

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**

**ВІНПОЦЕТИН-ЛХ**  
**(VINPROSETINE-LH)**

**Склад:**

*діюча речовина:* vinprosetin; етиловий ефір 3α,16α-аповінкамінової кислоти;

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

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

**Лікарська форма.** Таблетки.

**Фармакотерапевтична група.** Психостимулюючі та ноотропні засоби. Код АТС N06B X18.

**Клінічні характеристики.****Показання.**

Неврологія: різні форми порушення мозкового кровообігу, що супроводжуються неврологічними або психічними розладами: стани після інсульту; судинна деменція; вертебро-базиллярна недостатність; атеросклероз судин головного мозку; посттравматична і гіпертензивна енцефалопатія.

Офтальмологія: хронічні судинні захворювання судинної оболонки і сітківки ока.

Отологія: зниження слуху перцептивного характеру, хвороба Мен'єра, дзвін у вухах.

**Протипоказання.**

Підвищена чутливість до будь-якого з компонентів препарату; вагітність та період годування груддю; дитячий вік.

**Спосіб застосування та дози.**

Застосовувати внутрішньо після приймання їжі.

Доза для дорослих становить по 5-10 мг 3 рази на добу (15-30 мг на добу).

При захворюваннях печінки і/або нирок приймають вище зазначені дози.

Тривалість лікування визначає лікар індивідуально.

**Побічні реакції.**

*З боку серця (0,1 %):* депресія сегмента ST, подовження інтервалу QT, тахікардія, екстрасистолія, але наявність причинного зв'язку між такою побічною дією і лікуванням вінпоцетином не доведена, оскільки у природній популяції ці симптоми спостерігаються з такою ж частотою.

*З боку судинної системи (0,8 %):* зміна артеріального тиску (частіше зниження), почервоніння шкіри.

*З боку центральної нервової системи (0,9 %):* порушення сну (безсоння, підвищена сонливість), запаморочення, головний біль, загальна слабкість (симптоми можуть бути проявами основного захворювання).

*З боку системи травлення (0,6 %):* нудота, печія, сухість у роті.

*З боку імунної системи (0,2 %):* алергічні реакції.

**Передозування.**

Симптоми передозування невідомі. За даними літератури доза 60 мг/доба є безпечною. Одноразове застосування 360 мг вінпоцетину не супроводжувалося розвитком ані кардіоваскулярних, ні інших побічних ефектів.

**Застосування в період вагітності або годування груддю.**

Препарат не застосовують під час вагітності або в період годування груддю.

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

***Діти.***

Не рекомендується призначати препарат дітям через відсутність клінічних даних.

***Особливості застосування.***

Наявність синдрому пролонгованого інтервалу QT і застосування препаратів, що зумовлюють подовження інтервалу QT, потребують проведення періодичного контролю ЕКГ.

Препарат містить лактозу, тому пацієнти з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не повинні застосовувати препарат.

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

Враховуючи, що в чутливих хворих при застосуванні препарату можуть виникнути побічні реакції (запаморочення), під час прийому препарату слід утриматися від керування транспортними засобами та виконання інших робіт, що потребують концентрації уваги.

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

Одночасне застосування вінпоцетину з  $\beta$ -блокаторами (хлоранололом, піндололом), клопамідом, глібенкламідом, дигоксином, аценокумаролом або гідрохлоротіазидом у клінічних дослідженнях не супроводжувалося будь-якою взаємодією між ними.

Одночасне застосування вінпоцетину і  $\alpha$ -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.

**Фармакологічні властивості.*****Фармакодинаміка.***

Вінпоцетин має комплексний механізм дії, сприятливо впливаючи на мозковий кровообіг та церебральний метаболізм, а також на реологічні властивості крові.

Вінпоцетин має нейропротективний ефект:

- зменшує вираженість цитотоксичних реакцій, спричинених стимулюючими амінокислотами; інгібує функціональну активність як клітинних трансмембранних натрієвих та кальцієвих каналців, так і рецепторів NMDA і AMPA;
- потенціює нейропротективний ефект аденозину;
- стимулює церебральний метаболізм: посилює поглинання та засвоєння мозком глюкози та кисню;
- підвищує стійкість нейронів до гіпоксії: стимулює транспорт глюкози – універсального джерела енергії для мозку – через гематоенцефалічний бар'єр; спрямовує метаболізм глюкози в енергетично вигідніший аеробний напрям;
- вибірково інгібує  $\text{Ca}^{2+}$ -калмодулін-залежну цГМФ-фосфодієстеразу, підвищує концентрацію циклічного аденозинмонофосфату (цАМФ) і циклічного гуанозинмонофосфату (цГМФ) у тканинах мозку, а також концентрацію аденозинтрифосфату (АТФ) та співвідношення АТФ/АМФ;
- стимулює церебральний метаболізм норадреналіну та серотоніну; стимулює висхідну норадренергічну систему; виявляє антиоксидантну дію.

Вказані механізми дії забезпечують церебропротективний ефект вінпоцетину.

Вінпоцетин покращує мікроциркуляцію у тканинах мозку:

- блокує агрегацію тромбоцитів;
- зменшує патологічно підвищену в'язкість крові;
- збільшує здатність еритроцитів до деформації та гальмує поглинання ними аденозину;
- сприяє внутрішньотканинному транспорту кисню шляхом зменшення спорідненості до нього

еритроцитів.

Вінпоцетин вибірково підсилює мозковий кровоток:

- збільшує мозкову фракцію хвилинного об'єму;
- зменшує опір мозкових судин без значного впливу на параметри загального кровообігу, практично не впливає на артеріальний тиск, хвилинний об'єм, частоту пульсу, загальний периферичний опір;
- не спричиняє феномен "обкрадання" – навпаки, при його застосуванні передусім посилюється кровопостачання ішемізованої, але ще життєздатної ділянки з низьким рівнем перфузії – феномен "зворотного обкрадання".

*Фармакокінетика.*

Швидко всмоктується і через годину після прийому внутрішньо його концентрація в 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 застосуванні він має комплексний механізм лікувальної дії, сприятливо впливаючи на мозковий кровообіг та церебральний метаболізм, а також на реологічні властивості крові.

Максимальна концентрація у тканинах спостерігається через 2-4 години після застосування внутрішньо. Концентрація вінпоцетину у тканинах головного мозку не перевищує його концентрацію в 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 хороший розподіл у тканинах. Кліренс, що дорівнює 66,7 л/годину, перевищує плазмовий об'єм печінки (50 л/год) і свідчить про позапечінковий метаболізм вінпоцетину.

Біотрансформація: головний метаболіт вінпоцетину, апо-вінкамінова кислота (АВК), утворюється в організмі людини в кількості 25-30 % при першому проходженні вінпоцетину через печінку. У порівнянні з внутрішньовенним введенням після застосування препарату внутрішньо величина АUC АВК більша удвічі. 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 в 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  $4,83 \pm 1,29$  год. Виводиться із сечею і каловими масами в співвідношенні 3:2. Виведення АВК здійснюється шляхом клубочкової фільтрації. Час напіввиведення залежить від дози вінпоцетину і режиму дозування.

Літній вік: за даними клінічних досліджень, істотних відмінностей у кінетиці препарату у людей літнього віку та молодих пацієнтів немає, препарат не кумулюється. Особам 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 або майже білого кольору.

**Термін придатності.** 5 років.

### **Умови зберігання.**

Зберігати у захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі не вище +25 °С.

### **Упаковка.**

По 10 таблеток у блістері; по 3 або 5 блістерів у пачці.

