

## **Склад**

*діюча речовина:* вінпоцетин;

1 таблетка містить 10 мг вінпоцетину;

*допоміжні речовини:* магнію стеарат; кремнію діоксид колоїдний безводний; тальк; лактози моногідрат; крохмаль кукурудзяний.

## **Лікарська форма**

Таблетки.

*Основні фізико-хімічні властивості:* білі або майже білі плоскі, круглі таблетки з фаскою, діаметром близько 8,0 мм з написом «10 mg» з одного боку і рискою з іншого.

## **Фармакотерапевтична група**

Психостимулюючі та ноотропні засоби. Вінпоцетин.

Код АТХ N06B X18.

## **Фармакодинаміка**

Вінпоцетин являє собою сполуку з комплексним механізмом дії, яка сприятливо впливає 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 потенціалзалежні Na<sup>+</sup>- та Ca<sup>2+</sup>-канали, а також рецептори NMDA і AMPA. Препарат посилює нейропротективний ефект аденозину.

*Вінпоцетин стимулює церебральний метаболізм:* препарат збільшує захоплення глюкози та O<sub>2</sub> і споживання цих речовин тканиною головного мозку. Препарат підвищує стійкість головного мозку до гіпоксії; збільшує транспортування глюкози – виняткового джерела енергії для головного мозку – через гематоенцефалічний бар'єр; зсуває метаболізм глюкози у бік енергетично більш сприятливого аеробного шляху; вибірково інгібує Ca<sup>2+</sup>-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 транспортування O<sub>2</sub> у тканинах шляхом зниження афінитету O<sub>2</sub> 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». Більше того, на тлі прийому препарату покращується надходження крові у 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 травного тракту. Сполука не зазнає метаболізму у момент проходження через кишкову стінку.

Розподіл. У ході досліджень з пероральним застосуванням препарату у щурів радіоактивно мічений вінпоцетин у найбільшій концентрації виявлявся у печінці і в травному тракті. Максимальні концентрації у тканинах можна було виявити через 2–4 години після застосування препарату. Концентрація радіоактивної мітки у головному мозку не перевищувала концентрації у крові.

У людини: зв'язування з білками крові становить 66 %. Абсолютна біодоступність вінпоцетину при пероральному прийомі становить 7 %. Обсяг розподілу становить  $246,7 \pm 88,5$  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 сполуки.

Виведення. При багаторазовому пероральному застосуванні препарату у дозі 5 мг і 10 мг вінпоцетин демонструє лінійну кінетику; рівноважні концентрації у плазмі крові становлять  $1,2 \pm 0,27$  нг/мл і  $2,1 \pm 0,33$  нг/мл відповідно. Період напіввиведення у людини становить  $4,83 \pm 1,29$  год. У ході досліджень, проведених з використанням радіоактивно міченої сполуки, було виявлено, що основний шлях виведення здійснюється через нирки і кишечник у

співвідношенні 60:40 %. Найбільша кількість радіоактивної мітки у щурів і собак виявлялася у жовчі, але істотної ентерогепатичної циркуляції не відзначалося. Аповінкамінова кислота виділяється нирками 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 у 25–30 %. Після перорального застосування площа під кривою («концентрація у плазмі — час») АВК у 2 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 і їх кон'югати з глюкуронідами та/або сульфатами. У будь-якого з вивчених видів кількість вінпоцетину, яка виділилася у незміненому 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).

*Зміна фармакокінетичних властивостей в особливих обставинах (наприклад у певному віці, при наявності супутніх захворювань).* Оскільки вінпоцетин показаний для терапії пацієнтів переважно 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 у цій віковій групі, особливо при тривалому застосуванні. Результати таких досліджень продемонстрували, що кінетика вінпоцетину у пацієнтів літнього віку суттєво не відрізняється від кінетики вінпоцетину у 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 дає змогу тривалий час приймати препарат.

## **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.

### **Протипоказання**

Вагітність, період годування груддю та застосування жінкам репродуктивного віку, які не застосовують надійний метод контрацепції.

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

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

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій**

У ході клінічних досліджень при одночасному застосуванні вінпоцетину з бета-блокаторами, такими як клоранолол і піндолол, а також при одночасному застосуванні з клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або гідрохлоротіазидом ніякої взаємодії між цими лікарськими препаратами виявлено не було. У поодиноких випадках деякий додатковий ефект спостерігався при одночасному застосуванні альфа-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 та антикоагулянтної терапії.

### **Особливості застосування**

При підвищеному внутрішньочерепному тиску, при введенні антиаритмічних засобів, а також при аритміях і синдромі подовженого інтервалу QT препарат може бути призначений після ретельного зважування користі та ризику терапії.

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

У випадку непереносимості лактози необхідно враховувати, що препарат містить лактозу: кожна таблетка Кавінтону форте (10 мг) містить 83 мг лактози.

*Мутагенність.* Вінпоцетин не чинить мутагенної дії.

*Канцерогенність.* Вінпоцетин не чинить канцерогенної дії.

### **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами**

Досліджень з вивчення впливу на здатність до керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами не проводилося, але слід враховувати імовірність виникнення під час застосування лікарського засобу сонливості, запаморочення та вертиго.

### **Застосування у період вагітності або годування груддю**

У період вагітності, годування груддю та жінкам репродуктивного віку, які не застосовують надійний метод контрацепції, застосування вінпоцетину протипоказане.

*Дослідження репродуктивності.* Згідно з результатами досліджень, вінпоцетин не впливав на фертильність тварин чоловічої та жіночої статі. Пероральне введення вінпоцетину тваринам під час вагітності спричиняло токсичність для розвитку, включаючи вади розвитку при клінічно значущих експозиціях у розрахунку на мг/м<sup>2</sup> поверхні тіла. Крім того, у тварин при застосуванні високих доз зафіксована ембріо-фетальна летальність.

*Вагітність.* Вінпоцетин проникає крізь плаценту, але у плаценті та у крові плода виявляється у більш низьких концентраціях, ніж у крові матері. Під час досліджень на тваринах зафіксовано репродуктивну токсичність, в тому числі вади розвитку. У ході досліджень на тваринах застосування великих доз вінпоцетину супроводжувалося у деяких випадках плацентарною кровотечею і викиднем, переважно у результаті посилення плацентарного кровотоку.

*Годування груддю.* Вінпоцетин екскретується у грудне молоко. Під час досліджень із застосуванням міченого вінпоцетину радіоактивність грудного молока була у 10 разів вища, ніж у крові матері. Кількість, що виділяється з грудним молоком протягом 1 години, становить 0,25 % від застосованої дози препарату. Оскільки вінпоцетин виділяється з грудним молоком, а даних щодо впливу на організм новонародженого немає, застосування вінпоцетину у період годування груддю протипоказане.

### **Спосіб застосування та дози**

Звичайні дози препарату становлять 5–10 мг 3 рази на добу (15–30 мг на добу).  
Таблетки необхідно приймати після їди.

Пацієнтам із захворюваннями нирок або печінки особливого підбору доз не потрібно.

Тривалість лікування визначає лікар індивідуально.

## Діти

Застосування препарату Кавінтон форте дітям протипоказано.

## Передозування

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

## Побічні реакції

Кавінтон форте є безпечним препаратом, що було підтверджено дослідженнями з оцінки безпеки, які включали дані про десятки тисяч пацієнтів і продемонстрували, що навіть ті небажані ефекти, які виникали найчастіше, не підпадали під категорію «часті (> 1/100)» згідно з визначенням MedDRA, тобто побічні ефекти з найбільшою імовірністю виникнення реєструвалися з частотою менше 1 %. З цієї причини у таблиці нижче відсутня категорія «часті».

Небажані реакції зазначені нижче з поділом за класами систем органів і з зазначенням частоти виникнення згідно з термінологією MedDRA:

<b>Клас системи органів (MedDRA 12.1)</b>	<b>Нечасті (<math>\geq 1/1000</math> – &lt;1/100)</b>	<b>Поодинокі (<math>\geq 1/10000</math> – &lt;1/1000)</b>	<b>Рідкісні (&lt;1/10000)</b>
З боку крові та лімфатичної системи		Лейкопенія Тромбоцитопенія	Анемія Аглютинація еритроцитів

З боку імунної системи			Гіперчутливість
Порушення метаболізму та харчування	Гіперхолестеринемія	Зниження апетиту Анорексія Цукровий діабет	
Психічні розлади		Безсоння Порушення сну Неспокій Ажитація	Ейфорія Депресія
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 напруження Брадикардія Тахікардія Екстрасистолія Відчуття серцебиття	Аритмія Фібриляція передсердь
З боку судинної системи	Артеріальна гіпотензія	Артеріальна гіпертензія Припливи Тромбофлебіт	Коливання 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 кількості еритроцитів Зменшення протромбінового часу Збільшення маси тіла
--	------------------------------	---	--

### **Термін придатності**

5 років.

### **Умови зберігання**

Зберігати при температурі не вище 30 °С, в оригінальній упаковці для захисту від впливу світла.

Препарат зберігати у недоступному для дітей місці!

### **Упаковка**

По 15 таблеток у блістері, по 2 блістери у картонній упаковці.

### **Категорія відпуску**

За рецептом.

### **Виробник**

ВАТ «Гедеон Ріхтер».

### **Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності**

Н-1103, Будапешт, вул. Демреї, 19-21, Угорщина.

### **Джерело інструкції**

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру](#)

лікарських засобів України.