

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 5,0 мг винпоцетина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий, натрия дисульфит (натрия пиросульфит) (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Бесцветная или слегка окрашенная прозрачная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Винпоцетин показан к применению у взрослых 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;
- 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);
- болезнь Меньера и шум 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 нарушением функции почек

При заболеваниях почек коррекции дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

При заболеваниях печени коррекции дозы не требуется.

Дети

Применение препарата Винпоцетин 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!

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

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;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- при внутричерепной гипертензии;
- при одновременном применении с противоаритмическими лекарственными средствами;
- при нарушении ритма сердца;
- при синдроме удлинённого интервала QT или одновременном применении с препаратами, удлиняющими интервал QT.

Особые указания

Препарат Винпоцетин можно начинать применять 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, требуют периодического контроля электрокардиограммы (ЭКГ).

Вспомогательные вещества

Натрия дисульфит

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

Натрий

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

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

Одновременное применение винпоцетина и альфа-метилдопы иногда вызывало некоторое усиление гипотензивного эффекта, поэтому при таком лечении требуется регулярный контроль артериального давления (АД).

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. 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 о влиянии винпоцетина на способность к управлению транспортными средствами и работу с механизмами отсутствуют. При возникновении нежелательных реакций со стороны нервной системы следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе с движущимися механизмами.

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 ($\geq 1/100$,

но < 1/10), нечасто ($\geq 1/1000$, но < 1/100), редко ($\geq 1/10000$, но < 1/1000), очень редко (< 1/10000), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нечасто	Редко	Очень редко
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы</i>		
	тромбоцитопения, агглютинация эритроцитов	анемия
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>		
		реакции гиперчувствительности
<i>Нарушения со стороны метаболизма и питания</i>		
	сахарный диабет, гиперхолестеринемия	анорексия
<i>Психические нарушения</i>		
эйфория	беспокойство	депрессия
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>		
	головная боль, головокружение, односторонний парез, сонливость	тремор, потеря сознания, гипотония, предобморочное состояние
<i>Нарушения со стороны органа зрения</i>		
	гифема, дальность зрения, близорукость, затуманенность зрения	гиперемия конъюнктивы, отек соска зрительного нерва, диплопия
<i>Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта</i>		
	нарушение слуха, гиперакузия, гипобакузия, вертиго	шум в ушах
<i>Нарушения со стороны сердца</i>		
	ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, аритмия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения	фибрилляция предсердий, сердечная недостаточность
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>		
	повышение АД, снижение АД, «приливы»	лабильность АД, венозная недостаточность
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>		
	дискомфорт в эпигастрии, сухость во рту, тошнота	повышенное слюноотделение, рвота
<i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i>		
	эритема, гипергидроз, крапивница	дерматит, зуд
<i>Общие нарушения и реакции в месте введения</i>		
чувство жара	астения, воспаление и тромбоз в месте введения, дискомфорт в грудной	

Нечасто	Редко	Очень редко
	клетке	
<i>Лабораторные и инструментальные данные</i>		
снижение АД	повышение АД, удлинение интервала QT на ЭКГ, депрессия сегмента ST на ЭКГ, повышение концентрации мочевины сыворотки крови	увеличение активности лактатдегидрогеназы, удлинение интервала PR ЭКГ, изменения на ЭКГ

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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»:
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 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 аденозинтрифосфат (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 (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/час) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/час), 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, 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 мг 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 составляет $4,83 \pm 1,29$ час. В исследованиях с радиоактивно меченым препаратом установлено, что выведение 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 в обычных дозах.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Аскорбиновая кислота

Янтарная кислота

Натрия дисульфит (пиросульфит натрия)

Натрия хлорид

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

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

Препарат Винпоцетин химически несовместим с гепарином, поэтому эти два лекарственных средства нельзя смешивать в одном шприце или системе для внутривенного капельного введения.

Препарат Винпоцетин также несовместим с растворами для инфузий, содержащими аминокислоты, поэтому препарат Винпоцетин в процессе инфузионной терапии нельзя вводить вместе с растворами, содержащими аминокислоты.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

Приготовленный раствор

Инфузионный раствор с препаратом Винпоцетин следует использовать в первые 3 часа после изготовления.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в оригинальной упаковке (пачке) для защиты от света.

Условия хранения после приготовления инфузионного раствора с препаратом Винпоцетин см. в разделе 6.3.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл, 4 мл, 5 мл или 10 мл препарата в ампулы медицинского стекла 1-го гидролитического класса или в ампулы нейтрального стекла марки НС-3. Ампулы используются с насечкой/надрезом и точкой или кольцом излома.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1, 2 или 4 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому 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

Приготовление

Для приготовления инфузии можно использовать физиологический раствор или растворы, содержащие декстрозу.

Утилизация

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

Адрес: Российская Федерация, 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: +7 (495) 640-25-28

Электронная почта: reception@promomed.pro

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

Адрес: Российская Федерация, 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: 8 800 222 95 63; 8 800 777 86 04 (круглосуточно)

Электронная почта: hot_line@promomed.pro

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://eec.eaeunion.org/>