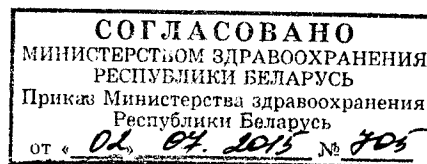


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ



ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

Винпоцетин

Торговое название: Винпоцетин.

Международное непатентованное название: Винпоцетин/Vinprocetine.

Форма выпуска: таблетки 5 мг.

Состав: 1 таблетка содержит: *действующего вещества* - винпоцетина 5 мг; *вспомогательные вещества* – крахмал картофельный, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, тальк, повидон.

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

Фармакотерапевтическая группа: прочие психостимуляторы и ноотропы.

Код АТХ: N06BX18.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Винпоцетин оказывает влияние на метаболизм, кровообращение головного мозга, реологические свойства крови.

Винпоцетин проявляет нейропротективные эффекты: ослабляет вредное воздействие цитотоксических реакций, вызванных стимулирующими аминокислотами. Винпоцетин ингибирует потенциал-зависимые Na^+ - и Ca^{2+} -каналы, а также рецепторы NMDA и AMPA, усиливает нейропротективный эффект аденозина.

Винпоцетин стимулирует церебральный метаболизм: ~~увеличивает~~ захват глюкозы и O_2 и потребление этих веществ тканью головного мозга. Винпоцетин повышает устойчивость головного мозга к гипоксии; увеличивает транспорт глюкозы - исключительного источника энергии для головного мозга - через гематоэнцефалический барьер; сдвигает метаболизм глюкозы в сторону энергетически более благоприятного аэробного пути; избирательно ингибирует Ca^{2+} кальмодулинзависимый фермент цГМФ-фосфодиэстеразу (ФДЭ); повышает уровень цАМФ и цГМФ в головном мозге. Винпоцетин повышает концентрацию АТФ и соотношение АТФ/АМФ; усиливает обмен норадреналина и серотонина в головном мозге; стимулирует восходящую норадренергическую систему; обладает антиоксидантной активностью.

Винпоцетин улучшает микроциркуляцию в головном мозге: ингибирует агрегацию тромбоцитов; снижает патологически повышенную вязкость крови; повышает деформируемость эритроцитов и ингибирует захват аденозина; улучшает транспорт O_2 в тканях путем снижения аффинитета O_2 к эритроцитам.

Винпоцетин селективно увеличивает кровоток в головном мозге: увеличивает церебральную фракцию сердечного выброса; снижает сопротивление сосудов головного мозга, не оказывая влияния на параметры системной циркуляции (артериальное давление, сердечный выброс, частоту пульса, общее периферическое сопротивление); препарат не вызывает «эффекта обкрадывания». Более того, на фоне винпоцетина улучшается поступление крови в поврежденные (но еще не некротизированные) участки ишемии с низкой перфузией («обратный эффект обкрадывания»).

Фармакокинетика

Всасывание: Винпоцетин быстро всасывается; максимальная концентрация в плазме достигается через 1 час после перорального применения. Основным местом всасывания винпоцетина являются проксимальные отделы желудочно-кишечного тракта. Соединение не подвергается метаболизму в момент прохождения через кишечную стенку.

Распределение: в исследованиях с пероральным введением лекарственного средства у крыс радиоактивно-меченый винпоцетин в наибольшей концентрации обнаруживался в печени и в желудочно-кишечном тракте. Максимальные концентрации в тканях можно было выявить через 2 - 4 часа после применения винпоцетина. Концентрация радиоактивной метки в головном мозге не превышала концентрацию в крови. У человека: связывание с белками крови составляет 66%. Абсолютная биодоступность винпоцетина при пероральном приеме составляет около 7%. Объем распределения равен $246,7 \pm 88,5$ л, что означает выраженное связывание вещества в тканях. Значение клиренса винпоцетина (66,7 л/ч) в плазме превышает его значение в печени (50 л/ч), что указывает на внепеченочный метаболизм соединения.

Выведение: при многократном пероральном применении лекарственного средства в дозе 5 мг и 10 мг винпоцетин демонстрирует линейную кинетику; равновесные концентрации в плазме составляют $1,2 \pm 0,27$ нг/мл и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл, соответственно. Период полувыведения у человека составляет $4,83 \pm 1,29$ часов.

В исследованиях, проведенных с использованием радиоактивно-меченого соединения, было обнаружено, что основной путь выведения осуществляется через почки и кишечник в соотношении 60:40 (%,%). Больше количество радиоактивной метки у крыс и собак обнаруживалось в желчи, но существенной энтерогепатической циркуляции не отмечалось. Аповинкаминовая кислота выделяется через почки путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от дозы и способа применения винпоцетина.

Метаболизм: Основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминовая кислота (АВК), которая у людей образуется в 25 - 30%. После перорального применения площадь под кривой («концентрация в плазме - время») АВК в два раза превышает таковую после внутривенного введения лекарственного средства, что указывает на образование АВК в процессе пресистемного метаболизма винпоцетина. Другими выявленными метаболитами являются гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, дигидрокси-АВК-глицинат и их конъюгаты с глюкуронидами и/или сульфатами. У любого из изученных видов количество винпоцетина, которое выде-

лялось в неизменном виде, составляло только несколько процентов от принятой дозы лекарственного средства.

Важным и значимым свойством винпоцетина является отсутствие необходимости специального подбора дозы препарата у пациентов с заболеваниями печени или почек ввиду метаболизма препарата и отсутствия кумуляции (накопления).

Показания к применению

Неврология: следующие формы церебральной ишемии: состояния после перенесенного острого нарушения мозгового кровообращения, хроническая недостаточность мозгового кровообращения вследствие церебрального атеросклероза или артериальной гипертензии, в том числе вертебробазилярной недостаточности; а также сосудистая деменция, посттравматическая энцефалопатия.

Способствует уменьшению психической и неврологической симптоматики при церебральной ишемии.

Офтальмология: для лечения хронической сосудистой патологии хориоидеи (сосудистой оболочки глаза) и сетчатки.

Оториноларингология: для лечения тугоухости нейросенсорного типа, болезни Меньера и идиопатического шума в ушах.

Противопоказания

- выраженные нарушения сердечного ритма;
- ишемическая болезнь сердца (тяжелого течения);
- острый период внутримозгового кровоизлияния;
- лактазная недостаточность;
- повышенное внутричерепное давление;
- беременность;
- лактация (грудное вскармливание);
- повышенная чувствительность к действующему веществу или другим компонентам лекарственного средства;
- детский возраст до 18 лет.

Способ применения и дозы

Винпоцетин следует назначать по 5 – 10 мг 3 раза/сут в течение 2 мес. Применять после приёма пищи. Длительность курса лечения определяется врачом с учетом особенностей заболевания, достигнутого эффекта и переносимости лекарственного средства.

Перед отменой лекарственного средства следует постепенно снижать дозу. Возможны повторные курсы 2 – 3 раза в год.

Побочное действие

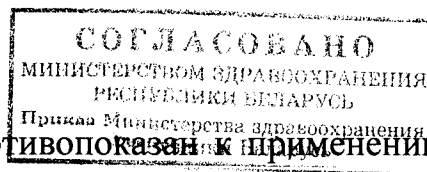
Побочные реакции перечислены ниже с разделением по классам систем органов и с указанием частоты возникновения согласно терминологии MedDRA:

Класс системы органов (MedDRA 12.1)	Нечасто возникающие ($\geq 1/1000$ - $< 1/100$)	Редко возникающие ($\geq 1/10\ 000$ - $< 1/1000$)	Очень редко возникающие ($< 1/10\ 000$)
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы		Лейкопения Тромбоцитопения	Анемия Агглютинация эритроцитов
Нарушения со стороны иммунной системы			Гиперчувствительность
Нарушения метаболизма и питания	Гиперхолестеринемия	Снижение аппетита Анорексия Сахарный диабет	
Психические расстройства		Бессонница Нарушение сна Беспокойство	Эйфория Депрессия
Нарушения со стороны нервной системы	Головная боль	Головокружение Дисгевзия Ступор Гемипарез Сонливость Амнезия	Тремор Судороги
Нарушения со стороны органа зрения		Отек диска зрительного нерва	Гиперемия конъюнктивы
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта	Головокружение	Гиперакузия Гипоакузия Шум в ушах	
Нарушения со стороны сердца		Ишемия/инфаркт миокарда	Аритмия Фибрилляция

		Стенокардия Брадикардия Тахикардия Экстрасистолия Сердцебиение	
Нарушения со стороны сосудистой системы	Гипотензия	Гипертензия Приливы Тромбофлебит	Колебания артериального давления
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	Дискомфорт в животе Сухость во рту Тошнота	Боль в животе Запор Диарея Диспепсия Рвота	Дисфагия Стоматит
Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки		Эритема Гипергидроз Зуд Крапивница Сыпь	Дерматит
Общие нарушения и реакции в месте введения препарата		Астения Слабость Ощущение жара	Дискомфорт в грудной клетке Гипотермия
Результаты лабораторных и инструментальных исследований	Снижение артериального давления	Повышение артериального давления Повышение уровня триглицеридов в крови Депрессия сегмента ST на электрокардиограмме Снижение/повышение количества эозинофилов Изменение активности «печеночных» ферментов	Повышение/снижение числа лейкоцитов Снижение числа эритроцитов Укорочение протромбинового времени Повышение массы тела

Особые указания

В связи с содержанием лактозы лекарственное средство не рекомендуется пациентам с редкой врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или мальабсорбцией глюкозы-галактозы.



Беременность и лактация. Винпоцетин **противопоказан к применению** при беременности. При необходимости его применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Использование в педиатрии. Безопасность и эффективность применения винпоцетина у детей не установлена. Опыт применения винпоцетина у пациентов в возрасте до 18 лет ограничен.

Применение у лиц с нарушением функции печени и почек. Лекарственное средство не следует назначать пациентам с заболеваниями печени с выраженным нарушением функции.

Применение у лиц с сердечно-сосудистой патологией. Следует соблюдать осторожность при назначении винпоцетина пациентам, принимающим гипотензивные средства или лекарственные средства, удлиняющие интервал QT (лоратадин, терфенадин, эритромицин, пробукол) или имеющим в анамнезе синдром пролонгирования интервала QT.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управление механизмами. Пациенты, принимающие винпоцетин, должны воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, связанных с необходимостью повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С осторожностью следует назначать винпоцетин одновременно с препаратами центрального нервного действия, противоаритмическими и антикоагулянтными средствами.

В ходе клинических исследований при одновременном применении винпоцетина с бета-блокаторами, такими как клоранолол и пиндолол, а также при одновременном применении с клопамидом, глибенкламидом, дигоксином, аценокумаролом или гидрохлоротиазидом никакого взаимодействия между этими лекарственными средствами выявлено не было. В редких случаях некоторый дополнительный эффект наблюдался при одновременном применении альфа-метилдопы и винпоцетина, поэтому на фоне применения этой комбинации препаратов необходимо осуществлять регулярный контроль артериального давления.

Передозировка

Случаев передозировки отмечено не было.

Лечение симптоматическое.

Упаковка

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке, по 5 упаковок с листком-вкладышем в пачке.

Условия хранения

В защищенном от света и влаги месте, при температуре от 15 °С до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять после окончания срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Информация о производителе

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов», Республика Беларусь, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64, тел/факс +375 (177)735612, 731156.

