Склад

діюча речовина: вінпоцетин;

1 таблетка містить вінпоцетину 5 мг (0,005 г);

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль картопляний, магнію стеарат, тальк.

Лікарська форма

Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або майже білого кольору.

Фармакотерапевтична група

Психостимулюючі та ноотропні засоби. Вінпоцетин.

Код АТХ N06B X18.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка.

Вінпоцетин являє собою сполуку з комплексним механізмом дії, що чинить сприятливий ефект на метаболізм у головному мозку і покращує його кровопостачання, а також покращує реологічні властивості крові.

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

Вінпоцетин стимулює церебральний метаболізм: препарат збільшує захоплення глюкози і 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 в бік енергетично більш сприятливого аеробного шляху; вибірково інгібує Ca^{2+}-кальмодулін-залежний фермент цГМФ-фосфодіестеразу (ФДЕ); підвищує рівень цАМФ і цГМФ у головному мозку. Препарат підвищує концентрацію АТФ і співвідношення АТФ/АМФ; підсилює обмін норадреналіну і серотоніну в головному мозку;

стимулює висхідну норадренергічну систему; володіє антиоксидантною активністю; у результаті дії всіх перерахованих вище ефектів вінпоцетин надає церебропротективну дію.

Вінпоцетин покращує мікроциркуляцію у головному мозку: препарат інгібує агрегацію тромбоцитів, зменшує патологічно підвищену в'язкість крові, підвищує деформованість еритроцитів та інгібує захоплення аденозину, покращує транспорт O_2 у тканинах шляхом зниження афінітету 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 спричиняє «ефекту обкрадання». Більш того, на тлі препарату поліпшується надходження крові в пошкоджені (але ще не некротизовані) ділянки ішемії з низькою перфузією («зворотний ефект обкрадання»).

Фармакокінетика.

Всмоктування: вінпоцетин швидко всмоктується, максимальна концентрація у плазмі крові досягається через 1 годину після перорального застосування. Основним місцем всмоктування вінпоцетину є проксимальні відділи шлунково-кишкового тракту. З'єднання не піддається метаболізму в момент проходження через кишкову стінку.

Розподіл: у дослідженнях із пероральним введенням препарату у щурів радіоактивно-мічений вінпоцетин у найбільшій концентрації виявлявся у печінці і в шлунково-кишковому тракті. Максимальні концентрації у тканинах можна було виявити через 2-4 години після застосування препарату. Концентрація радіоактивності у головному мозку не перевищувала концентрацію у крові.

У людини: зв'язування з білками крові становить 66 %. Абсолютна біодоступність вінпоцетину при пероральному прийомі становить 7 %. Обсяг розподілу становить 246,7 ± 88,5 л, що означає виражене зв'язування речовини у тканинах. Значення кліренсу вінпоцетину (66,7 л/год) у плазмі крові перевищує його значення у печінці (50 л/год), що вказує на позапечінковий метаболізм з'єднання.

Виведення: при багаторазовому пероральному застосуванні препарату в дозі 5 мг і 10 мг вінпоцетин демонструє лінійну кінетику; рівноважні концентрації у плазмі крові становлять 1,2 ± 0,27 нг/мл і 2,1 ± 0,33 нг/мл відповідно. Період напіввиведення у людини становить 4,83 ± 1,29 години. У дослідженнях, проведених з використанням радіоактивно міченої сполуки, було виявлено, що

основні шляхи виведення – через нирки і кишечник у співвідношенні 60 : 40. Велика кількість радіоактивної мітки у щурів і собак виявлялася у жовчі, але істотної ентерогепатичної циркуляції не відзначалося. Аповінкамінова кислота виділяється через нирки шляхом простої клубочкової фільтрації, період напіввиведення цієї речовини змінюється залежно від дози і способу застосування вінпоцетину.

Метаболізм: основним метаболітом вінпоцетину є аповінкамінова кислота (АВК), яка у людей утворюється в 25–30 %. Після перорального застосування площа під кривою («концентрація у плазмі – час») АВК у два рази перевищує таку після внутрішньовенного введення препарату, що вказує на утворення АВК у процесі пресистемного метаболізму вінпоцетину. Іншими виявленими метаболітами є гідроксивінпоцетин, гідрокси-АВК, дигідрокси-АВК-гліцинат та їх кон’югати з глюкуронідами та/або сульфатами. У кожного з вивчених видів кількість вінпоцетину, яка виділялася у незміненому вигляді, становила лише кілька відсотків від прийнятої дози препарату.

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

Зміна фармакокінетичних властивостей в особливих обставинах (наприклад, у певному віці, при наявності супутніх захворювань). Оскільки вінпоцетин показаний для терапії переважно пацієнтів літнього віку, у яких спостерігаються зміни кінетики лікарських препаратів – зниження всмоктування, інший розподіл і метаболізм, зниження виведення – необхідно було провести дослідження з оцінки кінетики препарату саме в цій віковій групі, особливо при тривалому застосуванні. Результати таких досліджень продемонстрували, що кінетика вінпоцетину в людей літнього віку суттєво не відрізняється від кінетики вінпоцетину в молодих людей, і, крім цього, відсутня кумуляція. При порушенні функції печінки або нирок можна застосовувати звичайні дози препарату, оскільки вінпоцетин не накопичується в організмі таких пацієнтів, що дозволяє тривалий час приймати препарат.

Показання

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

Офтальмологія. Для лікування хронічної судинної патології хоріоідеї (судинної оболонки ока) та сітківки.

Оториноларингологія. Для лікування старечої туговухості перцептивного типу, хвороби Меньєра та шуму у вухах.

Протипоказання

Вагітність, період годування груддю.

Гіперчутливість до активної речовини або до будь-якої з допоміжних речовин.

Застосування лікарського засобу дітям протипоказано (через відсутність клінічних даних).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами

Одночасне застосування вінпоцетину з β-блокаторами (клоранололом, піндололом), клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або гідрохлортіазидом у клінічних дослідженнях не супроводжувалося жодною взаємодією між ними. Одночасне застосування вінпоцетину і α-метилдопи іноді спричиняло деяке посилення гіпотензивного ефекту, тому на тлі застосування цієї комбінації препаратів необхідний регулярний контроль артеріального тиску. Незважаючи на відсутність даних клінічних досліджень, які підтверджують можливість взаємодії, рекомендується проявляти обережність при одночасному призначенні вінпоцетину з препаратами, які впливають на центральну нервову систему, а також у випадку супутньої антиаритмічної та антикоагулянтної терапії.

Особливості щодо застосування

Наявність синдрому пролонгованого інтервалу QT і прийом препаратів, що спричиняють подовження QT, вимагають проведення періодичного контролю ЕКГ.

При наявності у пацієнта підвищеного внутрішньочерепного тиску, аритмії або синдрому подовженого інтервалу QT, а також на тлі застосування антиаритмічних препаратів курс терапії препаратом можна розпочинати тільки після ретельного аналізу користі та ризиків, пов’язаних із застосуванням препарату.

Препарат містить лактозу, тому його не слід призначати пацієнтам із 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.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату під час вагітності та в період годування груддю протипоказано.

Вагітність: вінпоцетин проникає через плацентарний бар'єр, при цьому концентрація препарату в плаценті й у крові плода нижча, ніж у крові вагітної. Тератогенну дію препарату не виявлено. У доклінічних дослідженнях з великими дозами препарату у деяких випадках виникала кровотеча з плаценти і спонтанне переривання вагітності, вірогідно, в результаті посилення плацентарного кровопостачання.

Годування груддю: вінпоцетин проникає у грудне молоко. У доклінічних дослідженнях із застосуванням радіоактивного ізотопу радіоактивність грудного молока в 10 разів перевищувала таку в крові дорослої тварини. Застосування вінпоцетину у період годування груддю протипоказано через проникнення вінпоцетину у грудне молоко і відсутності достатньої кількості клінічних спостережень щодо безпеки препарату для грудних дітей. Після прийому однієї дози вінпоцетину протягом години в грудне молоко проникає 0,25 % прийнятої дози препарату.

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

Немає даних про вплив вінпоцетину на здатність керувати автотранспортом або працювати з механізмами, але слід дотримуватись обережності, враховуючи імовірність виникнення під час застосування препарату сонливості, запаморочення та вертиго.

Спосіб застосування та дози

Застосовувати внутрішньо після прийому їжі. Добова доза для дорослих становить 15–30 мг (3 рази на добу по 5–10 мг). Тривалість лікування визначає лікар індивідуально.

Пацієнтам із захворюваннями нирок або печінки корекція дозування не потрібна.

Діти.

Дітям лікарський засіб не застосовувати (через відсутність клінічних даних).

Передозування

Симптоми передозування невідомі. За даними наукової літератури, доза 60 мг/добу є безпечною. Одноразовий прийом 360 мг вінпоцетину не супроводжувався розвитком ні кардіоваскулярних, ні інших побічних ефектів.

Побічні ефекти

З боку системи крові та лімфатичної системи: лейкопенія, тромбоцитопенія, анемія, аглютинація еритроцитів.

З боку імунної системи: гіперчутливість.

З боку метаболізму та харчування: гіперхолестеринемія, зниження апетиту, анорексія, цукровий діабет.

Психічні розлади: безсоння, порушення сну, неспокій, збудження, ейфорія, депресія, ажитація.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, дисгевзія, ступор, геміпарез, сонливість, амнезія, тремор, судоми.

З боку органів зору: набряк соска зорового нерва, гіперемія кон’юнктиви.

З боку органів слуху та лабіринту: вертиго, гіперакузія, гіпоакузія, шум у вухах.

З боку серця: ішемія/інфаркт міокарда, стенокардія, брадикардія, тахікардія, екстрасистолія, відчуття серцебиття, аритмія, фібриляція передсердь.

З боку судинної системи: артеріальна гіпотензія, артеріальна гіпертензія, припливи, тромбофлебіт, зміни артеріального тиску.

З боку травного тракту: дискомфорт у животі, сухість у роті, нудота, біль у животі, запор, діарея, диспепсія, блювання, дисфагія, стоматит.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: еритема, гіпергідроз, свербіж, кропив’янка, висипання, дерматит.

Загальні порушення: астенія, слабкість, відчуття жару, дискомфорт у грудній клітці, гіпотермія.

Результати лабораторних та інструментальних досліджень: зниження артеріального тиску, підвищення артеріального тиску, підвищення рівня тригліцеридів у крові, депресія сегмента ST на електрокардіограмі, збільшення/зменшення кількості еозинофілів, зміна активності печінкових ферментів, збільшення/зменшення числа лейкоцитів, зменшення числа еритроцитів, зменшення протромбінового часу, збільшення маси тіла.

Термін придатності

5 років.

Умови зберігання

Зберігати у недоступному для дітей місці в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 или 5, или 50, или 100 блистеров в пачке.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

Приватне акціонерне товариство «Лекхім-Харків».