

Состав

действующее вещество: vinpocetine;

1 мл препарата содержит винпоцетина 5 мг;

вспомогательные вещества: кислота аскорбиновая, натрия метабисульфит, спирт бензиловый, кислота винная, сорбит (Е 420), вода для инъекций.

Лекарственная форма

Концентрат для раствора для инфузий.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка зеленоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Психостимуляторы и ноотропные средства. Винпоцетин. Код АТХ N06B X18.

Фармакодинамика

Действующее вещество лекарственного средства – винпоцетин – оказывает благоприятный эффект на метаболизм головного мозга и улучшает его кровоснабжение, а также улучшает реологические свойства крови.

Оказывает нейропротективные эффекты: ослабляет вредное действие цитотоксических реакций, вызванных стимулирующими аминокислотами. Лекарственное средство ингибирует потенциалзависимые Na⁺- и Ca²⁺-каналы, а также рецепторы NMDA и AMPA. Лекарственное средство усиливает нейропротективный эффект аденозина.

Стимулирует церебральный метаболизм: увеличивает захват глюкозы и O₂ и потребление этих веществ тканью головного мозга. Винпоцетин повышает устойчивость головного мозга к гипоксии; увеличивает транспортирование глюкозы – исключительного источника энергии для головного мозга – через гематоэнцефалический барьер; сдвигает метаболизм глюкозы в сторону энергетически более благоприятного аэробного пути; избирательно ингибирует Ca²⁺-кальмодулинзависимый фермент цГМФ-фосфодиэстеразу (ФДЭ); повышает уровень цАМФ и цГМФ в головном мозге. Лекарственное средство повышает концентрацию АТФ и соотношение АТФ/АМФ; усиливает оборот норадреналина и серотонина в головном мозге; стимулирует восходящую норадренергическую систему; обладает антиоксидантной активностью; в результате действия всех

вышеперечисленных эффектов винпоцетин оказывает церебропротективное действие.

Улучшает микроциркуляцию в головном мозге: ингибирует агрегацию тромбоцитов, уменьшает патологически повышенную вязкость крови, повышает деформируемость эритроцитов и ингибирует захват аденозина, улучшает транспортирование O₂ в тканях путем снижения аффинитета O₂ к эритроцитам.

Селективно увеличивает кровоток в головном мозге: увеличивает церебральную фракцию сердечного выброса; снижает сосудистое сопротивление в головном мозге, не влияя на параметры системной циркуляции (артериальное давление, сердечный выброс, частоту пульса, общее периферическое сопротивление); не вызывает «эффекта обкрадывания». Более того, на фоне применения лекарственного средства улучшается поступление крови в поврежденные (но еще не некротизированные) участки ишемии с низкой перфузией («обратный эффект обкрадывания»).

Фармакокинетика

При внутривенном введении лекарственное средство на 66 % связывается с белками плазмы крови. Максимальные концентрации в тканях мозга определяются через 2–4 часа после применения лекарственного средства.

Объем распределения составляет $246,7 \pm 88,5$ л, что означает выраженное связывание винпоцетина в тканях. Во время исследований наибольшие концентрации оказывались в печени и пищеварительном тракте.

Метаболизируется в печени. Основным метаболитом винпоцетина является аповинкаминсовая кислота (АВК) – 20–30 %, а также гидроксивинпоцетин, гидрокси-АВК, дигидроксид-АВК-глицинат и их конъюгаты с глюкуронидами и/или сульфатами.

Винпоцетин не кумулируется в организме. Нарушение функции печени и почек не влияют на метаболизм винпоцетина.

Выделяется из организма почками (примерно 60 %) и кишечником (примерно 40 %). Период полувыведения составляет 4–5 часов.

Изменение фармакокинетических свойств (например, в определенном возрасте, при наличии сопутствующих заболеваний). Поскольку винпоцетин показан для терапии преимущественно пациентов пожилого возраста, у которых наблюдаются изменения кинетики лекарственных средств (снижение всасывания, другое распределение и метаболизм, снижение вывода), необходимо

было провести исследования по оценке кинетики лекарственного средства именно в этой возрастной группе, особенно при длительном применении. Результаты таких исследований показали, что кинетика винпоцетина у пожилых людей существенно не отличается от кинетики винпоцетина у молодых людей, и, кроме этого, отсутствует аккумуляция. При нарушении функции печени или почек можно применять обычные дозы лекарственного средства, поскольку винпоцетин не накапливается в организме таких пациентов, позволяет длительное время принимать лекарственное средство.

Показания

Неврология: различные формы цереброваскулярной патологии (состояния после перенесенного нарушения мозгового кровообращения (инсульта), вертебро-базилярная недостаточность, сосудистая деменция, церебральный атеросклероз, посттравматическая и гипертензивная энцефалопатия). Лекарственное средство способствует ослаблению психической и неврологической симптоматики при цереброваскулярной патологии.

Офтальмология: хронические сосудистые заболевания сосудистой оболочки и сетчатки глаза (например тромбоз, обструкция центральной артерии или вены сетчатки).

Оториноларингология: старческая тугоухость при острой сосудистой патологии, токсические (медикаментозные) поражения слуха или поражения слуха другого генеза (идиопатические, вызванные шумовым воздействием), болезнь Меньера, шум в ушах.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или к другим компонентам лекарственного средства; острая фаза геморрагического церебрального инсульта; тяжелые формы ишемической болезни сердца; тяжелые формы аритмии.

Беременность, период кормления грудью.

Применение лекарственного средства детям противопоказано (из-за отсутствия данных соответствующих клинических исследований).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении винпоцетина с другими лекарственными средствами возможны следующие взаимодействия:

с α -метилдопой – усиление гипотензивного эффекта; при одновременном применении лекарственных средств рекомендуется проводить регулярный контроль артериального давления;

с гепарином – повышение риска развития кровотечений.

В клинических исследованиях применение винпоцетина одновременно с β -адреноблокаторами (хлоранолол, пиндолол), клопамидом, глибенкламидом, дигоксином, аценокумаролом, гидрохлоротиазидом не сопровождалось каким-либо взаимодействием.

Несмотря на отсутствие данных клинических исследований, рекомендуется с осторожностью применять винпоцетин вместе с лекарственными средствами, которые влияют на центральную нервную систему, противоаритмическими препаратами, гипотензивными средствами, антикоагулянтами и фибринолитиками.

Лекарственное средство несовместимо с алкоголем.

Особенности применения

Лекарственное средство применять только после тщательного анализа пользы и рисков пациентам с повышенным внутричерепным давлением, аритмией или синдромом удлиненного интервала QT, а также в случае одновременного применения антиаритмических средств.

Рекомендуется ЭКГ-контроль у пациентов с синдромом удлиненного интервала QT или в случае совместного приема лекарственных средств, способствующих удлинению интервала QT.

Лекарственное средство применять с осторожностью пациентам с печеночной недостаточностью, плохой переносимостью алкалоидов барвинка малого и в случае сопутствующего применения гипотензивных лекарственных средств.

Лекарственное средство не рекомендуется применять пациентам с лабильным артериальным давлением и низким сосудистым тонусом.

В лекарственном средстве содержится небольшое количество сорбита – если у Вас установлена непереносимость некоторых сахаров, проконсультируйтесь с врачом, прежде чем принимать это лекарственное средство.

Из-за содержания натрия метабисульфита лекарственное средство изредка может вызывать реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Отсутствуют данные о способности лекарственного средства влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами, но следует учитывать возможность возникновения побочных реакций со стороны нервной системы (сонливости, головокружения и вертиго).

Применение в период беременности или кормления грудью

Период беременности. Лекарственное средство проникает через плаценту, но в плаценте и в крови плода выявляется 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 кровообращения.

В период беременности применение лекарственного средства противопоказано.

Период кормления грудью. Лекарственное средство проникает в грудное молоко. В исследованиях с применением меченого винпоцетина радиоактивность в грудном молоке была в 10 раз выше, чем в крови матери. Количество, которое проникает в грудное молоко в течение 1 часа, составляет 0,25 % от введенной дозы лекарственного средства.

В период кормления грудью применение лекарственного средства противопоказано, поскольку винпоцетин проникает в молоко матери, а данных о влиянии на организм новорожденного нет.

Способ применения и дозы

Лекарственное средство применять только внутривенно в виде медленной капельной инфузии (скорость инфузии не должна превышать 80 капель в минуту).

Лекарственное средство противопоказано вводить подкожно, внутримышечно и в концентрированном виде внутривенно.

Лекарственное средство можно разводить физиологическим раствором или растворами для инфузий, содержащими глюкозу.

Раствор для инфузии следует использовать в течение 3 часов после приготовления.

Начальная суточная доза лекарственного средства обычно составляет 20 мг, разведенных в 500 мл раствора для инфузий. При необходимости дозу можно увеличить в течение 2–3 дней до 1 мг/кг массы тела в сутки, в зависимости от переносимости лекарственного средства пациентом.

Средняя суточная доза лекарственного средства составляет 50 мг, разведенных в 500 мл раствора для инфузий в расчете на массу тела в 70 кг.

Средняя продолжительность курса терапии составляет 10–14 дней.

После завершения курса инфузионной терапии рекомендуется продолжить терапию лекарственным средством в форме таблеток.

Пациенты с нарушением функции печени и почек.

Отсутствует необходимость в коррекции дозы лекарственного средства.

Дети

Из-за отсутствия данных соответствующих клинических исследований лекарственное средство не применять детям.

Передозировка

Случаев передозировки не отмечалось. На основании опубликованных данных введение лекарственного средства в дозе 1 мг/кг массы тела можно считать безопасным. Поскольку нет данных о применении лекарственного средства в дозах, превышающих указанную, введение лекарственного средства в высоких дозах не допускается.

Побочные реакции

Побочные реакции с наибольшей вероятностью возникновения регистрировались с частотой менее 1 %. По этой причине в таблице отсутствует категория частоты «Часто».

Нежелательные реакции указаны ниже по классам систем органов и с указанием частоты возникновения согласно терминологии MedDRA:

Класс системы органов (MedDRA 12.1)	Нечасто ($\geq$ 1/1000 - < 1/100)	Редко ($\geq$ 1/10000 - < 1/1000)	Очень редко (< 1/10000)
<i>Со стороны органов зрения</i>		гифема, гиперметропия, снижение остроты зрения, миопия	гиперемия конъюнктивы, отёк соска зрительного нерва, диплопия
<i>Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата</i>		нарушение слуха, гиперакузия, гипоакузия, вертиго	шум в ушах
<i>Со стороны респираторной системы, органов грудной клетки и средостения</i>			бронхоспазм
<i>Со стороны желудочно- кишечного тракта</i>		дискомфорт в животе, сухость во рту, тошнота	гиперсекреция слюны, рвота, диспепсия, изжога
<i>Со стороны обмена веществ, метаболизма</i>		гиперхолестеринемия, сахарный диабет	анорексия

Со стороны нервной системы		головная боль, головокружение, гемипарез, сонливость	тремор, заторможенность, нарушения сна, потеря сознания, предобморочное состояние
Со стороны психики	эйфория	беспокойство, возбуждение	депрессия, раздражительность
Со стороны сердечно-сосудистой системы		ишемия/инфаркт миокарда, стенокардия, аритмия, брадикардия, тахикардия, экстрасистолия, сердцебиение, артериальная гипотензия, артериальная гипертензия, приливы	сердечная недостаточность, фибрилляция, предсердий, колебания артериального давления, венозная недостаточность
Со стороны крови и лимфатической системы		тромбоцитопения, агглютинация эритроцитов	анемия, агранулоцитоз
Со стороны иммунной системы			гиперчувствительность
Со стороны кожи и подкожной клетчатки		эритема, гипергидроз, крапивница	дерматит, зуд, сыпь, гиперемия

<i>Общие нарушения и реакции в месте введения</i>	ощущение жара	астения, слабость дискомфорт в грудной клетке, воспаление/тромбоз в месте инъекции	
<i>Лабораторные показатели</i>	снижение артериального давления	повышение артериального давления, удлинение интервала QT на ЭКГ, депрессия сегмента ST на ЭКГ, повышение уровня мочевины в крови	повышение уровня лактатдегидрогеназы, удлинение интервала PR на ЭКГ, изменения на ЭКГ

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства является важной процедурой. Это позволяет продолжать мониторинг соотношения «польза/риск» для соответствующего лекарственного средства. Медицинским работникам необходимо сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Винпоцетин-Дарница фармацевтически несовместим с гепарином, поэтому их нельзя вводить в одном шприце.

Раствор винпоцетина химически несовместим с инфузионными растворами, содержащими аминокислоты, поэтому их нельзя применять для разведения концентрата Винпоцетин-Дарница.

Упаковка

По 2 мл в ампуле; по 10 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).