

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ВІНПОЦЕТИН-АСТРАФАРМ
(VINPROSETINE-ASTRAPHARM)

Склад:

діюча речовина: vinprocetine;

1 таблетка містить вінпоцетину 5 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль кукурудзяний; магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Психостимулюючі та ноотропні засоби. Код АТС N06B X18.

Клінічні характеристики.

Показання.

Неврологія. Для лікування різних форм цереброваскулярної патології: стани після перенесеного порушення мозкового кровообігу (інсульту), вертебробазиллярної недостатності, судинної деменції, церебрального атеросклерозу, посттравматичної і гіпертонічної енцефалопатії. Сприяє зменшенню психічної і неврологічної симптоматики при цереброваскулярній патології.

Офтальмологія. Для лікування хронічної судинної патології судинної оболонки ока та сітківки.

Оториноларингологія. Для лікування старечої туговухості перцептивного типу, хвороби Мен'єра та шуму у вухах.

Противоказання.

Підвищена чутливість до вінпоцетину або до будь-якого компонента препарату. Тяжкий перебіг ішемічної хвороби серця, серцеві аритмії.

Спосіб застосування та дози.

Таблетки застосовують внутрішньо після прийому їжі.

Доза для дорослих становить 5-10 мг 3 рази на добу (15-30 мг).

При захворюваннях печінки та/або нирок особливого підбору дози не потрібно.

Тривалість лікування визначає лікар індивідуально.

Побічні реакції.

З боку крові та лімфатичної системи: рідко – лейкопенія, тромбоцитопенія; дуже рідко – анемія, аглютинація еритроцитів.

З боку імунної системи: дуже рідко – гіперчутливість.

Метаболічні порушення: нечасто – гіперхолестеринемія; рідко – зниження апетиту, анорексія, цукровий діабет.

Психічні розлади: рідко – безсоння, порушення сну, неспокій; дуже рідко – ейфорія, депресія.

З боку нервової системи: нечасто – головний біль; рідко – запаморочення, дисгевзія, ступор, геміпарез, сонливість, амнезія; дуже рідко – тремор, судоми.

З боку органа зору: рідко – набряк соска зорового нерва; дуже рідко – гіперемія кон'юнктиви.

З боку органа слуху та лабіринту: нечасто – вертиго; рідко – гіперакузія, гіпоакузія, шум у вухах.

З боку серцево-судинної системи: нечасто – артеріальна гіпотензія; рідко – ішемія/інфаркт міокарда, стенокардія напруження, брадикардія, тахікардія, екстрасистолія, відчуття серцебиття, артеріальна гіпертензія, припливи, тромбоз флебіт; дуже рідко – аритмії, фібриляція передсердь, коливання артеріального тиску, депресія сегмента ST, подовження інтервалу QT, але наявність причинного зв'язку між такою побічною дією і лікуванням вінпоцетином не доведене, оскільки у природній популяції ці симптоми спостерігаються з такою ж частотою.

З боку травного тракту: нечасто – дискомфорт у животі, сухість у роті, нудота; рідко – біль у животі, запор, діарея, диспепсія, блювання; дуже рідко – дисфагія, стоматит, печія.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: рідко – еритема, гіпергідроз, свербіж, кропив'янка, висипання; дуже рідко - дерматит.

Загальні порушення: рідко – астенія, збільшення маси тіла, загальна слабкість (симптоми можуть бути проявами основного захворювання), відчуття жару, підвищена втомлюваність; дуже рідко – дискомфорт у грудній клітці, гіпотермія.

Лабораторні дослідження: нечасто – зниження артеріального тиску; рідко – підвищення артеріального тиску, підвищення рівня тригліцеридів у крові, депресія сегмента ST на електрокардіограмі, збільшення /зменшення кількості еозинофілів, зміна активності печінкових ферментів; дуже рідко – збільшення /зменшення кількості лейкоцитів, зменшення кількості еритроцитів, зменшення протромбінового часу.

Передозування.

Випадків передозування відзначено не було. Тривале застосування вінпоцетину у добовій дозі 60 мг також безпечне. Навіть одноразовий прийом внутрішньо 360 мг вінпоцетину не спричиняв будь-якого клінічно значущого небажаного ефекту з боку серцево-судинної системи або інших ефектів.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Протипоказаний.

Діти. Дітям препарат не застосовують (через відсутність клінічних даних).

Особливості застосування.

Рекомендується ЕКГ-контроль у разі наявності синдрому подовженого інтервалу QT або при одночасному прийомі лікарського препарату, що сприяє подовженню інтервалу QT.

Препарат містить лактозу, тому його не слід призначати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, дефіцитом лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Репродуктивність. Не впливає на фертильність.

Тератогенної дії не виявлено.

Мутагенність. Вінпоцетин не чинить мутагенної дії.

Канцерогенність. Вінпоцетин не чинить канцерогенної дії.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

При застосуванні препарату можуть відмічатися побічні ефекти з боку центральної нервової системи, тому слід дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування Вінпоцетину-Астрафарм з β -блокаторами (хлоранололом, піндололом), клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або підрохлортіазидом не супроводжувалося будь-якою взаємодією між ними. У поодиноких випадках деякий додатковий ефект спостерігався при одночасному застосуванні \square -метилдопи і вінпоцетину, тому на тлі застосування цієї комбінації препаратів необхідно здійснювати регулярний контроль артеріального тиску.

Хоча дані клінічних досліджень не підтвердили взаємодії, рекомендується дотримуватися обережності у разі одночасного застосування вінпоцетину з лікарськими препаратами, що впливають на центральну нервову систему, а також у разі супутньої антиаритмічної і антикоагулянтної терапії.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка

Вінпоцетин має комплексний механізм дії, сприятливо впливаючи на мозковий кровообіг та церебральний метаболізм, а також покращує реологічні властивості крові.

Вінпоцетин виявляє нейропротективні ефекти: препарат послаблює шкідливу дію цитотоксичних реакцій, спричинених стимулюючими амінокислотами. Препарат інгібує потенціалзалежні Na^+ - та Ca^{2+} - канали, а також рецептори NMDA і AMPA. Препарат посилює нейропротективний ефект аденозину.

Вінпоцетин стимулює церебральний метаболізм: препарат збільшує захоплення глюкози та O_2 і споживання цих речовин тканиною головного мозку. Препарат підвищує стійкість головного мозку до гіпоксії; збільшує транспорт глюкози – виняткового джерела енергії для головного мозку – через гематоенцефалічний бар'єр; зсуває метаболізм глюкози у бік енергетично більш сприятливого аеробного

шляху; вибірково інгібує Ca^{2+} -кальмодулінзалежний фермент цГМФ-фосфодіестеразу (ФДЕ); підвищує рівень цАМФ і цГМФ у головному мозку. Препарат підвищує концентрацію АТФ і співвідношення АТФ /АМФ; посилює обмін норадреналіну і серотоніну у головному мозку; стимулює висхідну норадренергічну систему; має антиоксидантну активність, у результаті дії всіх вищезазначених ефектів вінпоцетин чинить церебропротективну дію.

Вінпоцетин покращує мікроциркуляцію у головному мозку: препарат інгібує агрегацію тромбоцитів, зменшує патологічно підвищену в'язкість крові, збільшує здатність еритроцитів до деформації та інгібує захоплення аденозину; покращує транспорт O_2 у тканинах шляхом зниження афінитету O_2 до еритроцитів.

Вінпоцетин селективно збільшує кровотік у головному мозку: препарат збільшує церебральну фракцію серцевого викиду; знижує судинний опір у головному мозку, не впливаючи на параметри системної циркуляції (артеріальний тиск, серцевий викид, частоту пульсу, загальний периферичний опір); препарат не викликає «ефекту обкрадання». Більш того, на тлі прийому препарату покращується надходження крові у пошкоджені (але ще не некротизовані) ділянки ішемії з низькою перфузією («зворотний ефект обкрадання»).

Фармакокінетика

Вінпоцетин швидко всмоктується, максимальна концентрація у плазмі крові досягається через 1 годину після перорального застосування. Основним місцем всмоктування вінпоцетину є проксимальні відділи травного тракту. З'єднання не зазнає метаболізму у момент проходження через кишкову стінку.

Зв'язування з білками крові становить 66 %. Абсолютна біодоступність вінпоцетину при пероральному прийомі становить 7 %. Об'єм розподілу дорівнює $246,7 \pm 88,5$ л, що означає виражене зв'язування речовини у тканинах. Значення кліренсу вінпоцетину у плазмі крові перевищує його значення у печінці, що вказує на позапечінковий метаболізм з'єднання.

При багаторазовому пероральному застосуванні препарату у дозі 5 мг і 10 мг вінпоцетин демонструє лінійну кінетику. Період напіввиведення становить $4,83 \pm 1,29$ години. Основний шлях виведення препарату здійснюється нирками і через кишечник у співвідношенні 60:40 %.

Основним метаболітом вінпоцетину є аповінкамінова кислота (АВК), яка у людей утворюється у 25-30 %. Після перорального застосування площа під кривою «концентрація-час» АВК у 2 рази перевищує таку після внутрішньовенного введення препарату, що вказує на утворення АВК у процесі пресистемного метаболізму вінпоцетину. Кількість вінпоцетину, що виділилася у незмінену вигляді, становила лише кілька відсотків від прийнятої дози препарату.

Важливою і значущою властивістю вінпоцетину є відсутність необхідності спеціального підбору дози препарату для пацієнтів із захворюваннями печінки або нирок, зважаючи на метаболізм препарату і відсутність кумуляції (накопичення).

Кінетика вінпоцетину у пацієнтів літнього віку суттєво не відрізняється від кінетики вінпоцетину у молодих людей і, крім цього, відсутня кумуляція.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору плоскоциліндричної форми зі скошеними краями і рискою.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 2, 3 або 5 блістерів у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ТОВ «АСТРАФАРМ»

Місцезнаходження.

Україна, 08132, Київська обл., Кієво-Святошинський район, м. Вишневе, вул. Київська, 6.