

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Кавинтазол, таблетки, 5 мг

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: винпоцетин.

Каждая таблетка содержит 5 мг винпоцетина.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. разделы 4.3. и 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки

Таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы с фаской и риской.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Кавинтазол показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет.

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

Режим дозирования

Взрослым стандартная доза составляет 5-10 мг 3 раза в сутки (15-30 мг/сут).

Начальная суточная доза составляет 15 мг. Максимальная суточная доза — 30 мг.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной и печеночной недостаточностью

Коррекция дозы при нарушениях функции почек или печени не требуется.

Дети

Безопасность и эффективность применения Кавинтазола у детей в возрасте до 18 лет на данный момент не установлены.

Данные отсутствуют.

Способ применения:

Внутрь, после приема пищи.

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;
- Детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований);
- Дефицит лактазы, непереносимость галактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Следуют соблюдать осторожность при назначении Винпоцетина пациентам, принимающим гипотензивные средства или препараты, удлиняющие интервал QT (лоратадин, терфенадин, эритромицин, пробукол).

Особые указания

При синдроме удлинённого интервала QT или одновременном применении средств, удлиняющих интервал QT, следует осуществлять ЭКГ-мониторинг.

Вспомогательные вещества

Препарат Кавинтазол содержит лактозу. Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Женщины с детородным потенциалом

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

Беременность

Применение препарата Кавинтазол при беременности противопоказано. 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 аборт (предположительно вследствие увеличения плацентарного кровотока).

Лактация

Применение препарата Кавинтазол при беременности противопоказано. 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. Винпоцетин проникает в грудное молоко. Не следует применять в период кормления грудью или следует прекратить грудное вскармливание при лечении винпоцетином. При решении об отмене грудного вскармливания или отказа от лечения винпоцетином следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины. Поскольку винпоцетин проникает в грудное молоко и опыт его применения у детей отсутствует, применение в период грудного вскармливания противопоказано.

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

Исследования о влиянии на способность управлять транспортными средствами не проводились.

4.8 Нежелательные реакции

Табличное 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 ($< 1/10000$).

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные реакции
	Редко	Лейкопения, тромбоцитопения
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы	Очень редко	Анемия, агглютинация эритроцитов
Нарушения со стороны иммунной системы	Очень редко	Реакции 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	Отек соска зрительного нерва
	Очень редко	Гиперемия конъюнктивы
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта	Нечасто	Вертиго
	Редко	Гиперакузия, гипобакузия, шум в ушах
Нарушения со стороны сердца	Редко	Ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения
	Очень редко	Аритмия, фибрилляция предсердий
Нарушения со стороны сосудов	Нечасто	Снижение АД
	Редко	Повышение АД, «приливы», тромбофлебит
	Очень редко	Лабильность АД
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	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 жара
	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

или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

Случаи передозировки не зарегистрированы. По данным литературы применение 60 мг винпоцетина в сутки безопасно. Однократный пероральный прием винпоцетина в дозе 360 мг не вызывает клинически значимых сердечно-сосудистых и прочих реакций.

Лечение

Рекомендовано промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Психоналептики; психостимуляторы, средства, применяемые при синдроме дефицита внимания с гиперактивностью, и ноотропные средства; другие психостимуляторы и ноотропные средства.

Код АТХ: N06BX18.

Механизм действия

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 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

Абсорбция

Винпоцетин быстро абсорбируется, после приема внутрь максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 1 ч. Абсорбируется преимущественно в проксимальном отделе кишечника. При прохождении через стенку кишечника не подвергается метаболизму.

Распределение

При пероральном введении радиоактивно меченого винпоцетина крысам наибольшая радиоактивность обнаруживалась в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечалась через 2-4 ч. после введения. Концентрация в головном мозге не превышала значений, обнаруженных в крови.

У человека связь с белками плазмы составляет 66 %. Биодоступность около 7 %. Объем распределения ($246,7 \pm 88,5$) л, что свидетельствует о высоком связывании с тканями. Общий клиренс (66,7 л/ч) превышает скорость печеночного кровотока (50 л/ч), что указывает на внепеченочный метаболизм.

Биотрансформация

Основным метаболитом является аповинкаминовая кислота (АВК), составляющая 25-30 % от исходного соединения. Площадь под кривой «концентрация-время» АВК после приема внутрь вдвое превышает такую при внутривенном введении. Таким образом, винпоцетин подвержен выраженному эффекту «первого прохождения» через печень. К прочим метаболитам относят-

ся: гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, АВК-диоксиглицинат и их конъюгаты (сульфаты и (или) глюкурониды). Выведение неизмененного винпоцетина низкое (несколько процентов).

При нарушении функции печени или почек коррекция дозы не требуется, поскольку винпоцетин не кумулирует.

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 выводился почками и через кишечник в пропорции 60:40. В доклинических исследованиях значительная часть радиоактивности выявлялась в желчи, но значимая кишечно-печеночная циркуляция не найдена. Аповинкаминовая кислота выводится почками путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения зависит от принятой дозы и пути введения винпоцетина.

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

Поскольку винпоцетин предназначен в первую очередь для лечения пожилых, необходимо учитывать замедление распределения и метаболизма, а также выведения у этой возрастной группы, особенно при длительном применении. По результатам клинических исследований установлено, что кинетика винпоцетина у пожилых существенно не отличается от молодых, кумуляции не происходит.

Почечная и печеночная недостаточность

При нарушениях функции печени и почек кумуляция не отмечается, что позволяет проводить длительную терапию.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат (сахар молочный)

Крахмал картофельный

Повидон (поливинилпирролидон)

Магния стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении лекарственного препарата

Хранить в сухом защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 20, 30, 40, 50, 60, 80, 100 таблеток в банки полимерные с навинчиваемыми крышками.

Каждую банку или 1, 2, 3, 4, 5, 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация.

АО «Уралбиофарм»

Адрес: 620026, Свердловская область, г.о. город Екатеринбург,

г. Екатеринбург, ул. Куйбышева, стр. 60

Телефон: +7 343 254 01 93.

Электронная почта: ubf@ubf.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация.

АО «Уралбиофарм»

Адрес: 620026, Свердловская область, г. Екатеринбург,
ул. Куйбышева, стр. 60.

Телефон: +7 343 254 02 45, +7 343 254 01 93.

Электронная почта: ubf@ubf.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Кавинтазол доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC.