

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КАВІНТОН
(CAVINTON)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: вінпоцетин;

(3 α ,16 α)-ебурнаменин-14-карбоксилової кислоти етиловий ефір;

основні фізико-хімічні властивості: білі або майже білі, плоскі, круглі таблетки з фаскою, без запаху, і гравіруванням "CAVINTON" на одному боці, діаметром близько 9 мм;

склад: 1 таблетка містить 5 мг вінпоцетину;

допоміжні речовини: кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, тальк, крохмал кукурудзяний, лактоза.

Форма випуску. Таблетки.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Вінпоцетин має комплексний механізм лікувальної 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 Ca²⁺-калмодулін-залежну цГМФ-фосфодіестеразу, підвищує концентрацію цАМФ і цГМФ у тканинах мозку, а також концентрацію 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 в 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 – феноме "зворотного обкрадання".

Фармакокінетика. Всмоктування: швидко всмоктується і через годину після прийому внутрішньо його

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

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 введенні препарату найбільша радіоактивність визначається в печінці і шлунково-кишковому тракті. Максимальна концентрація в тканинах спостерігається через 2-4 години після застосування внутрішньо. Концентрація вінпоцетину в 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 гарний розподіл у тканинах. Кліренс, що дорівнює $66,7$ л/год, 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 в стадії насичення становить 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. Людям із захворюваннями печінки і/або нирок препарат призначають у звичайній дозі, відсутність кумуляції дозволяє проводити тривалі курси лікування.

Показання для застосування.

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.

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 зазначені вище дози. Тривалість лікування визначається лікарем індивідуально.

Побічна дія.

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

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

З боку ЦНС (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.

Протипоказання.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Підвищена чутливість до будь-якого з компонентів препарату; вагітність та період годування груддю. Дитячий вік (через відсутність клінічних даних).

Передозування.

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

Особливості застосування.

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

У випадку непереносимості лактози слід враховувати, що одна таблетка Кавінтона містить 140 мг лактози.

Вплив на здатність керувати автомобілем або працювати зі складними механізмами. Даних про вплив вінпоцетину на здатність керувати автомобілем або роботу зі складними механізмами, немає.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Одночасне застосування вінпоцетину з β -блокаторами (хлоранололом, піндололом), 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. Не зважаючи 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 й антикоагулянтними засобами.

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей, захищеному від світла місці при температурі 15 – 30 °С. Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 25 таблеток у блістері, 2 блістери в картонній упаковці.

Виробник. ВАТ “Теден Ріхтер”.

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