

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Винпоцетин-АКОС, 5 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: винпоцетин.

1 мл раствора содержит 5 мг винпоцетина.

1 ампула (2 мл) содержит 10 мг винпоцетина.

1 ампула (5 мл) содержит 25 мг винпоцетина.

1 ампула (10 мл) содержит 50 мг винпоцетина.

Вспомогательные вещества, наличие которых нужно учитывать в составе лекарственного препарата: бензиловый спирт, сорбитол (сорбит), натрия дисульфит (натрия метабисульфит) (см. разделы 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Бесцветный или зеленовато-желтого, или желтовато-зеленого цвета прозрачный раствор.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Неврология: транзиторная ишемическая атака, ишемический инсульт, симптоматическая терапия последствий инсульта, сосудистая деменция, атеросклероз сосудов головного мозга, посттравматическая и гипертензивная энцефалопатия, вертебробазилярная недостаточность. Уменьшение выраженности неврологических и психических нарушений, связанных с нарушениями кровоснабжения головного мозга.

Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сетчатки и сосудистой оболочки глаза (например, тромбоз или обструкция центральной артерии или вены сетчатки).

Отология: снижение слуха при острой сосудистой патологии, токсическом (лекарственном) поражении или другого происхождения (идиопатического, вследствие шумового воздействия), болезни Меньера и шума в ушах.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Обычная начальная суточная доза: 20 мг в 500 мл инфузионного раствора. В зависимости от переносимости, в течение 2-3 дней дозу можно увеличить не более чем до 1 мг/кг/день. Средняя продолжительность лечения 10-14 дней.

Средняя суточная доза при массе тела 70 кг – 50 мг в 500 мл инфузионного раствора.

После завершения курса инфузионной терапии рекомендуется продолжить терапию пероральными формами.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной и печеночной недостаточностью

При заболеваниях печени и почек коррекции дозы не требуется.

Дети

Применение препарата Винпоцетин-АКОС у детей и подростков до 18 лет противопоказано.

Способ применения

Препарат предназначен только для внутривенной капельной инфузии, вводить медленно (скорость инфузии не должна превышать 80 капель/мин)!

Запрещается вводить внутримышечно!

Запрещается вводить внутривенно без разведения!

Для приготовления инфузии можно использовать физиологический раствор или растворы, содержащие декстрозу (Салсол, Рингер, Риндекс, Реомакродекс). Инфузионный раствор с препаратом Винпоцетин-АКОС следует использовать в первые 3 часа после приготовления.

Информацию о несовместимости см. в разделе 6.2.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к винпоцетину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- острая фаза геморрагического инсульта;
- тяжелая форма ишемической болезни сердца;
- тяжелые нарушения ритма сердца;
- беременность, период грудного вскармливания;
- непереносимость фруктозы или недостаточность фермента фруктозо-1,6-дифосфатазы;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Повышенное внутричерепное давление, прием антиаритмических препаратов, нарушения ритма сердца, синдром удлиненного интервала QT.

Особые указания

Препарат Винпоцетин-АКОС можно начинать принимать только после тщательного анализа пользы и рисков, сопряженных с его применением при наличии у пациента повышенного внутричерепного давления, аритмии или синдрома удлинённого интервала QT, а также на фоне применения антиаритмических препаратов.

Наличие синдрома удлинённого интервала QT и прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля ЭКГ.

В связи с тем, что в препарате содержится небольшое количество сорбитола, необходимо контролировать содержание сахара в крови у пациентов во время лечения.

Препарат Винпоцетин-АКОС противопоказан пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы.

Содержащийся в составе препарата бензиловый спирт может вызывать токсические и анафилактические реакции. Содержащийся в составе препарата натрия дисульфит может в редких случаях вызывать серьезные реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

Одновременное применение винпоцетина и альфа-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 назначении с препаратами центрального, противоаритмического и антикоагулянтного действия.

Данный препарат химически несовместим с гепарином, поэтому их нельзя смешивать, но можно проводить одновременную терапию антикоагулянтами.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Винпоцетин проникает через плацентарный барьер, но его концентрация в плаценте и в крови плода ниже, чем в крови беременной. Винпоцетин противопоказан при беременности. Тератогенное и эмбриотоксическое действие не выявлено. В исследованиях на животных при введении больших доз возникали плацентарные кровотечения и спонтанные аборт, вероятно, в результате усиления плацентарного кровотока.

Лактация

Винпоцетин проникает в грудное молоко. В исследованиях с применением меченого винпоцетина радиоактивность грудного молока была в десять раз выше, чем в крови матери. В течение часа в грудное молоко проникает 0,25 % принятой дозы препарата. Поскольку винпоцетин проникает в грудное молоко, а данные о его влиянии на организм новорожденного отсутствуют, применение препарата во время грудного вскармливания противопоказано.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Данные отсутствуют.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные лекарственные реакции (НЛР)/нежелательные явления (НЯ) представлены по системно-органным классам в соответствии с классификацией MedDRA и с частотой возникновения: нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Редко: тромбоцитопения, агглютинация эритроцитов.

Очень редко: анемия.

Нарушения со стороны иммунной системы

Очень редко: реакции гиперчувствительности.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

Редко: сахарный диабет, гиперхолестеринемия.

Очень редко: анорексия.

Нарушения психики

Нечасто: эйфория.

Редко: беспокойство.

Очень редко: депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы

Редко: головная боль, головокружение, односторонний парез, сонливость.

Очень редко: тремор, потеря сознания, гипотония, предобморочное состояние.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: гифема, дальность зрения, близорукость, затуманенность зрения.

Очень редко: гиперемия конъюнктивы, отек соска зрительного нерва, диплопия.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения

Редко: нарушения слуха, гиперacusis, гипоacusis, вертиго.

Очень редко: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

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

Очень редко: фибрилляция предсердий, сердечная недостаточность.

Нарушения со стороны сосудов

Редко: повышение артериального давления, снижение артериального давления, «приливы».

Очень редко: лабильность артериального давления, венозная недостаточность.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Редко: дискомфорт в эпигастрии, сухость во рту, тошнота.

Очень редко: повышенное слюноотделение, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: эритема, гипергидроз, крапивница.

Очень редко: дерматит, зуд.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Нечасто: чувство жара.

Редко: астения, воспаление и тромбоз в месте введения, чувство дискомфорта в грудной клетке.

Лабораторные и инструментальные данные

Нечасто: снижение артериального давления.

Редко: повышение артериального давления, удлинение интервала QT на электрокардиограмме, депрессия сегмента ST на электрокардиограмме, повышение концентрации мочевины сыворотки крови.

Очень редко: увеличение активности лактатдегидрогеназы, удлинение интервала PR электрокардиограммы, изменения на электрокардиограмме.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7-495-698-45-38, +7-499-578-02-30

Факс: +7-495-698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

<https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Данные о передозировке винпоцетином отсутствуют. Известно, что применение винпоцетина в дозе 1 мг/кг массы тела может считаться безопасным. В связи с отсутствием данных следует избегать применения винпоцетина в более высоких дозах.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: психостимулирующее и ноотропное средство.

Код АТХ: N06BX18.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Механизм действия винпоцетина складывается из нескольких элементов: он улучшает мозговой кровоток и метаболизм головного мозга, оказывает благоприятное воздействие на реологические свойства крови.

Нейропротективное действие реализуется за счет снижения неблагоприятного цитотоксического влияния возбуждающих аминокислот. Блокирует потенциал зависимые Na^+ и Ca^{2+} каналы и NMDA- и AMPA-рецепторы. Повышает нейропротективное действие аденозина. Винпоцетин стимулирует метаболизм головного мозга: он увеличивает захват и потребление глюкозы и кислорода. Повышает толерантность к гипоксии; увеличивает транспорт глюкозы, единственного источника энергии для ткани головного мозга, через гематоэнцефалический барьер; смещает метаболизм глюкозы в сторону энергетически более выгодного аэробного пути. Селективно ингибирует Ca^{2+} -кальмодулинзависимую цГМФ-фосфодиэстеразу; повышает содержание циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) и циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) головного мозга, концентрацию АТФ и соотношение АТФ/АМФ в тканях головного мозга; усиливает обмен серотонина и норадреналина в головном мозге, стимулирует норадренергическую нейромедиаторную систему, а также оказывает антиоксидантное действие; в результате всех этих эффектов винпоцетин оказывает церебропротективное действие.

Улучшает микроциркуляцию в головном мозге за счет ингибирования агрегации тромбоцитов, снижения патологически повышенной вязкости крови, повышения

способности эритроцитов к деформации и ингибирования захвата аденозина; способствует переходу кислорода в клетки за счет снижения к нему сродства эритроцитов. Избирательно увеличивает мозговой кровоток за счет увеличения мозговой фракции сердечного выброса, снижения церебрального сосудистого сопротивления без существенного влияния на системные показатели кровообращения (артериальное давление (АД), сердечный выброс, частоту сердечных сокращений, общее периферическое сосудистое сопротивление); не вызывает эффект «обкрадывания». На фоне применения винпоцетина улучшается кровоснабжение поврежденных (но еще не некротизированных) участков ишемии с низкой перфузией («обратный эффект обкрадывания»).

5.2. Фармакокинетические свойства

Распределение

В доклинических исследованиях введения радиоактивно меченого винпоцетина внутрь он определялся в наивысших концентрациях в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечается через 2-4 часа после введения. Количество радиоактивного изотопа в головном мозге не превышало такового в крови. Связь с белками в организме человека - 66 %. Биодоступность около 7 %. Объем распределения составляет $246,7 \pm 88,5$ л, что свидетельствует о значительном связывании с тканями. Клиренс винпоцетина (66,7 л/ч) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/ч), что указывает на внепеченочный метаболизм.

Биотрансформация

Основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминовая кислота (АВК), доля которой у человека составляет 25-30 %. После приема винпоцетина внутрь площадь под кривой «концентрация–время» АВК в 2 раза больше таковой после внутривенного введения. Это свидетельствует о том, что АВК образуется в процессе метаболизма первого прохождения винпоцетина. Другими известными метаболитами являются гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, дигидроксид-АВК-глицинат, а также их конъюгаты с глюкуронидами и/или сульфатами. В доклинических исследованиях показано, что в неизменном виде винпоцетин выделяется в небольшом количестве. Коррекция дозы у пациентов с заболеваниями печени и почек не требуется, так как винпоцетин не кумулирует.

Элиминация

После многократного приема внутрь в дозе 5 или 10 мг кинетика винпоцетина носит линейный характер. Равновесная концентрация составляет $1,2 \pm 0,27$ нг/мл и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл соответственно. Период полувыведения у человека равен $4,83 \pm 1,29$ ч. В исследованиях с радиоактивно меченым препаратом установлено, что выделение осуществляется почками

и через кишечник в соотношении 60:40. В доклинических исследованиях наибольшая радиоактивность определялась в желчи, однако не найдено подтверждения значительной энтерогепатической циркуляции. Аповинкаминная кислота выводится почками путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от принятой дозы и пути введения винпоцетина.

Фармакокинетика у особых групп пациентов (возраст, сопутствующие заболевания)

Выявлено, что фармакокинетика винпоцетина у пожилых пациентов значительно не отличается от таковой у молодых пациентов, кумуляция препарата отсутствует. Поэтому винпоцетин можно назначать пациентам с нарушениями функции печени и почек длительно и в обычных дозах.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Аскорбиновая кислота

Бензиловый спирт

Сорбитол (сорбит)

Винная кислота

Натрия дисульфит (натрия метабисульфит)

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Препарат химически несовместим с гепарином, поэтому эти два лекарственных средства нельзя смешивать в одном шприце или системе для внутривенного капельного введения. Препарат также несовместим с растворами для инфузий, содержащими аминокислоты, поэтому препарат Винпоцетин-АКОС в процессе инфузионной терапии нельзя вводить вместе с растворами, содержащими аминокислоты.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл, 5 мл или 10 мл в ампулы светозащитного стекла марки СНС-1 или СНС-3.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки с 5 ампулами помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению, скарификатор ампульный.

При использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой скарификатор ампульный не вкладывают.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Открытое акционерное общество "Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Телефон: 8-800-600-00-80

e-mail: contact@ksintez.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Тел: 8-800-600-00-80

e-mail: contact@ksintez.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Винпоцетин-АКОС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети Интернет.