лечения.

Дети

Безопасность и эффективность винпоцетина у детей от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Побочное действие

В ходе клинических исследований наиболее часто нежелательные реакции возникали в следующих системно-органных классах, которые приведены в соответствии с частотой возникновения: нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко — лейкопения, тромбоцитопения; очень редко — анемия, агглютинация эритроцитов.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко — реакции гиперчувствительности.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: нечасто — гиперхолестеринемия; редко — снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет.

Нарушения психики: редко — бессонница, нарушение сна, беспокойство; очень редко — эйфория, депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто — головная боль; редко — головокружение, расстройство вкуса, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия; очень редко — тремор, спазмы.

Нарушения со стороны органа зрения: редко — отек соска зрительного нерва; очень редко — гиперемия конъюнктивы.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто — вертиго; редко — гиперакузия, гипоакузия, шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: редко — ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения; очень редко — аритмия, фибрилляция предсердий.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто — снижение АД; редко — повышение АД, «приливы», тромбофлебит; очень редко — лабильность АД.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто — дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота; редко — боль в эпигастрии, запор, диарея, диспепсия, рвота; очень редко — дисфагия, стоматит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко — эритема, гипергидроз, кожный зуд, крапивница, сыпь; очень редко — дерматит.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: редко — астения, недомогание, чувство жара; очень редко — чувство дискомфорта в грудной клетке, гипотермия.

Лабораторные и инструментальные данные: нечасто — снижение АД; редко — повышение АД, гипертриглицеридемия, уменьшение/увеличение эозинофилов, повышение активности «печеночных» ферментов; очень редко — уменьшение/увеличение числа лейкоцитов, эритропения, уменьшение тромбинового времени, повышение массы тела.

Передозировка

Данные о передозировке винпоцетином отсутствуют.

Симптомы

Однократный прием 360 мг винпоцетина не вызывал клинически значимых реакций, в том числе со стороны сердечно-сосудистой системы.

Лечение

Рекомендовано промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Взаимодействие не наблюдается при одновременном применении с бета-адреноблокаторами (хлоранолол, пиндолол), клопамидом, глибенкламидом, дигоксином, аценокумаролом, гидрохлоротиазидом и имипрамином.

Одновременное применение винпоцетина и альфа-метилдопы иногда вызывало некоторое усиление гипотензивного эффекта, поэтому при таком лечении требуется регулярный контроль АД.

Несмотря на отсутствие данных, подтверждающих возможность взаимодействия, рекомендуется проявлять осторожность при одновременном назначении с препаратами, действующими на центральную нервную систему и с препаратами противоаритмического и антикоагулянтного действия.

Особые указания

Наличие синдрома удлиненного интервала QT, прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля электрокардиограммы (ЭКГ).

Лактоза

Если у Вас непереносимость некоторых сахаров, обратитесь к лечащему врачу перед приемом данного лекарственного препарата.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Данные о влиянии винпоцетина на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами отсутствуют.

Форма выпуска

Таблетки, 5 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 2, 3, 5 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению лекарственного препарата в пачке из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

При уничтожении неиспользованных упаковок препарата специальных мер предосторожностей не требуется.

Владелец регистрационного удостоверения:

АО «Фармпроект», Россия,

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

Телефон: +7 (812) 331 93 10

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей:

АО «Фармпроект», Россия,

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

Телефон: +7 (812) 331 93 10