

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ПИРАЦЕТАМ

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Пирацетам

Международное непатентованное или группировочное наименование: пирацетам

Лекарственная форма: раствор для внутривенного введения

Состав: 1 мл раствора содержит *действующее вещество:* пирацетам – 200 мг, *вспомогательные вещества:* натрия ацетата тригидрат – 1 мг, уксусная кислота разведенная 30 % – до pH 5,8, вода для инъекций – до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: психоаналептики; психостимуляторы, средства, применяемые при синдроме дефицита внимания с гиперактивностью, и ноотропные средства; другие психостимуляторы и ноотропные средства.

Код АТХ: N06BX03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Пирацетам – ноотропный препарат, который оказывает действие на центральную нервную систему различными путями: модифицирует нейротрансмиссию в головном мозге, улучшает метаболические условия, способствующие нейрональной пластичности и улучшает микроциркуляцию, воздействуя на реологические характеристики крови и не вызывая вазодилатацию.

Применение пирацетама у пациентов с церебральной дисфункцией повышает концентрацию внимания и улучшает когнитивные функции, что проявляется значительными изменениями на электроэнцефалограмме (повышением α и β активности, снижением δ активности).

Пирацетам способствует восстановлению когнитивных способностей после различных церебральных повреждений вследствие гипоксии, интоксикации или электросудорожной терапии.

Пирацетам показан для лечения кортикальной миоклонии как в качестве монотерапии, так и в составе комплексной терапии.

Пирацетам уменьшает длительность спровоцированного вестибулярного нейронита.

Пирацетам ингибирует повышенную агрегацию активированных тромбоцитов и, в случае патологической ригидности эритроцитов, улучшает их деформируемость и способность к фильтрации.

Фармакокинетика

Распределение

Кажущийся объем распределения (Vd) составляет около 0,6 л/кг. Не связывается с белками плазмы крови. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, а также гемодиализные мембраны. При исследовании на животных обнаружено, что пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных долях, в мозжечке и базальных ядрах.

Метаболизм

Пирацетам не метаболизируется.

Выведение

Пирацетам выводится в неизмененном виде почками. Экскреция почками почти (> 95 %) в течение 30 часов. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Период полувыведения из плазмы крови составляет 4 – 5 ч и 8,5 ч – из спинномозговой жидкости. Период полувыведения удлиняется при почечной недостаточности.

Показания к применению

Препарат Пирацетам показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет.

- Симптоматическое лечение интеллектуально-мнестических нарушений, при отсутствии установленного диагноза деменции.
- Уменьшение проявлений кортикальной миоклонии у чувствительных к пирацетаму пациентов как в качестве монотерапии, так и в составе комплексной терапии (в целях определения чувствительности к пирацетаму в конкретном случае может быть проведен пробный курс лечения).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к пирацетаму или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата;
- хорея Гентингтона;
- острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);
- терминальная стадия хронической почечной недостаточности;
- детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Пациентам с тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений (например, при язве желудка), нарушениями гемостаза, геморрагическими цереброваскулярными нарушениями в анамнезе, у пациентов с хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства, у пациентов, принимающих антикоагулянты и

антиагреганты, в т. ч. низкие дозы ацетилсалициловой кислоты. Следует соблюдать осторожность при назначении пациентам с почечной недостаточностью (см. раздел «Способ применения и дозы»). Беременность и период грудного вскармливания (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Достаточные данные о применении пирацетама во время беременности отсутствуют.

Исследования на животных не показали прямого или опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие. Пирацетам проникает через плацентарный барьер. Плазменная концентрация пирацетама у новорожденных достигает 70 – 90 % от таковой у матери. Пирацетам следует применять во время беременности лишь в исключительных случаях, если польза для матери превышает потенциальный риск для плода, а клиническое состояние беременной требует лечения пирацетамом.

Период грудного вскармливания

Пирацетам проникает в грудное молоко. Препарат Пирацетам не следует применять в период кормления грудью или следует прекратить грудное вскармливание при лечении препаратом Пирацетам. При принятии решения о необходимости отмены грудного вскармливания или отказа от лечения препаратом Пирацетам следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

Способ применения и дозы

Дозы следует подбирать строго индивидуально.

Режим дозирования

Взрослые

При интеллектуально-мнестических нарушениях

12 – 24 мл в сутки (2,4 – 4,8 г в сутки) в 2 – 4 приема.

Лечение кортикальной миоклонии

Лечение начинают с дозы 36 мл в сутки (7,2 г в сутки), каждые 3 – 4 дня дозу увеличивают на 24 мл в сутки (4,8 г в сутки) (при использовании формы 1 г/5 мл) до максимальной дозы 120 мл в сутки (24 г в сутки) в 2 – 3 приема.

Применение других препаратов для лечения миоклонии следует продолжить в той же дозировке. В зависимости от полученного эффекта следует по возможности уменьшать дозу этих препаратов.

После начала лечения препаратом Пирацетам терапию продолжают, пока сохраняются симптомы заболевания. У пациентов с острым эпизодом течение заболевания со временем

может измениться, поэтому каждые 6 месяцев следует предпринимать попытки по снижению дозы или отмене препарата. Во избежание внезапного рецидива дозу снижают на 6 мл (1,2 г) каждые 2 дня (в целях предотвращения возможности внезапного рецидива судорог при синдроме Ланса-Адамса каждые 3 – 4 дня).

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

Лицам пожилого возраста дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Пациенты с почечной недостаточностью

Препарат выводится почти исключительно почками, при лечении пациентов с почечной недостаточностью или пациентов, требующих контроля функции почек, следует соблюдать осторожность. Период полувыведения увеличивается прямо пропорционально ухудшению функции почек и клиренса креатинина; это также справедливо в отношении лиц пожилого возраста, у которых экскреция креатинина зависит от возраста.

Дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (КК):

КК для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина ($K_{\text{сыворот}}$), по следующей формуле:

$$KK(\text{мл / мин}) = \frac{[140 - \text{возраст(годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times K_{\text{сыворот}}(\text{мг / дл})}$$

КК для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Почечная недостаточность	Клиренс креатинина (мл/мин)	Дозирование
Норма	> 80	Обычная доза в 2 – 4 приема
Легкая	50 – 79	2/3 обычной дозы в 2 – 3 приема
Средняя	30 – 49	1/3 обычной дозы в 2 приема
Тяжелая	< 30	1/6 обычной дозы однократно
Терминальная стадия	–	Потивопоказано

Пациенты с печеночной недостаточностью

Пациенты с нарушением функции печени в коррекции дозы не нуждаются. Пациентам с нарушением функций и почек, и печени дозирование осуществляется по схеме (см. раздел «Пациенты с почечной недостаточностью»).

Дети

Лекарственный препарат Пирацетам не применяют у детей в возрасте до 18 лет.

Способ применения

Парентеральное введение пирацетама назначается при невозможности применения пероральных форм препарата (бессознательном состоянии, затруднении глотания).

Предпочтительным является внутривенное введение.

Внутривенная инфузия суточной дозы выполняется через катетер с постоянной скоростью на протяжении 24 часов в сутки (например, в начальной стадии лечения тяжелой миоклонии).

Предварительно препарат разводят в одном из совместимых инфузионных растворов: декстрозы 5 %, 10 % или 20 %; фруктозы 5 %, 10 % или 20 %; натрия хлорида 0,9 %; декстрана 40 10 % (в растворе натрия хлорида 0,9 %); растворе Рингера; растворе маннитола 20 %.

Общий объем раствора, предназначенный для введения, определяется с учетом клинических показаний и состояния пациента.

Болюсное внутривенное введение выполняется в течение не менее 2 минут, суточная доза при этом распределяется на несколько введений (2 – 4) с равномерными интервалами так, чтобы доза на одно введение не превышала 15 мл.

У пациентов, получающих пролонгированную терапию и имеющих трудности при внутривенном введении, при появлении возможности рекомендуется перейти на пероральный прием препарата (см. Инструкции по медицинскому применению соответствующих форм препарата). Продолжительность лечения определяется врачом в зависимости от заболевания и с учетом динамики симптомов.

Побочное действие

Перечисленные ниже нежелательные реакции выявлены в клинических исследованиях и по результатам пострегистрационного наблюдения и сгруппированы по системно-органным классам.

Классификация частоты развития нежелательных реакций, рекомендуемая Всемирной организацией здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Данные пострегистрационных наблюдений недостаточны для определения частоты нежелательных реакций.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: кровоточивость.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: анафилактикоидные реакции, гиперчувствительность.

Психические нарушения

Часто: нервозность.

Нечасто: депрессия.

Частота неизвестна: ажитация, тревога, галлюцинации, спутанность сознания.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: гиперактивность.

Нечасто: сонливость.

Частота неизвестна: атаксия, нарушения равновесия, обострение течения эпилепсии, головная боль, бессонница, тремор.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Частота неизвестна: вертиго.

Нарушения со стороны сосудов

Редко: тромбоз, артериальная гипотензия (только при парентеральном введении).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Частота неизвестна: абдоминальная боль (в т. ч. в верхних отделах), тошнота, рвота, диарея.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: дерматит, зуд, крапивница, ангионевротический отек.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Частота неизвестна: усиление сексуального влечения.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Нечасто: астения.

Редко: боль в месте инъекции, лихорадка (только при парентеральном введении).

Лабораторно-инструментальные данные

Часто: увеличение массы тела.

Передозировка

Симптомы: зарегистрирован единичный случай развития диспептических явлений в виде диареи с кровью и абдоминальной болью при приеме препарата внутрь в суточной дозе 75 г, предположительно из-за большой суммарной дозы сорбитола, который ранее входил в состав раствора для приема внутрь. В настоящем препарате сорбитол отсутствует, однако следует соблюдать осторожность.

Прочие симптомы передозировки не зарегистрированы.

Лечение: в случае значительной передозировки следует промыть желудок или вызвать рвоту. Рекомендуется проведение симптоматической терапии, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа для парацетамола составляет 50 – 60 %.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Гормоны щитовидной железы

При одновременном применении пирацетама и экстракта щитовидной железы (трийодтиронин + тироксин) отмечены сообщения о спутанности сознания, раздражительности и нарушении сна.

Аценокумарол

Согласно опубликованному клиническому исследованию у пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г в сутки не влияет на дозу аценокумарола, необходимую для достижения международного нормализованного отношения, равного 2,5 – 3,5, но по сравнению с эффектами одного лишь аценокумарола, добавление пирацетама в дозе 9,6 г в сутки значительно снижает агрегацию тромбоцитов, высвобождение бета-тромбоглобина, концентрацию фибриногена и фактора Виллебранда (VIII: C; VIII: vW: Ag; VIII: vW: RCo), а также вязкость крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под влиянием других лекарственных препаратов низкая, поскольку 90 % пирацетама выводится в неизменном виде с мочой.

В концентрациях 142, 426 и 1422 мкг/мл пирацетам не ингибирует изоферменты цитохрома P450 (CYP 1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11) *in vitro*.

Для концентрации 1422 мкг/мл наблюдалось минимальное ингибирование изофермента CYP 2A6 (21 %) и 3A4/5 (11 %). Однако, нормальные значения константы ингибирования (K_i), вероятно, выходят далеко за пределы концентрации 1422 мкг/мл. Таким образом, метаболические воздействия пирацетама с другими препаратами, маловероятны.

Противосудорожные средства

Прием пирацетама в дозе 20 г в сутки на протяжении 4 недель у пациентов с эпилепсией, получавших стабильные дозы противосудорожных препаратов (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал и вальпроевая кислота), не изменял максимальную и минимальную концентрацию.

Алкоголь

Одновременный прием с алкоголем не влиял на концентрацию пирацетама в плазме; при приеме 1,6 г пирацетама концентрация этанола в плазме не изменялась.

Фармацевтическая несовместимость

Пирацетам совместим (физико-химическая совместимость) с перфузиями растворов: глюкозы 5 %, 10 %, 20 %, фруктозы 5 %, 10 %, 20 %, натрия хлорида 0,9 %, Декстран 40 10 % (в 0,9 % растворе натрия хлорида), Рингера, маннитола 20 %, HES

(гидроксиэтилкрахмал) 6 % и 10 %. Была продемонстрирована стабильность данных растворов в течение минимального периода в 24 часа.

Особые указания

Влияние на агрегацию тромбоцитов

Вследствие антиагрегантного эффекта препарата Пирацетам следует назначать с осторожностью пациентам с тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений (например, при язве желудка), нарушениями гемостаза, геморрагическими цереброваскулярными нарушениями в анамнезе, у пациентов с хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства, у пациентов, принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в т.ч. низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

Почечная недостаточность

Поскольку препарат Пирацетам выводится почками, следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Лица пожилого возраста

При длительном лечении лиц пожилого возраста необходим регулярный контроль клиренса креатинина, поскольку может потребоваться коррекция дозы (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Отмена терапии

При лечении пациентов с кортикальной миоклонией следует избегать резкого прерывания лечения, что может вызвать возобновление приступов.

Вспомогательные вещества

При лечении пациентов, находящихся на гипонатриевой диете, рекомендуется учитывать, что раствор пирацетама содержит менее 1 ммоль (или приблизительно 23 мг) натрия в 24 г пирацетама, то есть по сути, «не содержит натрия».

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Препарат оказывает влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Учитывая профиль нежелательных реакций, в период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами, работе с механизмами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного введения 200 мг/мл.

По 5 мл в ампулы нейтрального стекла марки НС-3 или 1-го гидролитического класса.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки, изготовленной из полимерных материалов.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (ампулы в пачке) для защиты от света.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии потребителя

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»), Российская Федерация, 654034, Кемеровская обл. - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3, тел. (3843) 994-222, root@organica.su.