

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Винпоцетин

Регистрационный номер: ЛП-002441

Торговое наименование: Винпоцетин

Международное непатентованное наименование: винпоцетин

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка 5 мг содержит:

Действующее вещество: винпоцетин – 5,00 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая – 89,00 мг; крахмал кукурузный прежелатинизированный – 30,00 мг; кремния диоксид коллоидный – 0,30 мг; магния стеарат – 0,70 мг.

1 таблетка 10 мг содержит:

Действующее вещество: винпоцетин – 10,00 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая – 178,00 мг; крахмал кукурузный прежелатинизированный – 60,00 мг; кремния диоксид коллоидный – 0,60 мг; магния стеарат – 1,40 мг.

Описание

Таблетки 5 мг

Таблетки круглой, двояковыпуклой формы, от белого до белого с желтоватым оттенком цвета.

Таблетки 10 мг

Таблетки круглой, двояковыпуклой формы, от белого до белого с желтоватым оттенком цвета, с риской на одной стороне.

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 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

Всасывание

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

Распределение

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

У человека связь с белками плазмы составляет 66 %, биодоступность при приеме внутрь – 7 %. Объем распределения 246,7-88,5 л, что свидетельствует о высоком связывании с тканями. Общий клиренс (66,7 л/ч) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/ч), что свидетельствует о внепеченочном метаболизме.

Метаболизм

Основным метаболитом является аповинкаминат (АВА), составляющий 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 «первичного прохождения» через печень. К прочим метаболитам относятся: гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВА, АВА-диоксиглицинат и их конъюгаты (сульфаты и/или глюкурониды). При нарушении функции печени или почек коррекция дозы не требуется, поскольку винпоцетин не кумулирует.

Выведение

Выведение неизменного винпоцетина низкое (несколько процентов). При многократном введении в дозах 5 мг и 10 мг кинетика носит линейный характер, равновесная плазменная концентрация составляет $1,2 \pm 0,27$ и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл, соответственно. Период полувыведения у человека $4,8 \pm 1,29$ ч. Выводится почками и через кишечник в соотношении 60:40. У крыс и собак высокая радиоактивность при введении радиоактивно меченого винпоцетина обнаруживается в желчи, однако отмечена значительная энтерогепатическая рециркуляция.

Особые группы пациентов

Поскольку винпоцетин предназначен в первую очередь для лечения пожилых, необходимо учитывать снижение абсорбции и распределения, а также выведения у этой возрастной группы, особенно при длительном применении. Однако по результатам клинических исследований установлено, что кинетика винпоцетина у пожилых существенно не отличается от молодых, кумуляции не происходит. При нарушениях функции печени и почек кумуляции не отмечается, что позволяет проводить длительную терапию. Винпоцетин проникает через плаценту и выделяется в грудное молоко.

Показания к применению

Неврология: симптоматическая терапия последствий ишемического инсульта, сосудистой вертебробазиллярной 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, шум в ушах.

Во избежание осложнений применять строго по назначению врача.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к винпоцетину или другим компонентам препарата;
- острая фаза геморрагического инсульта;
- тяжелая форма ишемической болезни сердца;
- беременность;
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

С осторожностью

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

При тяжелых нарушениях ритма сердца, повышении внутричерепного давления, приеме антиаритмических препаратов, синдроме удлинённого QT или одновременном применении препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, винпоцетин применять с осторожностью.

Применение при беременности и грудном вскармливании

Применение во время беременности противопоказано и в период грудного вскармливания противопоказано.

Беременность

Винпоцетин проникает через плаценту, при этом концентрация винпоцетина в плаценте и в крови плода ниже, чем в крови беременной. Тератогенное и эмбриотоксическое действие не выявлено. В исследованиях на животных при введении больших доз возникали плацентарные кровотечения и спонтанные аборт, предположительно, в результате усиления плацентарного кровотока.

Период грудного вскармливания

Согласно доклиническим исследованиям с радиоактивно меченым винпоцетином концентрация в грудном молоке новорожденных 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. 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 винпоцетина. Курс лечения 1-3 месяца.

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

Побочное действие

Для определения частоты возникновения побочных эффектов препарата применяют следующую классификацию:

Очень часто ($\geq 1/10$)

Часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$)

Нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$)

Редко ($\geq 1/10\ 000$ и $< 1/1000$)

Очень редко ($\geq 1/10\ 000$).

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

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – гиперчувствительность.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: нечасто – гиперхолестеринемия; редко – снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет; очень редко – повышение массы тела.

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

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль; редко – дисгевзия, 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», тромбоз; 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, зуд, крапивница, сыпь; очень редко – дерматит.

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

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований: нечасто – снижение АД; редко – повышение АД, гипертриглицеридемия, депрессия сегмента ST, снижение/повышение количества эозинофилов, нарушение функциональных проб печени; очень редко – повышение/снижение количества лейкоцитов, снижение количества эритроцитов, уменьшение протромбинового времени.

Передозировка

Симптомы

Случаи передозировки не зарегистрированы.

Лечение

Промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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

гидрохлоротиазидом.

Метилдопа может усиливать гипотензивное действие винпоцетина, поэтому при их одновременном применении требуется систематический контроль АД.

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

Особые указания

При наличии синдрома пролонгированного интервала QT или одновременном приеме препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требуется периодический контроль ЭКГ. При тяжелых нарушениях ритма сердца, повышении внутричерепного давления, приеме антиаритмических препаратов, синдроме удлиненного QT или одновременном применении препаратов, вызывающих удлинение интервала QT препарат применять с осторожностью.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки 5 мг, 10 мг. По 10 или 15 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 3, 5 или 9 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или по 2, 4 или 6 контурных ячейковых упаковок по 15 таблеток вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона коробочного.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «Изварино Фарма», Россия

108817, г. Москва, поселение Внуковское, Внуковское шоссе 5-й км, домовладение 1, стр. 1.

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Изварино Фарма», Россия

108817, г. Москва, поселение Внуковское, Внуковское шоссе 5-й км, домовладение 1, стр. 1.

Тел.: +7 (495) 232-56-55

Факс: +7 (495) 232-56-54