

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

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

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: винпоцетин.

Каждый мл концентрата для приготовления раствора для инфузий содержит 5 мг винпоцетина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сорбитол, бензиловый спирт, натрий (см. разделы 4.3, 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Прозрачная бесцветная или слегка зеленоватая жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Винпоцетин показан к применению у взрослых пациентов в возрасте от 18 лет.

- Неврология: транзиторная ишемическая атака, ишемический инсульт, симптоматическая терапия последствий инсульта, сосудистая деменция, атеросклероз сосудов головного мозга, посттравматическая и гипертензивная энцефалопатия, вертебробазилярная недостаточность. Для уменьшения 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 (2 ампулы по 2 мл) 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 по схеме: 1 таблетка препарата винпоцетин 3 раза в сутки (30 мг/сут).

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек и печени

При заболевании печени и почек коррекции дозы не требуется.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Винпоцетин у детей и подростков от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

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

Запрещается вводить внутримышечно!

Запрещается вводить внутривенно без разведения!

Инструкции по приготовлению лекарственного препарата перед применением см. в разделе 6.6.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к винпоцетину и/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 кормления грудью и применение у женщин с сохраненной детородной функцией, не использующих надежный метод контрацепции;
- непереносимость фруктозы или недостаточность фермента фруктозо-1,6-дифосфатазы;
- детский возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Повышенное внутричерепное давление, прием антиаритмических препаратов, нарушения

ритма сердца, синдром удлиненного интервала QT.

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

Наличие синдрома удлиненного интервала QT и прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля электрокардиограммы.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит сорбитол (E420) 80 мг/1 мл, который является источником фруктозы. Следует учитывать аддитивный эффект при совместном приеме препаратов, содержащих сорбитол (или фруктозу), с потреблением сорбитола (или фруктозы) в пищевом рационе. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы не следует принимать данный препарат. Перед назначением этого лекарственного средства у каждого пациента должен быть взят подробный анамнез в отношении симптомов наследственной непереносимости фруктозы.

Препарат содержит бензиловый спирт 10 мг в 1 мл, который может вызвать аллергические реакции. Большие объемы следует применять с осторожностью и только при необходимости, особенно у пациентов с нарушением функции печени или почек из-за риска накопления и токсичности (метаболический ацидоз).

Препарат содержит натрия дисульфит (E223) 1 мг в 1 мл, который в редких случаях может вызывать серьезные реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Препарат содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) в каждой ампуле, то есть по сути не содержит натрия.

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

Во время беременности и в период грудного вскармливания, а также у женщин с сохраненной детородной функцией, не использующих надежный метод контрацепции, применение винпоцетина противопоказано.

Беременность

Винпоцетин проникает через плацентарный барьер, но его концентрация в плаценте и в крови плода ниже, чем в крови беременной. Исследования на животных показали репродуктивную токсичность, включая пороки развития у крыс. 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 о влиянии винпоцетина на способность к управлению транспортными средствами и работу с механизмами отсутствуют.

4.8. Нежелательные реакции

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции приведены ниже по системно-органным классам в соответствии с классификацией MedDRA и с частотой возникновения: *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* ($< 1/10000$); *частота неизвестна* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные реакции
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы	Редко	Тромбоцитопения, агглютинация эритроцитов
	Очень редко	Анемия
Нарушения со стороны иммунной системы	Очень редко	Реакции гиперчувствительности
Нарушения метаболизма и питания	Редко	Гиперхолестеринемия, сахарный диабет
	Очень редко	Анорексия
Психические нарушения	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, дальносторкость, близорукость, затуманенность зрения
	Очень редко	Гиперемия конъюнктивы, отек соска зрительного нерва, диплопия
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта	Редко	Нарушения слуха, гиперacusia, гипоacusia, вертиго
	Очень редко	Шум в ушах
Нарушения со стороны сердца	Редко	Ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, аритмия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения
	Очень редко	Сердечная недостаточность, фибрилляция предсердий
Нарушения со стороны сосудов	Редко	Снижение артериального давления, повышение артериального давления, «приливы»

	Очень редко	Лабильность артериального давления, венозная недостаточность
Желудочно-кишечные нарушения	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 нарушения и реакции в месте введения	Нечасто	Чувство жара
	Редко	Астения, чувство дискомфорта в грудной клетке, воспаление и тромбоз в месте введения
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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.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: психоаналептики; психостимуляторы, средства, применяемые при синдроме дефицита внимания с гиперактивностью, и ноотропные средства; другие психостимуляторы и ноотропные средства.

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 потенциалзависимые Na^+ и Ca^{2+} каналы 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, 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 приема внутрь.

Количество радиоактивного изотопа в головном мозге не превышало такового в крови. Связь с белками в организме человека - 66 %. Биодоступность при приеме внутрь - 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 внепочечный 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, дигидрокси-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 $4,83 \pm 1,29$ часов. 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. АВК 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 значимо 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

Сорбитол

Винная кислота

Бензиловый спирт

Натрия дисульфит

Аскорбиновая кислота

Натрия гидроксида раствор 1 М

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.6.

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, концентрат для приготовления раствора для инфузий, 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 защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2, 5 или 10 мл препарата в ампулы светозащитного нейтрального стекла с цветной точкой и насечкой или с цветным кольцом излома. На ампулы дополнительно может наноситься одно цветное кольцо.

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

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

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

Для приготовления инфузии можно использовать физиологический раствор или растворы, содержащие декстрозу (Салсол, Рингер, Риндекс, Реомакродекс).

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

ООО «Атолл»

445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

ООО «Озон»

445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Винпоцетин доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>.