

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Винпоцетин Велфарм

Регистрационный номер: ЛП-005203

Торговое наименование препарата: Винпоцетин Велфарм

Международное непатентованное наименование: винпоцетин

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку:

Действующее вещество: винпоцетин – 5 мг, 10 мг;

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский 12600±2700, пласдон К-17), магния стеарат, карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахмал гликолят, примогель).

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

Фармакотерапевтическая группа: мозговой кровоток улучшающее средство

Код АТХ: [N06BX18]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Улучшает метаболизм головного мозга, увеличивая потребление глюкозы и кислорода тканью головного мозга. Повышает устойчивость нейронов к гипоксии, усиливая транспорт глюкозы к головному мозгу, через гематоэнцефалический барьер; переводит процесс распада глюкозы на энергетически более экономный, аэробный путь; селективно блокирует кальций зависимую фосфодиэстеразу; повышает уровни аденозинмонофосфата (АМФ) и циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) головного мозга. Повышает концентрацию аденозинтрифосфата (АТФ) и соотношение АТФ/АМФ в тканях головного мозга; усиливает обмен норадреналина и серотонина головного мозга; стимулирует восходящую ветвь норадренергической системы, оказывает антиоксидантное действие.

Снижает агрегацию тромбоцитов и повышенную вязкость крови; увеличивает деформирующую способность эритроцитов и блокирует утилизацию эритроцитами аденозина; способствует повышению отдачи кислорода эритроцитами. Усиливает нейропротективное действие аденозина.

Увеличивает церебральный кровоток; снижает резистентность сосудов головного мозга без существенного изменения показателей системного кровообращения (артериальное давление, минутный объем, частота сердечных сокращений, общая периферическая

резистентность). Не только не оказывает эффекта «обкрадывания», но и усиливает кровоснабжение, прежде всего, в ишемизированных участках мозга с низкой перфузией.

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 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» АВК 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.

При нарушении функции печени или почек коррекция дозы не требуется, поскольку винпоцетин не кумулирует в организме.

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 %. Выведение аповинкаминовой кислоты осуществляется путем гломерулярной фильтрации.

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 фармакокинетика 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, шум 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 грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований);
- редко встречающаяся наследственная непереносимость галактозы (галактоземия), непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в связи с наличием лактозы в составе препарата).

С осторожностью

Необходимо соблюдать меры предосторожности у пациентов с синдромом удлиненного интервала QT или при одновременном применении с препаратами, вызывающими удлинение этого интервала (необходимо периодически проводить мониторинг электрокардиографии (ЭКГ)).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

При беременности и в период грудного вскармливания препарат противопоказан.

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 возникали плацентарные кровотечения и спонтанные аборт (предположительно вследствие увеличения плацентарного кровотока).

Период грудного вскармливания:

В течении 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 еды.

Курс лечения и дозировка определяется лечащим врачом.

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 препарата. Для достижения полного терапевтического эффекта требуется три месяца.

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

Побочное действие

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.

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

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – гиперчувствительность.

Нарушения со стороны обмена веществ: нечасто – гиперхолестеринемия; редко – снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет, повышение уровня триглицеридов в крови; очень редко – увеличение массы тела.

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

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль; редко – дисгевзия, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия; очень редко – тремор, спазмы, судороги.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – отек соска зрительного нерва; очень редко – гиперемия конъюнктивы, нечеткость зрения, диплопия.

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; редко – изменение ЭКГ (депрессия сегмента ST, удлинение интервала QT); очень редко – аритмия, фибрилляция предсердий.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто – снижение артериального давления (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, слюнотечение, рвота; очень редко – дисфагия, стоматит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко – эритема, гипергидроз, зуд, крапивница, сыпь; очень редко – дерматит.

Общие нарушения: редко – астения, слабость, ощущение жара; очень редко – дискомфорт в грудной клетке.

Прочие: редко – снижение/повышение количества эозинофилов; очень редко – уменьшение протромбинового времени, снижение количества эритроцитов, увеличение мочевины, повышение лактатдегидрогеназы.

Передозировка

Симптомы. Случаи передозировки не зарегистрированы. Имеются сведения, что применение 60 мг винпоцетина в сутки безопасно. Однократный пероральный прием винпоцетина в дозе 360 мг не вызывает клинически значимых сердечно-сосудистых и прочих реакций.

Лечение. Промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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

Одновременное применение винпоцетина и 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 противоритмического 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, механизмами

Данных о влиянии винпоцетина на способность к управлению автомобилем и рабочими механизмами нет.

Форма выпуска

Таблетки 5 мг, 10 мг.

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

10, 20, 30, 40, 50, 60, 70, 80, 90, 100 таблеток в банку полимерную из полипропилена с крышкой натягиваемой из полиэтилена высокого давления или в банку полимерную из полиэтилена низкого давления с крышкой натягиваемой из полиэтилена низкого давления или с крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления.

Каждую банку, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

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

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия

Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте: www.brightway.ru, в разделе «VELPHARM» – «Фармаконадзор».