

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ВІНПОЦЕТИН-ДАРНИЦЯ
(VINPOCETINE-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: vinpocetine;

1 таблетка містить вінпоцетину 5 мг;

допоміжні речовини: лактоза моногідрат, крохмаль картопляний, 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.

Протипоказання.

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

Спосіб застосування та дози.

Застосовувати внутрішньо після прийому їжі.

Вінпоцетин-Дарниця рекомендовано застосовувати дорослим по 5-10 мг (1-2 таблетки) 3 рази на добу (15-30 мг на добу).

Для пацієнтів із захворюваннями нирок або печінки особливого підбору доз не потрібно.

Тривалість лікування визначається лікарем індивідуально.

Побічні реакції.

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, збудження, неспокій, 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 органа 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, 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.

Передозування.

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

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату період вагітності або годування груддю протипоказано

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.

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

Пацієнти з такими рідкісними спадковими захворюваннями, як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа або порушення мальабсорбції глюкози-галактози, не повинні приймати цей препарат.

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.

Досліджень з вивчення впливу на здатність керувати автотранспортом або роботу з механізмами не проводилося, але слід враховувати імовірність виникнення під час застосування препарату сонливості, запаморочення та вертиго.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування вінпоцетину з β -блокаторами (клоранололом, піндололом), а також з клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або гідрохлоротіазидом у клінічних дослідженнях не супроводжувалося будь-якою взаємодією між ними.

Одночасне застосування вінпоцетину і α -метилдопи іноді спричиняло деяке посилення гіпотензивного ефекту, тому при такому лікуванні потрібен регулярний контроль артеріального тиску.

Незважаючи на відсутність даних клінічних досліджень, що підтверджують можливість взаємодії, рекомендується проявляти обережність при одночасному призначенні вінпоцетину з

препаратами, що діють на центральну нервову систему, протиаритмічними та антикоагулянтними засобами.

При одночасному застосуванні Вінпоцетину-Дарниця та гепарину підвищується ризик геморагічних ускладнень.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Вінпоцетин являє собою з'єднання з комплексним механізмом дії, яке сприятливо впливає на метаболізм у головному мозку і покращує його кровопостачання, а також покращує реологічні властивості крові.

Вінпоцетин виявляє нейропротекторні 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 аффінітету 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.

Всмоктування: швидко всмоктується, і через годину після прийому внутрішньо його концентрація у крові досягає максимуму. Всмоктування відбувається головним чином у проксимальних відділах травного тракту. При проходженні через стінку кишки не піддається метаболізму.

Розподіл: дослідження з вінпоцетином, міченим радіоактивним ізотопом, показали, що при пероральному введенні препарату найбільша радіоактивність визначається у печінці і шлунково-кишковому тракті. Максимальна концентрація у тканинах спостерігається через 2-4 години після застосування внутрішньо. Концентрація вінпоцетину у тканинах головного мозку не перевищує його концентрацію у крові. В організмі людини 66 % вінпоцетину зв'язується з білками, біодоступність при застосуванні внутрішньо – 7 %, об'єм розподілу – $246,7 \pm 88,5$ л, що вказує на гарний розподіл 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.

Метаболізм: головний метаболіт вінпоцетину, апо-вінкамінова кислота (АВК), утворюється в організмі людини у кількості 25-30 % при першому проходженні вінпоцетину через печінку. Порівняно з внутрішньовенним уведенням після застосування препарату внутрішньо величина площі під кривою «концентрація-час» (AUC) АВК удвічі більша. Іншими метаболітами вінпоцетину є: гідрокси-вінпоцетин, гідрокси-АВК, гліцинат дигідрокси-апо-вінкамінової

кислоти та їх сульфатні і глюкуронідні кон'югати. Захворювання печінки і нирок не впливають на метаболізм вінпоцетину.

Виведення: при повторних застосуваннях препарату внутрішньо у дозі 5 і 10 мг кінетика має лінійний характер, плазмові концентрації у стадії насичення становлять відповідно $1,2 \pm 0,27$ нг/мл і $2,1 \pm 0,33$ нг/мл. Час напіввиведення у людини – $4,83 \pm 1,29$ години. Виводиться із сечею і калом у співвідношенні 3:2. Виведення АВК здійснюється шляхом клубочкової фільтрації. Час напіввиведення залежить від дози вінпоцетину і режиму дозування.

Пацієнти літнього віку. За даними клінічних досліджень, істотних відмінностей у кінетиці препарату у людей літнього віку та молодих пацієнтів немає, препарат не кумулюється. Пацієнтам із захворюваннями печінки і/або нирок препарат призначають у звичайній дозі, відсутність кумуляції дозволяє проводити тривалі курси лікування.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору, плоскоциліндричної форми, з фаскою.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

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

Упаковка.

По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці; по 3 або по 5 контурних чарункових упаковок у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.