

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ВИНПОЦЕТИН

Регистрационный номер:

Торговое название: Винпоцетин

Международное непатентованное название: винпоцетин

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку.

Активное вещество:

Винпоцетин - 5 мг

Вспомогательные вещества:

сахароза - 25 мг

лактозы моногидрат (сахар молочный) - 127 мг

повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский 12600±2700 или К-17) - 5 мг

кальция стеарат - 2,5 мг

крахмал картофельный - 85,5 мг

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

Фармакотерапевтическая группа: психостимулирующее и ноотропное средство.

Код АТХ: [N06BX18].

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

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

Нейропротекторное действие реализуется за счет снижения неблагоприятного цитотоксического влияния возбуждающих аминокислот. Блокирует Na^+ - и Ca^{2+} -каналы и NMDA- и AMPA-рецепторы. Селективно ингибирует Ca^{2+} -кальмодулинзависимую-цГМФ-фосфодиэстеразу. Повышает обмен серотонина и норадреналина в головном мозге, стимулирует норадренергическую нейромедиаторную систему и оказывает антиоксидантное действие.

Улучшает микроциркуляцию в головном мозге за счет ингибирования агрегации тромбоцитов, снижения патологически повышенной вязкости крови, увеличения деформируемости эритроцитов и ингибирования обратного захвата аденозина; способствует переходу

кислорода в клетки за счет снижения сродства к нему эритроцитов.

Избирательно увеличивает мозговой кровоток за счет 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».

Фармакокинетика

Распределение радиоактивно меченого винпоцетина, при введении крысам, наибольшая концентрация обнаруживалась в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечалась через 2 - 4 ч после введения. Концентрация в головном мозге не превышала значений, обнаруженных в крови.

У человека связь с белками плазмы составляет 66 %. Биодоступность около 7 %, объем распределения $246,7 \pm 88,5$ л, что свидетельствует о высоком связывании с тканями. Общий клиренс ($66,7$ л/ч) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/ч), что указывает на внепеченочный метаболизм.

Метаболизм

Основным метаболитом является аповинкаминовая кислота (АВК), составляющая 25-30 % от исходного соединения. Площадь под кривой «концентрация-время» АВК после приема внутрь вдвое превышает таковую при внутривенном введении винпоцетина. Таким образом, винпоцетин подвержен выраженному эффекту «первого прохождения» через печень. К прочим метаболитам относятся: гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, АВК-диоксиглицинат и их конъюгаты (сульфаты и (или) глюкурониды). Выведение неизмененного винпоцетина низкое (несколько процентов).

При нарушении функции печени или почек коррекция дозы не требуется, поскольку винпоцетин не кумулирует.

Выведение

При многократном введении в дозе 5 и 10 мг винпоцетин проявляет линейную фармакокинетику, равновесная плазменная концентрация составляет $1,2 \pm 0,27$ и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл соответственно. Период полувыведения у человека составляет $4,83 \pm 1,29$ ч. В исследованиях с радиоактивно меченым винпоцетином установлено, что выведение почками и кишечником происходит в соотношении 60:40 %.

У крыс и собак высокая концентрация обнаруживается в желчи, однако отмечена значительная энтерогепатическая рециркуляция.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Поскольку винпоцетин предназначен в первую очередь для лечения пожилых, необходимо учитывать замедление распределения и метаболизма, а также выведения у этой возрастной группы, особенно при длительном применении. По результатам клинических исследований установлено, что кинетика винпоцетина у пожилых существенно не отличается от молодых, кумуляции не происходит. При нарушениях функции печени и почек кумуляция не отмечается, что позволяет проводить длительную терапию.

Показания к применению

Неврология: симптоматическая терапия последствий ишемического инсульта, сосудистой вертебробазилярной недостаточности, сосудистой деменции, атеросклероза сосудов головного мозга, посттравматической, гипертонической энцефалопатии.

Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сетчатки и сосудистой оболочки глаза.

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

Противопоказания

Острая фаза геморрагического инсульта, тяжелая форма ишемической болезни сердца, тяжелые нарушения ритма сердца. Гиперчувствительность к винпоцетину или другим

компонентам препарата, дефицит сахарозы, изомальтозы, лактозы, наследственная непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Беременность, период кормления грудью.

Детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат во время беременности противопоказан, так как винпоцетин проникает через плацентарный барьер. При этом его концентрация в плаценте и в крови плода ниже, чем в крови беременной. При больших дозах возможно плацентарное кровотечение и спонтанные аборт, вероятно, в результате усиления плацентарного кровоснабжения.

Период грудного вскармливания: в течение часа в грудное молоко проникает 0,25 % принятой дозы препарата. При применении препарата необходимо прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Курс лечения и дозировка определяется лечащим врачом.

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.

Терапевтический эффект развивается приблизительно через неделю с начала приема препарата. Курс лечения 1 -3 месяца.

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

Побочное действие

В клинических исследованиях показано, что нежелательные лекарственные реакции с частотой «часто» (>1/100) не возникали, поэтому эта категория частоты была исключена из приведенной ниже таблицы.

В ходе клинических исследований наиболее часто нежелательные реакции возникали в следующих системно-органных классах (по классификации Медицинского словаря для регуляторной деятельности):

Системно-органный класс (MedDRA)	Нечасто (>1/1000, <1/100)	Редко (>1/10000, <1/1000)	Очень редко (<1/1000)
Со стороны крови и лимфатической системы		Лейкопения, тромбоцитопения	Анемия, Агглютинация эритроцитов
Иммунологические нарушения			Гиперчувствительность
Нарушение метаболизма и питания	Гиперхолестеринемия	Снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет	
Психические расстройства		Бессонница, нарушение сна, беспокойство	Эйфория, депрессия
Со стороны нервной системы	Головная боль	Дисгевзия, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия	Тремор, спазмы
Со стороны органа зрения		Отек соска зрительного нерва	Гиперемия конъюнктивы
Со стороны органа слуха и равновесия	Вертиго	Гиперакузия, гипоакузия, шум в ушах	

Со стороны сердца		Ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения	Аритмия, фибрилляция предсердий
Со стороны сосудов	Артериальная гипотензия	Артериальная гипертензия, приливы, тромбофлебит	Лабильность артериального давления
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота	Боль в эпигастрии, запор, диарея, диспепсия, рвота	Дисфагия, стоматит
Со стороны кожи и подкожных тканей		Эритема, гипергидроз, зуд, крапивница, сыпь	Дерматит
Общие расстройства и расстройства в месте введения		Астения, недомогание, чувство жжения	Дискомфорт в грудной клетке, гипотермия
Лабораторные и инструментальные нарушения	Снижение артериального давления	Повышение артериального давления, гипертриглицеридемия, депрессия сегмента ST, снижение/повышение количества эозинофилов, нарушение функциональных проб печени	Повышение/снижение количества лейкоцитов, снижение количества эритроцитов, уменьшение тромбинового времени, повышение массы тела

Передозировка

В настоящее время данные о передозировке винпоцетином ограничены.

Лечение при передозировке: промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

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

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

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

Особые указания

Наличие синдрома пролонгированного интервала QT и прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля электрокардиограммы.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Принимая во внимание возможные побочные эффекты со стороны нервной системы, на период лечения следует воздержаться от управления автотранспортом и от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации

внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки 5 мг.

По 10, 15, 20 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

По 20, 30, 50, 60, 90, 100 таблеток в банке полимерной с крышкой из полиэтилена или пропилена.

По 1 банке или по 2, 3, 5, 6, 9, 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или по 2, 4, 6 контурных ячейковых упаковок по 15 таблеток или по 3, 5 контурных ячейковых упаковок по 20 таблеток вместе с инструкцией по применению препарата в пачке из картона.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

ПАО «Биосинтез», Россия, 440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4.

Юридический адрес и адрес для принятия претензий

ПАО «Биосинтез», Россия, 440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4. телефон/факс (8412) 57-72-49.

Генеральный директор
ПАО «Биосинтез»

Болдов Д.В.