ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ВІНПОЦЕТИН-АСТРАФАРМ

(VINPOCETINE-ASTRAPHARM)

Склад:

діюча речовина: vinpocetine;

1 таблетка містить вінпоцетину 5 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль кукурудзяний; магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору плоскоциліндричної форми зі скошеними краями і рискою.

Фармакотерапевтична група.

Психостимулюючі та ноотропні засоби. Код АТХ N06B X18.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Вінпоцетин має комплексний механізм дії, сприятливо впливаючи на мозковий кровообіг та церебральний метаболізм, а також покращує реологічні властивості крові.

Вінпоцетин виявляє нейропротективні ефекти: препарат послаблює шкідливу дію цитотоксичних реакцій, спричинених стимулюючими амінокислотами. Препарат інгібує потенціалзалежні Na^- та Ca^{2}-канали, а також рецептори NMDA і AMPA. Препарат посилює нейропротективний ефект аденозину.

Вінпоцетин стимулює церебральний метаболізм: препарат збільшує захоплення глюкози та O_2 і споживання цих речовин тканиною головного мозку. Препарат підвищує стійкість головного мозку до гіпоксії; збільшує транспортування глюкози – виняткового джерела енергії для головного мозку – через гематоенцефалічний бар'єр; зсуває метаболізм глюкози у бік енергетично більш сприятливого аеробного шляху; вибірково інгібує Ca^{2}-кальмодулінзалежний фермент цГМФ-фосфодіестеразу (ФДЕ); підвищує рівень цАМФ і цГМФ у головному мозку. Препарат підвищує концентрацію АТФ і співвідношення АТФ/АМФ; посилює обмін

норадреналіну і серотоніну у головному мозку; стимулює висхідну норадренергічну систему; має антиоксидантну активність, у результаті дії всіх вищезазначених ефектів вінпоцетин чинить церебропротекторну дію.

Вінпоцетин покращує мікроциркуляцію у головному мозку: препарат інгібує агрегацію тромбоцитів, зменшує патологічно підвищену в'язкість крові, збільшує здатність еритроцитів до деформації та інгібує захоплення аденозину; покращує транспортування O_2 у тканинах шляхом зниження афінітету O_2 до еритроцитів.

Вінпоцетин селективно збільшує кровотік у головному мозку: препарат збільшує церебральну фракцію серцевого викиду; знижує судинний опір у головному мозку, не впливаючи на параметри системної циркуляції (артеріальний тиск, серцевий викид, частоту пульсу, загальний периферичний опір); препарат не спричиняє «ефекту обкрадання». Більш того, на тлі прийому препарату покращується надходження крові у пошкоджені (але ще не некротизовані) ділянки ішемії з низькою перфузією («зворотний ефект обкрадання»).

Фармакокінетика.

Вінпоцетин швидко всмоктується, максимальна концентрація у плазмі крові досягається через 1 годину після перорального застосування. Основним місцем всмоктування вінпоцетину є проксимальні відділи травного тракту. З’єднання не зазнає метаболізму у момент проходження через кишкову стінку.

Зв’язування з білками крові становить 66 %. Абсолютна біодоступність вінпоцетину при пероральному прийомі становить 7 %. Об’єм розподілу становить 246,7±88,5 л, що означає виражене зв’язування речовини у тканинах. Значення кліренсу вінпоцетину у плазмі крові перевищує його значення у печінці, що вказує на позапечінковий метаболізм з’єднання.

При багаторазовому пероральному застосуванні препарату у дозі 5 мг і 10 мг вінпоцетин демонструє лінійну кінетику. Період напіввиведення становить 4,83±1,29 години. Основний шлях виведення препарату здійснюється нирками і через кишечник у співвідношенні 60:40 %.

Основним метаболітом вінпоцетину є аповінкамінова кислота (АВК), яка у людей утворюється у 25-30 %. Після перорального застосування площа під кривою «концентрація-час» АВК у 2 рази перевищує таку після внутрішньовенного введення препарату, що вказує на утворення АВК у процесі пресистемного метаболізму вінпоцетину. Кількість вінпоцетину, що виділилася у незміненому вигляді, становила лише кілька відсотків від прийнятої дози препарату.

Важливою і значущою властивістю вінпоцетину є відсутність необхідності спеціального підбору дози препарату для пацієнтів із захворюваннями печінки або нирок, зважаючи на метаболізм препарату і відсутність кумуляції (накопичення).

Кінетика вінпоцетину у пацієнтів літнього віку суттєво не відрізняється від кінетики вінпоцетину у молодих людей і, крім цього, відсутня кумуляція.

Клінічні характеристики.

Показання.

Неврологія. Для лікування різних форм цереброваскулярної патології: стани після перенесеного порушення мозкового кровообігу (інсульту), вертебробазилярної недостатності, судинної деменції, церебрального атеросклерозу, посттравматичної і гіпертонічної енцефалопатії. Сприяє зменшенню психічної і неврологічної симптоматики при цереброваскулярній патології.

Офтальмологія. Для лікування хронічної судинної патології судинної оболонки ока та сітківки.
Оториноларингологія. Для лікування старечої туговухості перцептивного типу, хвороби Меньєра та шуму у вухах.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до вінпоцетину або до будь-якого компонента препарату. Тяжкий перебіг ішемічної хвороби серця, серцеві аритмії. Період вагітності або годування груддю. Дитячий вік.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування Вінпоцетину-Астрафарм з β-блокаторами (хлоранололом, піндололом), клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або гідрохлортіазидом не супроводжувалося будь-якою взаємодією між ними. У поодиноких випадках деякий додатковий ефект спостерігався при одночасному застосуванні а-метилдопи і вінпоцетину, тому на тлі застосування цієї комбінації препаратів необхідно здійснювати регулярний контроль артеріального тиску.

Хоча дані клінічних досліджень не підтвердили взаємодії, рекомендується дотримуватися обережності у разі одночасного застосування вінпоцетину з лікарськими препаратами, що впливають на центральну нервову систему, а також у разі супутньої антиаритмічної і антикоагулянтної терапії.

Особливості застосування.

Рекомендується ЕКГ-контроль у разі наявності синдрому подовженого інтервалу QT або при одночасному прийомі лікарського препарату, що сприяє подовженню інтервалу QT.

При наявності у пацієнта підвищеного внутрішньочерепного тиску, аритмії або синдрому подовженого інтервалу QT, а також на тлі застосування антиаритмічних препаратів курс терапії препаратом можна розпочинати тільки після ретельного аналізу користі та ризиків, пов’язаних із застосуванням препарату.

Препарат містить лактозу, тому його не слід призначати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, дефіцитом лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Репродуктивність. Не впливає на фертильність.

Тератогенної дії не виявлено.

Мутагенність. Вінпоцетин не чинить мутагенної дії.

Канцерогенність. Вінпоцетин не чинить канцерогенної дії.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат протипоказаний.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

При застосуванні препарату можуть відзначатися побічні реакції з боку центральної нервової системи (сонливість, запаморочення), тому слід дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Таблетки застосовують внутрішньо після прийому їжі.

Доза для дорослих становить 5-10 мг 3 рази на добу (15-30 мг).

При захворюваннях печінки та/або нирок особливого підбору дози не потрібно.

Тривалість лікування визначає лікар індивідуально.

Діти.

Дітям препарат не застосовують (через відсутність клінічних даних).

Передозування.

Випадків передозування відзначено не було. Тривале застосування вінпоцетину у добовій дозі 60 мг також безпечне. Навіть одноразовий прийом внутрішньо 360 мг вінпоцетину не спричиняв будь-якого клінічно значущого небажаного ефекту з боку серцево-судинної системи або інших ефектів.

Побічні реакції.

З боку системи крові: рідко – лейкопенія, тромбоцитопенія; дуже рідко – анемія, аглютинація еритроцитів.

З боку імунної системи: дуже рідко – гіперчутливість.

Метаболічні порушення: нечасто – гіперхолестеринемія; рідко – зниження апетиту, анорексія, цукровий діабет.

З блоку психіки: рідко – безсоння, порушення сну, неспокій; дуже рідко – ейфорія, депресія.

З боку нервової системи: нечасто – головний біль; рідко – запаморочення, дисгевзія, ступор, геміпарез, сонливість, амнезія; дуже рідко – тремор, судоми, ажитація.

З боку органів зору: рідко – набряк соска зорового нерва; дуже рідко – гіперемія кон'юнктиви.

З боку органів слуху: нечасто – вертиго; рідко – гіперакузія, гіпоакузія, шум у вухах.

З боку серцево-судинної системи: нечасто – артеріальна гіпотензія; рідко – ішемія/інфаркт міокарда, стенокардія напруження, брадикардія, тахікардія, екстрасистолія, відчуття серцебиття, артеріальна гіпертензія, припливи, тромбофлебіт; дуже рідко – аритмії, фібриляція передсердь, зміна артеріального тиску, депресія сегмента ST, подовження інтервалу QT, але наявність причинного зв'язку між такою побічною дією і лікуванням вінпоцетином не доведене, оскільки у природній популяції ці симптоми спостерігаються з такою ж частотою.

З боку травного тракту: нечасто – дискомфорт у животі, сухість у роті, нудота; рідко – біль у животі, запор, діарея, диспепсія, блювання; дуже рідко – дисфагія, стоматит, печія.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: рідко – еритема, гіпергідроз, свербіж, кропив'янка, висипання; дуже рідко – дерматит.

Загальні порушення: рідко – астенія, збільшення маси тіла, загальна слабкість (симптоми можуть бути проявами основного захворювання), відчуття жару, підвищена втомлюваність; дуже рідко – дискомфорт у грудній клітці, гіпотермія.

Лабораторні дослідження: нечасто – зниження артеріального тиску; рідко – підвищення артеріального тиску, підвищення рівня тригліцеридів у крові, депресія сегмента ST на електрокардіограмі, збільшення/зменшення кількості еозинофілів, зміна активності печінкових ферментів; дуже рідко – збільшення/зменшення кількості лейкоцитів, зменшення кількості еритроцитів, зменшення протромбінового часу.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 2 або по 3, або по 5 блістерів у коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ «АСТРАФАРМ».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 08132, Київська обл., Києво-Святошинський район, м. Вишневе, вул. Київська, 6.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ВИНПОЦЕТИН-АСТРАФАРМ

(VINPOCETINE-ASTRAPHARM)

Состав:

действующее вещество: vinpocetine;

1 таблетка содержит винпоцетина 5 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат; крахмал кукурузный; магния стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого цвета плоскоцилиндрической формы со скошенными краями и черточкой.

Фармакотерапевтическая группа.

Психостимулирующие и ноотропные средства. Код АТХ N06B X18.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Винпоцетин имеет комплексный механизм действия, благоприятно влияя на мозговое кровообращение и церебральный метаболизм, а также улучшает реологические свойства крови.

Винпоцетин оказывает нейропротективные эффекты: препарат ослабляет вредное действие цитотоксических реакций, вызванных стимулирующими аминокислотами. Препарат ингибирует потенциалзависимые Na^- и Ca^{2}-каналы, а также рецепторы NMDA и AMPA. Препарат усиливает нейропротекторный эффект аденозина.

Винпоцетин стимулирует церебральный метаболизм: препарат увеличивает захват глюкозы и O_2 и потребление этих веществ тканью головного мозга. Препарат повышает стойкость головного мозга к гипоксии; увеличивает транспортирование глюкозы – исключительного источника энергии для головного мозга – через гематоэнцефалический барьер; сдвигает метаболизм глюкозы в сторону энергетически более благоприятного аэробного пути; выборочно ингибирует Ca^{2}-кальмодулинзависимый фермент цГМФ-фосфодиэстеразу (ФДЕ); повышает уровень цАМФ и цГМФ в головном мозгу. Препарат повышает концентрацию АТФ и соотношение АТФ/АМФ; усиливает обмен норадреналина и серотонина в головном мозгу; стимулирует восходящую норадренергическую систему; имеет антиоксидантную активность, в результате действия всех вышеупомянутых эффектов винпоцетин оказывает церебропротекторное действие.

Винпоцетин улучшает микроциркуляцию в головном мозге: препарат ингибирует агрегацию тромбоцитов, уменьшает патологически повышенную вязкость крови, увеличивает способность эритроцитов к деформации и ингибирует захват аденозина; улучшает транспортирование O_2 в тканях путем снижения аффинитета O_2 к эритроцитам.

Винпоцетин селективно увеличивает кровоток в головном мозге: препарат увеличивает церебральную фракцию сердечного выброса; снижает сосудистое сопротивление в головном мозге, не влияя на параметры системной циркуляции (артериальное давление, сердечный выброс, частоту пульса, общее периферическое сопротивление); препарат не вызывает «эффекта обворовывания». Более того, на фоне приема препарата улучшается поступление крови в поврежденные (но еще не некротизованные) участки ишемии с низкой перфузией («обратный эффект обворовывания»).

Фармакокинетика.

Винпоцетин быстро всасывается, максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1 час после перорального применения. Основным местом всасывания винпоцетина являются проксимальные отделы пищеварительного тракта. Соединение не испытывает метаболизма в момент прохождения через кишечную стенку.

Связывание с белками крови составляет 66 %. Абсолютная биодоступность винпоцетина при пероральном приеме составляет 7 %. Объем распределения составляет 246,7±88,5 л, что означает выраженное связывание вещества в тканях. Значение клиренса винпоцетина в плазме крови превышает его значение в печени, что указывает на внепеченочный метаболизм соединения.

При многократном пероральном применении препарата в дозе 5 мг и 10 мг винпоцетин демонстрирует линейную кинетику. Период полувыведения составляет 4,83±1,29 часа. Основной путь выведения препарата осуществляется почками и через кишечник в соотношении 60:40 %.

Основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминовая кислота (АВК), которая у людей образовывается в 25-30 %. После перорального применения площадь под кривой «концентрация-время» АВК в 2 раза превышает такую же после внутривенного введения препарата, что указывает на образование АВК в процессе пресистемного метаболизма винпоцетина. Количество винпоцетина, выделяющееся в неизмененном виде, составляло только несколько процентов от принятой дозы препарата.

Важным и значительным свойством винпоцетина является отсутствие необходимости специального подбора дозы препарата для пациентов с заболеваниями печени или почек, учитывая метаболизм препарата и отсутствие кумуляции (накопление).

Кинетика винпоцетина у пациентов пожилого возраста существенно не отличается от кинетики винпоцетина у молодых людей и, кроме этого, отсутствует кумуляция.

Клинические характеристики.

Показания.

Неврология. Для лечения различных форм цереброваскулярной патологии: состояния после перенесенного нарушения мозгового кровообращения (инсульта), вертебробазилярной недостаточности, сосудистой деменции, церебрального атеросклероза, посттравматической и гипертонической энцефалопатии. Способствует уменьшению психической и неврологической симптоматики при цереброваскулярной патологии.

Офтальмология. Для лечения хронической сосудистой патологии сосудистой оболочки глаза и сетчатки.
Оториноларингология. Для лечения старческой тугоухости перцептивного типа, болезни Меньера и шума в ушах.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к винпоцетину или к любому компоненту препарата. Тяжелое течение ишемической болезни сердца, сердечные аритмии. Период беременности или кормления грудью. Детский возраст.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Одновременное применение Винпоцетина-Астрафарм с b-блокаторами (хлоранололом, пиндололом), клопамидом, глибенкламидом, дигоксином, аценокумаролом или гидрохлортиазидом не сопровождалось каким-либо взаимодействием между ними. В единичных случаях некоторый дополнительный эффект наблюдался при одновременном

применении а-метилдопы и винпоцетина, поэтому на фоне применения этой комбинации препаратов необходимо осуществлять регулярный контроль артериального давления.

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

Особенности применения.

Рекомендуется ЭКГ-контроль в случае наличия синдрома удлиненного интервала QT или при одновременном приеме лекарственного препарата, способствующего удлинению интервала QT.

При наличии у пациента повышенного внутричерепного давления, аритмии или синдрома удлиненного интервала QT, а также на фоне применения антиаритмических препаратов курс терапии препаратом можно начинать только после тщательного анализа пользы и рисков, связанных с применением препарата.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует назначать пациентам с редчайшими наследственными формами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Репродуктивность. Не влияет на фертильность.

Тератогенного действия не выявлено.

Мутагенность. Винпоцетин не оказывает мутагенного действия.

Канцерогенность. Винпоцетин не оказывает канцерогенного действия.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Противопоказан.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

При применении препарата могут отмечаться побочные эффекты со стороны центральной нервной системы, поэтому нужно соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Таблетки применяют внутрь после приема пищи.

Доза для взрослых составляет 5-10 мг 3 раза в сутки (15-30 мг).

При заболеваниях печени и/или почек особого подбора дозы не нужно.

Продолжительность лечения определяет врач индивидуально.

Дети.

Детям препарат не применяют (из-за отсутствия клинических данных).

Передозировка.

Случаев передозировка отмечено не было. Длительное применение винпоцетина в суточной дозе 60 мг также безопасно. Даже однократный прием внутрь 360 мг винпоцетина не вызывал какого-либо клинически значимого нежелательного эффекта со стороны сердечно-сосудистой системы или других эффектов.

Побочные реакции.

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

Со стороны иммунной системы: очень редко – гиперчувствительность.

Метаболические нарушения: нечасто – гиперхолестеринемия; редко – снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет.

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

Со стороны нервной системы: нечасто – головная боль; редко – головокружение, дисгевзия, ступор, гемипарез, сонливость, амнезия; очень редко – тремор, судороги, ажитация.

Со стороны органов зрения: редко – отек соска зрительного нерва; очень редко – гиперемия конъюнктивы.

Со стороны органов слуха: нечасто – вертиго; редко – гиперакузия, гипоакузия, шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто – артериальная гипотензия; редко – ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия напряжения, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения, артериальная гипертензия, приливы, тромбофлебит; очень редко – аритмии, фибрилляция предсердий, изменение артериального давления, депрессия сегмента ST, удлинение интервала QT, но наличие причинной связи между таким побочным действием и лечением винпоцетином не доказано, поскольку в естественной популяции эти симптомы наблюдаются с такой же частотой.

Со стороны пищеварительного тракта: нечасто – дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота; редко – боль в животе, запор, диарея, диспепсия, рвота; очень редко – дисфагия, стоматит, изжога.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: редко – эритема, гипергидроз, зуд, крапивница, сыпь; очень редко – дерматит.

Общие нарушения: редко – астения, увеличение массы тела, общая слабость (симптомы могут быть проявлениями основного заболевания), ощущение жара, повышенная утомляемость; очень редко – дискомфорт в грудной клетке, гипотермия.

Лабораторные исследования: нечасто – снижение артериального давления; редко – повышение артериального давления, повышение уровня триглицеридов в крови, депрессия сегмента ST на электрокардиограмме, увеличение/уменьшение количества эозинофилов, изменение активности печеночных ферментов; очень редко – увеличение/уменьшение количества лейкоцитов, уменьшение количества эритроцитов, уменьшение протромбинового времени.

Срок годности. 5 лет.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере; по 2 или по 3, или по 5 блистеров в коробке.

Категория отпуска.

По рецепту.

Производитель.

ООО «АСТРАФАРМ».

Местонахождение производителя и адрес места проведения его деятельности.

Украина, 08132, Киевская обл., Киево-Святошинский район, г. Вишневое, ул. Киевская, 6.