

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Винпоцетин-АКОС

Регистрационный номер: Р N001925/01

Торговое название: Винпоцетин-АКОС

Международное непатентованное название (МНН): винпоцетин

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: винпоцетин - 5,0 мг;

Вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота – 0,5 мг, бензиловый спирт – 10,0 мг, сорбитол (сорбит) – 100,0 мг, винная кислота – 5,0 мг, натрия дисульфит (натрия метабисульфит) – 1,0 мг, вода для инъекций – до 1 мл.

Описание. Бесцветный или зеленовато-желтого, или желтовато-зеленого цвета прозрачный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: психостимулирующее и ноотропное средство

Код АТХ: N06BX18

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Улучшает метаболизм головного мозга, увеличивая потребление глюкозы и кислорода тканью головного мозга. Повышает устойчивость нейронов к гипоксии; усиливает транспорт глюкозы к головному мозгу через гематоэнцефалический барьер; переводит процесс распада глюкозы на энергетически более экономный, аэробный путь; селективно блокирует кальцийзависимую фосфодиэстеразу; повышает концентрации аденозинмонофосфата (АМФ), циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) и аденозинтрифосфата (АТФ) в головном мозге.

Усиливает обмен норадреналина и серотонина в головном мозге, оказывает антиоксидантное действие. Снижает агрегацию тромбоцитов и повышенную вязкость крови; увеличивает деформирующую способность эритроцитов и блокирует утилизацию эритроцитами аденозина; способствует повышению отдачи кислорода эритроцитами. Улучшает мозговой кровоток; снижает резистентность сосудов головного мозга без существенного изменения показателей системного кровообращения. Не оказывает эффекта «обкрадывания» и усиливает кровоснабжение, прежде всего, в ишемизированных участках мозга. Проникает через плацентарный барьер.

Фармакокинетика

Терапевтическая концентрация при парентеральном введении в плазме – 10–20 нг/мл, объем распределения – 5,3 л/кг. При введении крысам радиоактивно меченого винпоцетина, наибольшая радиоактивность обнаруживалась в печени и желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в тканях отмечалась через 2–4 часа 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 внепечёночный метаболизм.

Легко проникает через гистогематические барьеры (в т.ч. гематоэнцефалический барьер), в грудное молоко (около 0,25% в течение 1 ч).

Метаболизм

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

Выведение

Период полувыведения у человека составляет $4,83 \pm 1,29$ ч. В исследованиях с радиоактивно меченым винпоцетином установлено, что выведение почками и кишечником происходит в соотношении 60:40%.

У крыс и собак высокая концентрация обнаруживается в желчи, однако отмечена значительная энтерогепатическая рециркуляция.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Поскольку винпоцетин предназначен в первую очередь для лечения пожилых пациентов, 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. При нарушениях функции печени и почек кумуляция не отмечается, что позволяет проводить длительную терапию.

Показания к применению

Неврология: транзиторная ишемическая атака, симптоматическая терапия последствий ишемического инсульта, сосудистой вертебробазиллярной

недостаточности, сосудистой деменции, атеросклероза сосудов головного мозга, посттравматической, гипертонической энцефалопатии.

Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сетчатки (в том числе окклюзия центральной артерии или вены сетчатки) и сосудистой оболочки глаза.

Отология: снижение слуха перцептивного типа, болезнь Меньера, ощущение шума в ушах, ухудшение слуха сосудистого или токсического (в том числе медикаментозного) генеза.

Противопоказания

- острая фаза геморрагического инсульта, тяжелая форма ишемической болезни сердца, тяжелые нарушения ритма сердца, гиперчувствительность к винпоцетину или другим компонентам препарата;
- беременность (возможно плацентарное кровотечение и спонтанные аборты, вероятно, в результате усиления плацентарного кровообращения);
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет (вследствие отсутствия данных клинических исследований).

Перед применением препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

С осторожностью

При геморрагическом инсульте введение возможно только после стихания острых явлений (обычно через 5–7 дней).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение при беременности противопоказано.

В период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Препарат предназначен только для внутривенной капельной инфузии, вводить медленно (скорость инфузии не должна превышать 80 капель/мин). Для приготовления инфузии можно использовать раствор натрия хлорида 0,9% или растворы, содержащие декстрозу. Начальная суточная доза 20 мг в 500 мл раствора натрия хлорида 0,9% или растворах, содержащих декстрозу. При хорошей переносимости в течение 2–3 дней, дозу повышают до максимальной – 1 мг/кг/сут.

Средняя продолжительность лечения 10–14 дней.

При заболеваниях печени или почек коррекции дозы не требуется.

Побочное действие

В ходе клинических исследований наиболее часто нежелательные реакции возникали в следующих системно-органных классах (по классификации Медицинского словаря для регуляторной деятельности) и со следующей частотой: нечасто ($>1/1000$, $<1/100$), редко ($>1/10000$, $<1/1000$), очень редко ($<1/1000$).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко – лейкопения, тромбоцитопения, агглютинация эритроцитов; очень редко – анемия.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – гиперчувствительность.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: редко – снижение аппетита, сахарный диабет, гиперхолестеринемия; очень редко – анорексия.

Нарушения психики: нечасто – эйфория, редко – бессонница, нарушение сна, беспокойство; очень редко – депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы: редко – головная боль, дисгевзия, ступор, односторонний парез, сонливость, амнезия; очень редко – тремор, спазмы, потеря сознания, гипотония, предобморочное состояние.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – гифема, дальноркость, близорукость, затуманенность зрения; очень редко – гиперемия конъюнктивы, отек соска зрительного нерва, диплопия.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: редко – гиперакузия, гипоакузия, вертиго; очень редко – шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: редко – ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, ощущение сердцебиения; очень редко – аритмия, фибрилляция предсердий, сердечная недостаточность.

Нарушения со стороны сосудов: редко – повышение артериального давления, снижение артериального давления, приливы; очень редко – лабильность артериального давления, тромбофлебит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: редко – боль в эпигастрии, дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота; очень редко – дисфагия, стоматит, гиперсаливация.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко – эритема, крапивница; очень редко – дерматит.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: редко – астения, недомогание, чувство жжения и воспаление в месте инъекции, тромбоз, дискомфорт в грудной клетке.

Лабораторные и инструментальные данные: нечасто – снижение артериального давления; редко – повышение артериального давления, гипертриглицеридемия, депрессия сегмента ST, эозинопения, нарушение функциональных проб печени, удлинение интервала QT; очень редко – повышение ЛДГ, изменения на ЭЭГ, удлинение интервала PR на ЭКГ.

Передозировка

Симптомы: усиление выраженности дозозависимых побочных эффектов.

Лечение: симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Одновременное применение винпоцетина и 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 применении с препаратами центрального, противоритмического и антикоагулянтного действия.

Винпоцетин и гепарин – химически несовместимы, поэтому запрещается введение их в одной инфузионной смеси, однако можно одновременно проводить лечение антикоагулянтами и винпоцетином.

Винпоцетин несовместим с растворами, содержащими аминокислоты, поэтому их нельзя использовать для его разведения.

Особые указания

В случае исходного удлинения интервала Q-T, а также при одновременном применении с лекарственными препаратами, удлиняющими интервал Q-T, в период лечения винпоцетином необходим периодический контроль ЭКГ.

Препарат содержит сорбитол, поэтому при наличии сахарного диабета необходимо периодически контролировать концентрацию глюкозы в крови.

Следует соблюдать осторожность при работе с механизмами и при выполнении работ, требующих быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Концентрат для приготовления раствора для инфузий, 5 мг/мл.

По 2 мл, 5 мл или 10 мл в ампулы светозащитного стекла.

По 10 ампул помещают в коробку из картона.

По 5 или 10 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой лакированной или без фольги.

1 контурную ячейковую упаковку с 10 ампулами или 1, 2 контурные ячейковые упаковки с 5 ампулами помещают в пачку из картона.

В каждую пачку, коробку вкладывают инструкцию по применению, скарификатор ампульный.

При использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой скарификатор ампульный не вкладывают.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре от 15 до 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска: отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/

Организация, принимающая претензии:

Открытое акционерное общество "Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий "Синтез" (ОАО "Синтез").

640008, Россия, г. Курган, пр. Конституции, 7

Тел/факс: (3522) 48-16-89

E.mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: <http://www.kurgansintez.ru>