

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ

ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ВИНПОТРОПИЛ®

Регистрационный номер:

Торговое название: Винпотропил®

Международное непатентованное или группировочное название:
винпоцетин + пирацетам

Лекарственная форма: капсулы

Состав

1 капсула содержит

действующие вещества: винпоцетин 5 мг, пирацетам 400 мг;

вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный 2,6 мг, лактозы моногидрат 107,4 мг, тальк 5 мг;

состав капсулы твердой желатиновой № 0:

корпус: титана диоксид 1,7421 мг, краситель хинолиновый желтый 0,5226 мг, краситель солнечный закат желтый 0,0233 мг, желатин 55,782 мг;

крышечка: титана диоксид 0,4552 мг, краситель азорубин 0,1896 мг, желатин 37,2852 мг.

Описание

Твердые желатиновые капсулы № 0: корпус желтого цвета, крышечка красного цвета. Содержимое капсул – порошок белого или почти белого цвета. Допускается наличие отдельных кристаллов и комочков.

Фармакотерапевтическая группа

Психоаналептики; психостимуляторы, средства, применяемые при синдроме дефицита внимания с гиперактивностью, и ноотропные средства; другие психостимуляторы и ноотропные средства.

Код АТХ: N06BX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Винпотропил® - комбинированный препарат. Обладает свойствами,

характерными для психостимулирующего средства (винпоцетин) и для ноотропного средства (винпоцетин, пирацетам).

Как психостимулирующее средство

Улучшает метаболизм головного мозга, увеличивая потребление глюкозы и кислорода тканью головного мозга. Повышает устойчивость нейронов к гипоксии; усиливает транспорт глюкозы к головному мозгу, через гематоэнцефалический барьер; переводит процесс распада глюкозы на энергетически более экономный, аэробный путь; селективно блокирует Ca^{2+} -зависимую фосфодиэстеразу; повышает уровни аденозинмонофосфата (АМФ), циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) и аденозинтрифосфата (АТФ) 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 эластичность эритроцитов и блокирует утилизацию эритроцитами аденозина; способствует повышению отдачи эритроцитами кислорода. Увеличивает церебральный кровоток; снижает резистентность сосудов головного мозга без существенного изменения показателей системного кровообращения. Не оказывает эффекта «обкрадывания» и усиливает кровоснабжение, прежде всего, в ишемизированных участках мозга. Проникает через плацентарный барьер.

Как ноотропное средство

Оказывает положительное влияние на обменные процессы мозга, незначительно повышает концентрацию АТФ в головном мозге, усиливает синтез рибонуклеиновой кислоты и фосфолипидов, стимулирует гликолитические процессы, усиливает утилизацию глюкозы; улучшает интегративную деятельность головного мозга, способствует консолидации памяти, облегчает процесс обучения; изменяет скорость распространения возбуждения в головном мозге, улучшает микроциркуляцию, не оказывая при этом сосудорасширяющего действия, ингибирует агрегацию активированных тромбоцитов; оказывает защитное действие при повреждениях головного мозга, вызываемых гипоксией, интоксикациями, электрошоком; усиливает альфа- и

бета-активность, снижает дельта-активность на электроэнцефалограмме, уменьшает выраженность вестибулярного нистагма; улучшает связи между полушариями головного мозга и синаптическую проводимость в неокортикальных структурах, повышает умственную активность, усиливает мозговой кровоток; не обладает седативным, психостимулирующим влиянием. Эффект развивается постепенно.

Обладает выраженным эффектом в отношении симптомов начальных проявлений когнитивных нарушений церебрально-сосудистого генеза у больных пожилого и старческого возраста. Рекомендован в психогериатрической практике.

Фармакокинетика

Винпоцетин

Абсорбция

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 концентрация обнаруживалась в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечалась через 2-4 часа после введения. Концентрация радиоактивного меченого винпоцетина в головном мозге не превышала значений, обнаруженных в крови.

У человека связь с белками плазмы составляет 66%, биодоступность при приеме внутрь - 7%. Объем распределения 246,7-88,5 л, что свидетельствует о высоком связывании с тканями. Общий клиренс (66,7 л/ч) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/ч), что свидетельствует о внепеченочном метаболизме.

Метаболизм

Основным метаболитом является аповинкаминат (АВА), составляющий 25,30% от исходного соединения. Площадь под кривой «концентрация - время» АВА после приема внутрь вдвое превышает таковую при внутривенном введении винпоцетина. Таким образом, винпоцетин подвержен выраженному эффекту «первичного прохождения» через печень. К прочим метаболитам относятся: гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВА, АВА-диоксиглицинат и их конъюгаты (сульфаты и (или) глюкурониды).

Выведение

Выведение неизменного винпоцетина низкое (несколько процентов). При многократном введении в дозах 5 мг и 10 мг кинетика носит линейный характер, равновесная плазменная концентрация составляет $1,2 \pm 0,27$ и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл, соответственно. Период полувыведения у человека $4,8 \pm 1,29$ ч. Выводится почками и через кишечник в соотношении 60:40. У крыс и собак высокая радиоактивность при введении радиоактивно меченного винпоцетина обнаруживается в желчи, однако, отмечена значительная энтерогепатическая рециркуляция.

Фармакокинетика у особых групп пациентов (возраст, сопутствующие заболевания)

Выявлено, что фармакокинетика винпоцетина у пожилых пациентов значимо не отличается от таковой у молодых пациентов, кумуляция препарата отсутствует.

Пирацетам

Абсорбция

После приема внутрь пирацетам быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Биодоступность составляет около 100%.

После однократного приема пирацетама в дозе 2 г максимальная концентрация ($C_{\max}$) достигается за 30 мин и составляет 40-60 мкг/мл, через 2-8 ч обнаруживается в спинномозговой жидкости.

Распределение

Объем распределения (V_d) составляет около 0,6 л/кг. Не связывается с белками плазмы. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный

барьеры, а также гемодиализные мембраны. В исследовании на животных обнаружено, что пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных долях, в мозжечке и базальных ядрах.

Метаболизм

Не метаболизируется.

Выведение

Период полувыведения из крови ($T_{1/2}$) составляет 4-5 ч и 8,5 ч — из спинномозговой жидкости. $T_{1/2}$ удлиняется при почечной недостаточности.

Выводится в неизмененном виде почками. Экскреция почками почти полная (>95%) в течение 30 ч. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Показания к применению

Симптоматическое лечение: интеллектуально-мнестических нарушений, последствий ишемического инсульта, сосудистой вертебробазилярной недостаточности, сосудистой деменции, атеросклероза сосудов головного мозга, посттравматической, гипертонической энцефалопатии.

Хронические сосудистые заболевания сетчатки и сосудистой оболочки глаза.

Снижение слуха перцептивного типа, болезнь Меньера, шум в ушах.

Противопоказания

Гиперчувствительность к винпоцетину, пирацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата, беременность, период лактации, выраженные нарушения ритма сердца, ишемическая болезнь сердца (тяжелое течение), острая стадия геморрагического инсульта, почечная и/или печеночная недостаточность, болезнь Гентингтона, дети до 18 лет (в связи с недостаточностью данных).

Пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не должны принимать препарат.

С осторожностью

Нарушение гемостаза, тяжелое кровотечение, доброкачественные

гипербилирубинемии (в том числе синдром Жильбера), вирусный гепатит, алкогольное поражение печени, алкоголизм, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, эпилепсия, пожилой возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Винпоцетин

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

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 аборты (предположительно вследствие увеличения плацентарного кровотока).

Грудное вскармливание

Винпоцетин проникает в грудное молоко. Согласно доклиническим исследованиям с радиоактивно меченым винпоцетином концентрация в грудном молоке новорожденных животных превышала таковую в крови матери в 10 раз. За 1 ч в молоко проникает 0,25% принятой дозы.

Не следует применять в период кормления грудью или следует прекратить грудное вскармливание при лечении винпоцетином.

Пирацетам

Беременность

Достаточные данные о применении пирацетама во время беременности отсутствуют. Исследования на животных не показали прямого или опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие.

Пирацетам проникает через плацентарный барьер. Плазменная концентрация пирацетама у новорожденных достигает 70-90 % от таковой у матери. Пирацетам следует назначать во время беременности лишь в исключительных случаях, если польза для матери превышает потенциальный риск для плода, а клиническое состояние беременной требует лечения пирацетамом.

Грудное вскармливание

Пирацетам проникает в грудное молоко. Пирацетам не следует применять в период грудного вскармливания или следует прекратить грудное вскармливание при лечении пирацетамом. При принятии решения о необходимости отмены грудного вскармливания или отказа от лечения пирацетамом следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

Способ применения и дозы

Для пациентов от 18 лет и старше: внутрь, перед едой, по 1-2 капсулы, 2-3 раза в день. Последний прием - за 4 часа до сна.

Длительность курса лечения составляет 2-3 месяца.

Перед отменой дозу препарата следует постепенно уменьшать.

Побочное действие

Побочные эффекты достаточно редки. Градация частоты определяется следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$) и частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных клинических исследований).

Винпоцетин

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Редко: лейкопения, тромбоцитопения.

Очень редко: анемия, агглютинация эритроцитов.

Нарушение со стороны иммунной системы

Очень редко: гиперчувствительность.

Нарушение со стороны обмена веществ и питания

Нечасто: гиперхолестеринемия

Редко: снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет.

Нарушение психики

Редко: бессонница, нарушение сна, возбуждение, неусидчивость.

Очень редко: эйфория, депрессия.

Нарушение со стороны нервной системы

Нечасто: головная боль.

Редко: головокружение, нарушение вкуса, ступор, гемипарез, сонливость, амнезия.

Очень редко: тремор, спазмы.

Нарушение со стороны органа зрения

Редко: отек диска зрительного нерва

Очень редко: гиперемия конъюнктивы.

Нарушение со стороны органа слуха и лабиринта

Нечасто: вертиго.

Редко: гиперакузия, гипоакузия, шум в ушах.

Нарушение со стороны сердца

Редко: ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения.

Очень редко: аритмия, фибрилляция предсердий.

Нарушение со стороны сосудов

Нечасто: артериальная гипотензия.

Редко: артериальная гипертензия, «приливы», тромбофлебит.

Очень редко: колебания артериального давления.

Нарушение со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто: дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота.

Редко: боль в животе, запор, диарея, диспепсия, рвота.

Очень редко: дисфагия, стоматит.

Нарушение со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: эритема, повышенная потливость, зуд, крапивница, сыпь.

Очень редко: дерматит.

Общие расстройства и расстройства в месте введения

Редко: астения, недомогание.

Очень редко: дискомфорт в грудной клетке, гипотермия.

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований

Нечасто: снижение артериального давления

Редко: повышение артериального давления, повышение концентрации

триглицеридов в сыворотке крови, депрессия сегмента (ST) на электрокардиограмме, снижение/повышение эозинофилов, нарушение функциональных печеночных проб.

Очень редко: увеличение/уменьшение количества лейкоцитов, снижение числа эритроцитов, уменьшение тромбинового времени, увеличение массы тела.

Пирацетам

Со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: кровоточивость.

Со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: анафилактоидные реакции, гиперчувствительность.

Со стороны психики

Часто: нервозность.

Нечасто: депрессия.

Частота неизвестна: ажитация, тревога, спутанность сознания, галлюцинации.

Со стороны нервной системы

Часто: гиперактивность.

Нечасто: сонливость.

Частота неизвестна: атаксия, нарушения равновесия, обострение течения эпилепсии, головная боль, бессонница, тремор.

Со стороны органа слуха и лабиринта

Частота неизвестна: вертиго.

Со стороны пищеварительной системы

Частота неизвестна: абдоминальная боль (в т.ч. в верхних отделах), диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: ангионевротический отек, дерматит, зуд, крапивница.

Со стороны репродуктивной системы

Частота неизвестна: усиление сексуального влечения.

Общие нарушения и расстройства в месте введения

Нечасто: астения.

Лабораторно-инструментальные данные

Часто: увеличение массы тела.

Передозировка

Симптомы: усиление выраженности побочных эффектов.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Винпоцетин

По результатам клинических исследований лекарственного взаимодействия с β -адреноблокаторами (пиндолол), кломипрамидом, глибенкламидом, дигоксином, гидрохлоротиазидом и аценокумаролом не обнаружено.

Метилдопа может усиливать гипотензивное действие винпоцетина, поэтому при их одновременном применении требуется систематический контроль АД. Несмотря на отсутствие клинических данных, одновременное применение со средствами, влияющими на центральную нервную систему, антикоагулянтами и антиаритмиками следует проводить с осторожностью.

Пирацетам

Гормоны щитовидной железы

При одновременном применении пирацетама и экстракта щитовидной железы (трийодтиронин + тироксин) отмечались спутанность сознания, раздражительность и нарушение сна.

Аценокумарол

Согласно опубликованному слепому клиническому исследованию у пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г/сут не влияет на дозу аценокумарола, необходимую для достижения международного нормализованного отношения, равного 2,5-3,5, но по сравнению с эффектами одного лишь аценокумарола, добавление пирацетама в дозе 9,6 г/сут значительно снижает агрегацию тромбоцитов, высвобождение β -тромбоглобина, концентрацию фибриногена и фактора Виллебранда (VIII: C; VIII: vW: Ag; VIII: vW: RCo), а также вязкость цельной крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под влиянием других

лекарственных препаратов низкая, поскольку 90% пирацетама выводится в неизмененном виде с мочой.

В концентрациях 142, 426 и 1422 мг/мл пирацетам не ингибирует изоферменты цитохрома P450 (CYP 1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11) in vitro.

В концентрации 1422 мг/мл наблюдалось минимальное ингибирование изофермента CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако значения константы ингибирования (K_i), вероятно, выходят далеко за пределы концентрации 1422 мг/мл. Таким образом, метаболические взаимодействия пирацетама с другими препаратами маловероятны.

Противосудорожные средства

Прием пирацетама в дозе 20 г/сут на протяжении 4 недель у пациентов с эпилепсией, принимавших постоянные дозы противоэпилептических препаратов (карбамазепин, фенитоин, фенobarбитал и вальпроевая кислота), не изменял их максимальную и минимальную концентрацию.

Алкоголь

Одновременный прием с алкоголем не влиял на концентрацию пирацетама в плазме; при приеме 1,6 г пирацетама концентрация этанола в плазме не изменялась.

Особые указания

Наличие синдрома пролонгированного интервала QT и прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля ЭКГ. В случае непереносимости лактозы следует учитывать, что одна капсула содержит 110 мг лактозы моногидрата.

Вследствие антиагрегантного эффекта, пирацетам не следует назначать пациентам с геморрагическим инсультом и следует назначать с осторожностью пациентам с другими тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений (например, при язве желудка), нарушениями гемостаза, у пациентов с хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства, у пациентов, принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в т.ч. низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

Влияние на способность управлять транспортными средствами,

механизмами

Исследования о влиянии на способность управлять транспортными средствами не проводились. При возникновении нежелательных реакций со стороны нервной системы следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе со сложными механизмами.

Форма выпуска

По 10 или 15 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или пленки ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 60, 90 капсул в банку полимерную из полиэтилентерефталата с крышкой из полипропилена.

По 3, 5 контурных ячейковых упаковок по 10 капсул или по 2, 4, 6 контурных ячейковых упаковок по 15 капсул, или по 1 банке полимерной вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С в упаковке производителя.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО «Канонфарма продакшн», Российская Федерация

141100, Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: +7 (495) 797-99-54.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

Получить дополнительные данные о препарате, направить претензию на его качество, безопасность, сообщить о нежелательных лекарственных реакциях можно по телефону: 8 (800) 700-59-99 (бесплатная линия 24 часа) или на сайте

www.canonpharma.ru в разделе «Политика в области качества» – «Безопасность препаратов».

Производитель

ЗАО «Канонфарма продакшн», Российская Федерация

Производство готовой лекарственной формы:

Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, стр. 105Б, к. 16

Первичная упаковка:

Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, стр. 105Б, к. 16

Вторичная (потребительская) упаковка:

Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, стр. 105Б, к. 16

Выпускающий контроль качества:

Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, стр. 105Б, к. 11

Тел.: +7 (495) 797-99-54.

www.canonpharma.ru