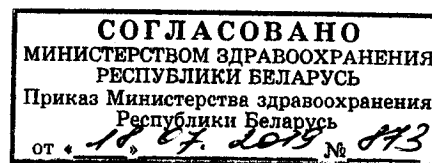


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ



ИНСТРУКЦИЯ (информация для специалистов) по медицинскому применению лекарственного средства **Винпоцетин форте**

Торговое название: Винпоцетин форте.

Международное непатентованное название: Vinpocetine.

Форма выпуска: таблетки 10 мг.

Состав: одна таблетка содержит: *действующего вещества:* винпоцетина - 10 мг; *вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, целлюлозу микрокристаллическую, магния стеарат, тальк, повидон, картофельный крахмал.

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

Фармакотерапевтическая группа: прочие психостимулирующие и ноотропные средства.

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 Ca²⁺-каналы, а также рецепторы NMDA и AMPA, усиливает нейропротективный эффект аденозина.

Винпоцетин стимулирует церебральный метаболизм, повышает

хват 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); лекарственное средство не вызывает «эффекта обкрадывания». Более того, на фоне приема 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

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

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 – 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 выделялось в неизмененном 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).

Изменение фармакокинетических свойств в особых обстоятельствах (например, в определенном возрасте, при наличии сопутствующих заболеваний)

Поскольку винпоцетин показан для терапии преимущественно пожилых пациентов, у которых наблюдаются изменения кинетики лекарственных препаратов – снижение всасывания, другое распределение и метаболизм, снижение выведения – необходимо было провести исследования по оценке кинетики винпоцетина именно в этой возрастной группе, особенно при длительном применении. Результаты таких исследований продемонстрировали, что кинетика винпоцетина у пожилых людей существенно не отличается от кинетики винпоцетина у молодых людей, и, кроме этого, отсутствует кумуляция. При нарушении функции печени или почек можно применять обычные дозы лекарственного средства, поскольку винпоцетин не накапливается в организме таких пациентов, что допускает длительное применение.

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

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ.

Острая фаза геморрагического церебрального инсульта, тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелые формы аритмии.

Детский возраст до 18 лет (ввиду отсутствия клинических данных).

Беременность, период лактации.

Способ применения и дозы

Обычные дозы лекарственного средства составляют 5-10 мг 3 раза в сутки (15-30 мг в сутки).

Таблетки необходимо принимать после еды.

Для пациентов с заболеваниями почек или печени специального подбора доз не требуется.

Применение лекарственного средства у детей до 18 лет противопоказано.

Побочное действие

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

Класс системы органов (MedDRA 12.1)	Нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$)	Редко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$)	Очень редко ($< 1/10000$)
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 Нарушения 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 Стенокардия напряжения Брадикардия Тахикардия Экстрасистолия Сердцебиение	Аритмия Фибрилляция предсердий
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

СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Дерматит
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки		Эритема Гипергидроз Зуд Крапивница Сыпь	
Общие нарушения и реакции в месте введения препарата		Астения Слабость Ощущения 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

Меры предосторожности

Рекомендуется ЭКГ-контроль при наличии синдрома удлинённого интервала QT или при одновременном приеме лекарственного средства, способствующего удлинению интервала QT.

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

Применение во время беременности и кормления грудью

Во время беременности и лактации применение винпоцетина противопоказано.

Беременность

Винпоцетин проникает через плаценту, но в плаценте и в крови плода обнаруживается в более низких концентрациях, чем в крови матери. Тератогенного или эмбриотоксического эффекта отмечено не было. В доклинических исследованиях введение лекарственного средства в высоких дозах в не-

которых случаях вызывало плацентарное кровотечение и спонтанное прерывание беременности, преимущественно в результате усиления плацентарного кровотока.

Лактация

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Винпоцетин выделяется с грудным молоком. В исследованиях с применением радиоактивного изотопа винпоцетина радиоактивность грудного молока в десять раз превышала таковую в крови матери. Количество, выделяемое с молоком в течение 1 ч, составляет 0,25 % от введенной дозы препарата. Поскольку винпоцетин выделяется с молоком матери, а данных об эффектах воздействия на организм новорожденного не имеется, применение винпоцетина в период кормления грудью противопоказано.

Применение у детей

Применение винпоцетина у детей до 18 лет противопоказано (см. раздел «Противопоказания»).

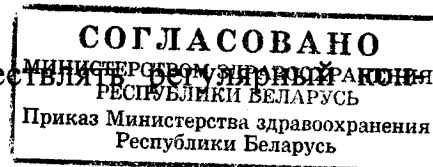
Влияние на способность управлять транспортными средствами и работу с механизмами

Исследования по оценке влияния применения лекарственного средства на способность управлять автомобилем и работать с механизмами не проводилась. В случае возникновения зрительных расстройств, головокружения и других нарушений со стороны нервной системы, необходимо воздержаться от потенциально опасных видов деятельности, которые требуют повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными 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, дигоксинном, аценокумаролом или гидрохлортиазидом 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 контроль артериального давления.



Хотя данные клинических исследований не подтвердили взаимодействия, рекомендуется соблюдать осторожность в случае одновременного применения винпоцетина с лекарственными средствами, влияющими на центральную нервную систему, а также в случае сопутствующей антиаритмической и антикоагулянтной терапии.

Передозировка

Информация о случаях передозировки отсутствует. В случае передозировки рекомендованы общие меры по удалению лекарственного средства из организма, симптоматическое лечение, направленное, в основном, на поддержание функций сердца и легких.

Упаковка

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке. 3 или 6 контурных ячейковых упаковок с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

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.