

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства
ВИННЕР-ЛФ

Торговое название

Виннер-ЛФ

Международное непатентованное название

Vinpocetine

Описание

Бесцветная или слегка зеленоватая, или слегка коричневатая прозрачная жидкость со специфическим запахом.

Состав

2 мл раствора содержат:

Действующее вещество: винпоцетин – 10 мг;

Вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота, метабисульфит натрия, винная кислота, бензиловый спирт, сорбитол, вода для инъекций.

5 мл раствора содержат:

Действующее вещество: винпоцетин – 25 мг;

Вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота, метабисульфит натрия, винная кислота, бензиловый спирт, сорбитол, вода для инъекций.

Форма выпуска

Концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Фармакотерапевтическая группа

Прочие психостимулирующие и ноотропные средства.

Код АТХ

N06BX18.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Винпоцетин оказывает влияние на метаболизм, кровообращение головного мозга, реологические свойства крови.

Винпоцетин проявляет нейропротективные эффекты: ослабляет вредное воздействие цитотоксических реакций, вызванных стимулирующими аминокислотами. Винпоцетин ингибирует потенциал-зависимые Na^+ - и Ca^{2+} -каналы, а также рецепторы NMDA и AMPA, усиливает нейропротективный эффект аденозина.

Винпоцетин стимулирует церебральный метаболизм: увеличивает захват глюкозы и кислорода и потребление этих веществ тканью головного мозга. Винпоцетин повышает устойчивость головного мозга к гипоксии; увеличивает транспорт глюкозы – исключительного источника энергии для головного мозга – через гематоэнцефалический барьер; сдвигает метаболизм глюкозы в сторону энергетически более благоприятного аэробного пути; избирательно ингибирует Ca^{2+} -кальмодулинзависимый фермент цГМФ-фосфодиэстеразу (ФДЭ); повышает уровень цАМФ и цГМФ в головном мозге. Винпоцетин повышает концентрацию АТФ и соотношение АТФ/АМФ;

усиливает обмен норадреналина и серотонина в головном мозге; стимулирует восходящую норадренергическую систему; обладает антиоксидантной активностью.

Винпоцетин улучшает микроциркуляцию в головном мозге; ингибирует агрегацию тромбоцитов; снижает патологически повышенную вязкость крови; повышает деформируемость эритроцитов и ингибирует захват аденозина; улучшает транспорт кислорода в тканях путем снижения аффинитета кислорода к эритроцитам.

Винпоцетин селективно увеличивает кровоток в головном мозге: увеличивает церебральную фракцию сердечного выброса; снижает сопротивление сосудов головного мозга, не оказывает влияния на параметры системной циркуляции (артериальное давление, сердечный выброс, частоту пульса, общее периферическое сопротивление); лекарственное средство не оказывает "эффекта обкрадывания". Более того, на фоне винпоцетина улучшается поступление крови в поврежденные (но еще не некротизированные) участки ишемии с низкой перфузией ("обратный эффект обкрадывания").

Фармакокинетика

Распределение: в исследованиях с пероральным введением лекарственного средства у крыс радиоактивно-меченый винпоцетин в наибольшей концентрации обнаруживался в печени и в желудочно-кишечном тракте. Максимальные концентрации в тканях можно было выявить через 2-4 часа после применения. Концентрация радиоактивной метки в головном мозге не превышала концентрацию в крови.

У человека связывание с белками крови составляет 66 %. Абсолютная пероральная биодоступность винпоцетина составляет около 7 %. Объем распределения равен $246,7 \pm 88,5$ л, что означает выраженное связывание вещества в тканях. Значение клиренса винпоцетина ($66,7$ л/ч) превышает значения в плазме и печени (50 л/ч), что указывает на внепеченочный метаболизм соединения.

Выведение: при многократном пероральном применении лекарственного средства в дозе 5 мг и 10 мг винпоцетин демонстрирует линейную кинетику; равновесные концентрации в плазме составляют $1,2 \pm 0,27$ нг/мл и $2,1 \pm 0,33$ нг/мл, соответственно. Период полувыведения у человека составляет $4,83 \pm 1,29$ часов. В исследованиях, проведенных с использованием радиоактивно-меченого соединения было обнаружено, что основной путь выведения осуществляется через почки и кишечник в соотношении 60:40 %. Больше количество радиоактивной метки у крыс и собак обнаруживалось в желчи, но существенной энтерогепатической циркуляции не отмечалось. Аповинкаминовая кислота выделяется через почки путем простой клубочковой фильтрации, период полувыведения этого вещества меняется в зависимости от дозы и способа применения винпоцетина.

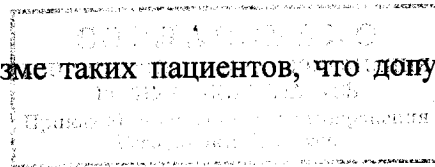
Метаболизм: основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминовая кислота (АВК), которая у людей образуется в 25-30 %. После перорального применения площадь под кривой ("концентрация-время") АВК в два раза превышает таковую после внутривенного введения лекарственного средства, что указывает на образование АВК в процессе пресистемного метаболизма винпоцетина. Другими выявленными метаболитами являются гидроксвинпоцетин, гидрокси-АВК, дигидрокси-АВК-глицинат и их конъюгаты с глюкуронидами и/или сульфатами. У любого из изученных видов количество винпоцетина, которое выделялось в неизменном виде, составляло только несколько процентов от принятой дозы лекарственного средства. Важным и значимым свойством винпоцетина является отсутствие необходимости специального подбора дозы лекарственного средства у пациентов с заболеваниями печени и почек ввиду метаболизма и отсутствия кумуляции (накопления).

Изменение фармакокинетических свойств в особых обстоятельствах (например, в определенном возрасте, при наличии сопутствующих заболеваний)

Поскольку винпоцетин показан для терапии преимущественно пожилых пациентов, у которых наблюдаются изменения кинетики лекарственных средств – снижение всасывания, другое распределение и метаболизм, снижение выведения – необходимо было провести исследования по оценке кинетики винпоцетина именно в этой возрастной группе, особенно при длительном применении. Результаты таких исследований продемонстрировали, что кинетика винпоцетина у пожилых людей существенно не отличается от кинетики винпоцетина у молодых людей, и, кроме этого, отсутствует кумуляция.

При нарушении функции печени или почек можно применять обычные дозы лекарственного

средства, поскольку винпоцетин не накапливается в организме таких пациентов, что допускает длительное применение.



Показания к применению

Неврология:

Следующие формы церебральной ишемии: состояния после перенесенного острого нарушения мозгового кровообращения, хроническая недостаточность мозгового кровообращения вследствие церебрального атеросклероза или артериальной гипертензии, в том числе вертебробазилярной недостаточности; а также сосудистая деменция, посттравматическая энцефалопатия.

Способствует уменьшению психической и неврологической симптоматики при церебральной ишемии.

Офтальмология:

Для лечения хронической сосудистой патологии хориоидеи (сосудистой оболочки глаза) и сетчатки.

Оториноларингология:

Для лечения тугоухости нейросенсорного типа, болезни Меньера и идиопатического шума в ушах.

Способ применения и дозы

Допускается применение лекарственного средства только в виде медленной внутривенной капельной инфузии! Скорость инфузии не должна превышать максимально 80 капель/минуту!

При капельной инфузии начальная суточная доза обычно составляет 20 мг в 500 мл раствора для инфузии. Эта доза может быть увеличена до 1 мг/кг массы тела в сутки, в течение 2-3 дней, в зависимости от переносимости лекарственного средства пациентом. Средняя продолжительность курса терапии составляет 10-14 дней, обычная суточная доза – 50 мг/сутки (50 мг в 500 мл раствора для инфузии) – в расчете на массу тела в 70 кг.

У пациентов с заболеваниями почек или печени никакого специального подбора дозы не требуется.

Лекарственное средство нельзя вводить внутримышечно, а также нельзя вводить внутривенно без разведения!

Винпоцетин можно разводить любым типом физиологического раствора или раствора глюкозы для инфузий (например, Салсол, Рингер, Риндекс, Реомакродекс). Лекарственное средство применяют сразу после вскрытия ампулы. Ампула с лекарственным средством предназначена только для однократного применения. Остатки лекарственного средства необходимо уничтожить. С микробиологической точки зрения приготовленный для внутривенного введения раствор следует использовать немедленно.

Винпоцетин химически несовместим с гепарином, поэтому эти два лекарственных средства нельзя смешивать в одном шприце. Винпоцетин также несовместим с растворами для инфузий, содержащими аминокислоты, поэтому в процессе инфузионной терапии его нельзя вводить вместе с растворами для инфузий, содержащими аминокислоты.

После завершения курса инфузионной терапии в случае необходимости можно продолжить прием винпоцетина в виде таблеток.

Применение лекарственного средства Виннер-ЛФ, концентрат для приготовления раствора для инфузий, у детей до 18 лет противопоказано.

Побочное действие

Нежелательные реакции классифицируются в зависимости от частоты их возникновения: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (из-за недостаточности данных).

Побочные реакции перечислены ниже с разделением по классам органов и с указанием частоты возникновения согласно терминологии MedDRA.

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

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – гиперчувствительность.

Нарушения метаболизма и питания: редко – гиперхолестеринемия, сахарный диабет; очень редко – анорексия.

Нарушения со стороны психики: нечасто – эйфория; редко: беспокойство; очень редко – депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы: редко – головная боль, головокружение, гемипарез, сонливость; очень редко – тремор, потеря сознания, гипотензия, предобморочное состояние.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – кровоизлияние в переднюю камеру глаза, гиперметропия, снижение остроты зрения, миопия; очень редко – гиперемия конъюнктивы, отек диска зрительного нерва, диплопия.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: редко – нарушение слуха, гиперакузия, гипоакузия, истинное головокружение; очень редко – шум в ушах.

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

Нарушения со стороны сосудов: редко – гипотензия, гипертензия, приливы; очень редко – колебания артериального давления, тромбоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: редко – дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота; очень редко – гиперсекреция слюны, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки: редко – эритема, гипергидроз, крапивница; очень редко – дерматит, зуд.

Общие нарушения и реакции в месте введения: нечасто – ощущения жара; редко – астения, дискомфорт в грудной клетке, воспаление, тромбоз в месте инъекции.

Результаты обследования: нечасто – снижение артериального давления; редко – повышение артериального давления, удлинение интервала QT на электрокардиограмме, депрессия сегмента ST на электрокардиограмме, повышение уровня мочевины; очень редко – повышение уровня лактатдегидрогеназы, удлинение интервала PR на электрокардиограмме, изменения на электрокардиограмме.

В случае возникновения нежелательных реакций, в том числе не указанных в данной инструкции, необходимо немедленно обратиться к врачу.

Противопоказания

- Острая фаза геморрагического церебрального инсульта, тяжелая ишемическая болезнь сердца, тяжелые формы аритмии;
- Гиперчувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ;
- Беременность, лактация;
- Детский возраст до 18 лет (ввиду отсутствия данных соответствующих клинических исследований).

Передозировка

В настоящее время данные о передозировке винпоцетином ограничены.

Лечение: симптоматическая терапия.

Меры предосторожности

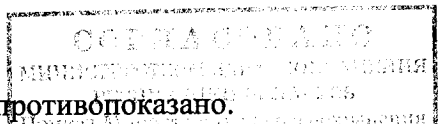
При наличии у пациента повышенного внутричерепного давления, аритмии или синдрома удлиненного интервала QT, а также на фоне применения антиаритмических средств курс терапии лекарственным средством можно начинать только после тщательного анализа пользы и рисков, сопряженных с его применением. Рекомендуется ЭКГ-контроль при наличии синдрома удлиненного интервала QT или при одновременном приеме лекарственного средства, способствующего удлинению интервала QT.

В связи с тем, что в лекарственном средстве содержится небольшое количество сорбита (160 мг / 2 мл или 400 мг / 5 мл), необходимо контролировать содержание глюкозы в крови у пациентов с сахарным диабетом во время курса терапии.

При наличии у пациента непереносимости фруктозы и недостаточности фермента фруктозо-1,6-дифосфатазы, лечение лекарственным средством проводить не следует.

Применение у детей

Применение винпоцетина у детей до 18 лет противопоказано.



Применение при беременности и в период лактации

Во время беременности и лактации применение винпоцетина **противопоказано**.

Беременность: винпоцетин проникает через плаценту, но в плаценте и в крови плода обнаруживается в более низких концентрациях, чем в крови матери. Тератогенного или эмбриотоксического эффекта отмечено не было. В исследованиях на животных введение больших доз винпоцетина сопровождалось в некоторых случаях плацентарным кровотечением и выкидышем, преимущественно в результате усиления плацентарного кровотока.

Лактация: винпоцетин выделяется с грудным молоком. В исследованиях с применением меченого винпоцетина радиоактивность грудного молока была в десять раз выше, чем в крови матери. Количество, выделяемое с молоком в течение 1 часа, составляет 0,25 % от введенной дозы лекарственного средства. Поскольку винпоцетин выделяется с молоком матери, а данных о воздействии на организм новорожденного нет, применение винпоцетина в период кормления грудью **противопоказано**.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами или потенциально опасными механизмами

Данные о влиянии лекарственного средства на способность к управлению автомобилем и работе с механизмами отсутствуют.

В случае возникновения зрительных расстройств, головокружения и других нарушений со стороны нервной системы, необходимо воздержаться от потенциально опасных видов деятельности, которые требуют повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

В ходе клинических исследований при одновременном применении винпоцетина с β -блокаторами, такими как клоранолол и пиндолол, а также при одновременном применении с клопамидом, глибенкламидом, дигоксином, аценокумаролом или гидрохлортиазидом никакого взаимодействия между этими лекарственными средствами выявлено не было. В редких случаях некоторый дополнительный эффект наблюдался при одновременном применении α -метилдопы и винпоцетина, поэтому на фоне применения этой комбинации необходимо осуществлять регулярный контроль артериального давления.

Хотя данные клинических исследований не подтвердили взаимодействия, рекомендуется соблюдать осторожность в случае одновременного применения винпоцетина с лекарственными средствами, влияющими на центральную нервную систему, а также в случае сопутствующей антиаритмической и антикоагулянтной терапии.

Винпоцетин химически несовместим с гепарином, поэтому эти два лекарственных средства нельзя смешивать в одном шприце.

Винпоцетин также несовместим с растворами для инфузии, содержащими аминокислоты, поэтому в процессе инфузионной терапии винпоцетин нельзя вводить вместе с растворами для инфузий, содержащими аминокислоту.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

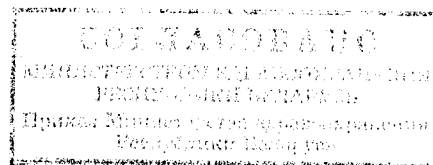
Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

По 2 мл концентрата для приготовления раствора для инфузий в ампулы из темного стекла I гидролитического класса с кольцом излома или по 5 мл концентрата для приготовления раствора для инфузий в ампулы из темного стекла I гидролитического класса с кольцом излома. По 5 ампул в ячейковую упаковку из поливинилхлорида. По 1 или 2 ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона.

Условия отпуска

По рецепту.



Информация о производителе

СООО "Лекфарм", Республика Беларусь, 223141, г. Логойск, ул. Минская, д. 2а

Тел./факс: (01774)-53801 e-mail: office@lekpharm.by