

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

Винпоцетин, 5 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: винпоцетин.

Каждая таблетка содержит 5,0 мг винпоцетина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза, сахароза (см. раздел 4.4).

Полный список вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Круглые, плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, с риской и фаской. Линия разлома (риска) предназначена лишь для разламывания с целью облегчения проглатывания, а не для разделения на равные дозы.

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

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

- Неврология: симптоматическая терапия последствий ишемического инсульта, вертебробазилярной недостаточности, сосудистой деменции, атеросклероза сосудов головного мозга, посттравматической и гипертонической энцефалопатии. Для уменьшения выраженности неврологических и психических нарушений, связанных с нарушениями кровоснабжения головного мозга.

-Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сетчатки и сосудистой оболочки глаза.

- Отология: снижение слуха перцептивного типа, болезнь Меньера, ощущение шума в ушах.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

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.

Особые группы*Пациенты с нарушением функции почек и печени*

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

Дети

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

Способ применения

Внутрь, после еды.

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 кормления грудью и применение у женщин с сохраненной детородной функцией, не использующих надежный метод контрацепции.
- Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат.
- Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Синдром удлиненного интервала QT, прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT.

Контроль ЭКГ

Наличие синдрома пролонгированного интервала QT и прием препаратов, вызывающих удлинение интервала QT, требует периодического контроля электрокардиограммы (ЭКГ).

Вспомогательные вещества

Препарат Винпоцетин содержит сахарозу. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат.

Препарат Винпоцетин содержит лактозу. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

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 и 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, противоритмического и антикоагулянтного действия.

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 в плаценте и в крови плода его концентрация 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 кровоснабжения. Во время беременности применение винпоцетина противопоказано.

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 1 часа в грудное молоко проникает 0,25% принятой дозы препарата. Поскольку винпоцетин проникает в грудное молоко, а данные о влиянии винпоцетина на детей грудного возраста отсутствуют, применение его во время грудного вскармливания противопоказано.

Женщины с детородным потенциалом

Женщины с сохраненной детородной функцией должны использовать надежный метод контрацепции во время применения винпоцетина. В противном случае, прием винпоцетина противопоказан.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Учитывая наличие побочных эффектов со стороны нервной системы, на период лечения следует воздержаться от управления автотранспортом и от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8 Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

В ходе клинических исследований наиболее часто нежелательные реакции возникали в следующих системно-органных классах (по классификации Медицинского словаря для регуляторной деятельности), которые приведены в соответствии 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: лейкопения, тромбоцитопения;

Очень редко: анемия, агглютинация эритроцитов.

Нарушения со стороны иммунной системы

Очень редко: реакция гиперчувствительности.

Нарушения метаболизма и питания

Нечасто: гиперхолестеринемия;

Редко: снижение аппетита, анорексия, сахарный диабет.

Психические нарушения

Редко: бессонница, нарушение сна, беспокойство;

Очень редко: эйфория, депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы:

Нечасто: головная боль;

Редко: головокружение, расстройство вкуса, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия;

Очень редко: тремор, спазмы.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: отсек соска зрительного нерва

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Нечасто: вертинго;

Редко: гиперacusia, гипoacusia, шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

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

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто: снижение АД.

Желудочно-кишечные нарушения

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

Редко: боль в эпигастрии, запор, диарея, диспепсия, рвота;

Очень редко: дисфагия, стоматит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: эритема, гипергидроз, кожный зуд, крапивница, сыпь;

Очень редко: дерматит.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко: астения, недомогание, чувство жары;

Очень редко: чувство дискомфорта в грудной клетке, гипотермия.

Лабораторные и инструментальные данные

Нечасто: снижение АД;

Редко: повышение АД, гипертриглицеридемия, депрессия сегмента ST на ЭКГ, уменьшение/увеличение числа эозинофилов, повышение активности «печеночных» ферментов;

Очень редко: уменьшение/увеличение числа лейкоцитов, эритропения, уменьшение тромбинового времени, повышение массы тела.

Сообщения 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 национальную систему 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.

Симптомы

Однократный прием 360 мг винпоцетина не вызывал клинически значимых реакций, в том числе со стороны сердечно-сосудистой системы.

Лечение

Рекомендовано промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия

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, фармакодинамические эффекты

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

Нейропротекторное действие реализуется за счет снижения неблагоприятного цитотоксического влияния возбуждающих аминокислот. Блокирует потенциалзависимые Na^+ и Ca^{2+} каналы и NMDA- и AMPA-рецепторы. Повышает нейротективное 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 обратного захвата аденозина; способствует переходу кислорода в клетки за счет снижения сродства к нему 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

Абсорбция

Винпоцетин быстро всасывается после приема внутрь и через 1 ч достигает максимальной концентрации в крови (C_{max}). Всасывание происходит главным образом в проксимальных отделах кишечника. Не подвергается метаболизму при прохождении через стенку кишечника.

Распределение

В доклинических исследованиях введения радиоактивного меченного 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 такого в крови.

Связь с белками в организме человека – 66%. Объем распределения составляет $246,7 \pm 88,5$ л, что свидетельствует о значительном связывании с тканями.

Биодоступность при приеме внутрь – 7%. Клиренс составляет 66,7%, что превышает плазменный объем печени (50 л/ч), метаболизм преимущественно внепеченочный.

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 глюкуронидами и/или сульфатами. В доклинических исследованиях выявлено, что в

неизменном виде винпоцетин выделяется в небольшом количестве.

При заболеваниях печени и почек коррекция дозы не требуется в связи с особенностью метаболизма винпоцетина – отсутствует кумуляция.

Элиминация

При многократном приеме в дозе 5 и 10 мг кинетика винпоцетина линейная. Равновесные концентрации составляли $1,2 \pm 0,27$ нг/мл и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл соответственно. Период полувыведения у человека – $4,83 \pm 1,29$ ч. В исследованиях с радиоактивной меткой препарат выводится почками и через кишечник в пропорции 60:40. В доклинических исследованиях значительная часть радиоактивности выявлялась в желчи, однако значимая кишечно-печеночная циркуляция не найдена. Аповинкаминовая кислота выводится почками путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от прямой дозы и пути введения винпоцетина.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста, пациенты с нарушением функции печени и почек

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

- сахароза (сахар белый)
- лактозы моногидрат (сахар молочный)
- повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский 12600±2700 или К-17)
- кальция стеарат
- крахмал картофельный

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении лекарственного препарата

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

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10, 15, 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 20, 30, 50, 60, 90, 100 таблеток в банки полимерные из полиэтилена или полипропилена с крышками из полиэтилена или полипропилена.

По 1 банке или 2, 3, 5, 6, 9, 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или по 2,4,6 контурных ячейковых упаковок по 15 таблеток или по 3, 5 контурных ячейковых упаковок по 20 таблеток с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

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

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ПАО «Биосинтез»

440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4.

Телефон: +7(8412) 57-72-49, 8-800-100-40-05

Факс: +7(8412) 57-72-49

e-mail: Biosintez.Info@sunpharma.com

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ПАО «Биосинтез»

440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4.

Телефон: +7(8412) 57-72-49, 8-800-100-40-05

Факс: +7(8412) 57-72-49

e-mail: Biosintez.Hotline@sunpharma.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ/ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ (ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА (ЕСЛИ ПРИМЕНИМО)

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