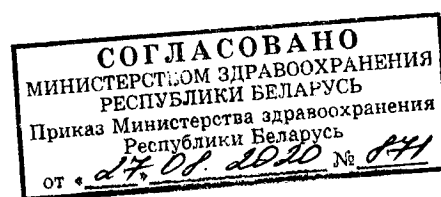


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ



ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

Винпоцетин

Торговое название: Винпоцетин.

Международное непатентованное название: Vinpocetine.

Форма выпуска: таблетки 5 мг.

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

Описание: таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, 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 нейротрофический 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 желу-

дочно-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 (%,%). Большое количество радиоактивной метки у крыс и собак обнаруживалось в желчи, но существенной энтерогепатической циркуляции не отмечалось. Аповинкаминная кислота выделяется через почки путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от дозы и способа применения винпоцетина.

Метаболизм: Основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминная 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 пресистемно-

го 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 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

- беременность, период лактации;
- 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).

Способ применения и дозы

Обычные дозы лекарственного средства составляют 15-30 мг 3 раза в сутки (15-30 мг в сутки). Таблетки необходимо принимать после еды.

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

Применение лекарственного средства Винпоцетин у детей до 18 лет противопоказано.

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

СОГЛАСОВАНО
 МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
 РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
 Приказ Министерства здравоохранения
 № _____ от _____

		Стенокардия напряжения 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

Сообщение о нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного средства с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза/риск» лекарственного средства. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных

реакциях лекарственного средства через национальную систему сообщений о нежелательных реакциях.



Меры предосторожности

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

Беременность и лактация. Во время беременности и лактации применение Внпоцетина противопоказано.

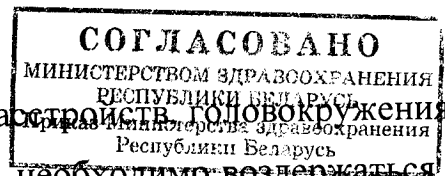
Беременность. Винпоцетин проникает через плаценту, но в плаценте и в крови плода обнаруживается в более низких концентрациях, чем в крови матери. Тератогенного или эмбриотоксического эффекта не отмечено. В доклинических исследованиях введение лекарственного средства в высоких дозах в некоторых случаях вызывало плацентарное кровотечение и спонтанное прерывание беременности, преимущественно в результате усиления плацентарного кровотока.

Лактация. 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 часа, составляет 0,25 процентов 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.

Использование в педиатрии. Применение лекарственного средства Винпоцетин у детей до 18 лет противопоказано.

Применение у лиц с патологией сердца. Рекомендуется ЭКГ-контроль при наличии синдрома удлиненного интервала QTили при одновременном приеме лекарственного средства, способствующего удлинению интервала QT.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Исследования по оценке влияния приема лекарственного средства на способность управлять автомобилем и работать с механизмами не про-



водились. 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

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

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 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 регулярный контроль артериального давления.

Передозировка

Случаев передозировки отмечено не было.
Лечение симптоматическое.

Упаковка

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

5 контурных ячейковых упаковок вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

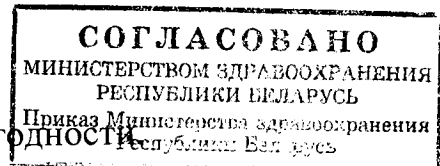
Условия хранения

В оригинальной упаковке для защиты от света и влаги, 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.