

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Винпоцетин

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер: P N000182/01

Торговое наименование: Винпоцетин

Международное непатентованное название: винпоцетин

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

Одна таблетка содержит:

активное вещество: винпоцетин - 5,0 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 180,0 мг, целлюлоза микрокристаллическая (вивапур 102) - 25,0 мг, крахмал картофельный - 32,5 мг, магния стеарат - 2,5 мг, тальк - 5,0 мг.

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

Фармакотерапевтическая группа: психостимулирующее и ноотропное средство.

Код АТХ: N06BX18

Фармакологические свойства

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 Ca²⁺-каналы и NMDA- и AMPA-рецепторы. Селективно ингибирует Ca²⁺-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

Всасывание

После приема внутрь быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. Время достижения максимальной концентрации (Т_{Сmax}) в плазме крови 1 ч. Всасывание происходит главным образом в проксимальных отделах желудочно-кишечного тракта. При прохождении через стенку кишечника не подвергается метаболизму.

Распределение

Распределение радиоактивно меченого винпоцетина, при введении крысам, наибольшая радиоактивность 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» АВА 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

Гиперчувствительность к винпоцетину или другим компонентам препарата; острая фаза геморрагического инсульта, тяжелая форма ишемической болезни сердца, тяжелые нарушения ритма сердца; беременность, период кормления грудью, детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований); непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в связи с наличием лактозы в составе препарата).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

Беременность:

Винпоцетин проникает через плаценту, но плазменная концентрация в плаценте и у плода ниже, чем у матери. Тератогенное и эмбриотоксическое действие не выявлено. В исследованиях на животных при введении высоких доз возникли плацентарные кровотечения и спонтанные аборт (предположительно вследствие увеличения плацентарного кровотока).

Период грудного вскармливания:

Винпоцетин проникает в грудное молоко. Согласно доклиническим исследованиям с радиоактивно меченым вилоцетином его концентрация в грудном молоке животных превышала таковую в крови матери в 10 раз. В течение часа в грудное молоко проникает 0,25% принятой дозы препарата. При решении об отмене грудного вскармливания или отказа от лечения винпоцетином следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии винпоцетином для женщины.

Способ применения и дозы

Внутрь, после приема пищи. Стандартная доза составляет 5-10 мг 3 раза в сутки (15-30 мг/сут). Продолжительность курса лечения - до 3-х месяцев (курс лечения и дозировка определяются лечащим врачом). Возможны повторные курсы 2-3 раза в год. Перед отменой препарата следует постепенно снижать дозу. Коррекция дозы при нарушениях функции почек или печени не требуется.

Побочное действие

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

Частота побочных эффектов представлена в следующей градации: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$) и очень редко ($< 1/10000$).

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

Со стороны крови и лимфатической системы: редко - лейкопения, тромбоцитопения; очень редко - анемия, агглютинация эритроцитов.

Иммунологические нарушения: очень редко - гиперчувствительность.

Нарушение метаболизма и питания: нечасто - гиперхолестеринемия; редко - снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет.

Психические расстройства: редко - бессонница, нарушение сна, беспокойство; очень редко - эйфория, депрессия.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль; редко - дисгевзия, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия; очень редко - тремор, спазмы.

Со стороны органа зрения: редко - отек соска зрительного нерва; очень редко - гиперемия конъюнктивы.

Со стороны органа слуха и равновесия: нечасто - вертиго; редко - гиперакузия, гипобакузия, шум в ушах.

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

Со стороны сосудов: нечасто - снижение АД; редко - повышение АД, приливы, тромбофлебит; очень редко - лабильность АД.

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.

Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - эритема, гипергидроз, зуд, крапивница, сыпь; очень редко - дерматит.

Общие расстройства и расстройства в месте введения: редко - астения, недомогание; очень редко - дискомфорт в грудной клетке, гипотермия.

Инструментальные и лабораторные данные: нечасто - снижение АД; редко - повышение АД, гипертриглицеридемия, депрессия сегмента ST, эозинопения/эозинофилия, нарушение функциональных проб печени; очень редко - лейкопения (лейкоцитов), эритропения, уменьшение тромбинового времени, повышение массы тела.

Передозировка

Случаи передозировки не зарегистрированы. По данным литературы применение 60 мг винпоцетина в сутки безопасно. Однократный пероральный прием винпоцетина в дозе 360 мг не вызывает клинически значимых сердечно-сосудистых и прочих реакций.

Симптомы: усиление степени выраженности дозозависимых побочных реакций.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля и симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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

Одновременное применение винпоцетина и α -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 применении с препаратами центрального, противоаритмического и антикоагулянтного действия.

Особые указания

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

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

Исследования о влиянии на способность управлять транспортными средствами не проводились. При возникновении нежелательных реакций со стороны нервной системы следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе с механизмами.

Форма выпуска

Таблетки 5 мг.

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

По 1, 2, 3 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона. Пачки помещают в групповую упаковку.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре от 2 до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение/Организация, принимающая претензии по качеству лекарственного препарата

ОАО «Мосхимфармпрепараты» им. Н.А. Семашко»

115172, г. Москва, ул. Б. Каменщики, д. 9

тел./факс: (495) 912-71-61

Производитель

АО «Усолъе-Сибирский химфармзавод»

Россия, 665462, Иркутская область, г.Усолъе-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги.

тел./факс: (39543) 5-89-10, 5-89-08.