

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ПИРАЦЕТАМ

Регистрационный номер: ЛС-001303

Торговое наименование: Пирацетам

Международное непатентованное наименование: Пирацетам

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав (на 1 мл)

Действующее вещество:

Пирацетам - 200,0 мг

Вспомогательные вещества:

Натрия ацетата тригидрат - 1,0 мг

Уксусная кислота - до pH 5,8

Вода для инъекций - до 1,0 мл

Описание: прозрачный бесцветный или слегка окрашенный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: ноотропное средство.

Код АТХ: N06BX03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Пирацетам – ноотропное средство, оказывает действие на центральную нервную систему различными путями: модифицирует нейротрансмиссию в головном мозге; улучшает метаболические условия, способствующие нейрональной пластичности; 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 сопровождается значительными изменениями на электроэнцефалограмме (повышением α и β активности, снижением δ активности).

Способствует восстановлению когнитивных функций вследствие 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.

Уменьшает продолжительность вызванного 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 (V_d) 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

Не метаболизируется.

Выведение

Период полувыведения пирацетама из плазмы крови ($T_{1/2}$) составляет 4-5 ч и 8,5 ч из спинномозговой жидкости; период полувыведения удлиняется при почечной недостаточности.

Выводится почками в неизменном виде. Экскреция почками почти полная (> 95 %) в течение 30 часов.

Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Показания к применению

- 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

- Гиперчувствительность к пирацетаму или другим производным пирролидона, а также другим компонентам препарата;
- хорея Гентингтона;
- острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);
- терминальная стадия хронической почечной недостаточности (ХПН);
- детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

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 том числе низкие дозы ацетилсалициловой кислоты. Следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Достаточные данные о применении парацетама во время беременности отсутствуют. Исследования на животных не показали прямого или опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие.

Парацетам проникает через плацентарный барьер. Плазменная концентрация парацетама у новорожденных достигает 70-90 % от таковой у матери. Парацетам следует назначать во время беременности лишь в исключительных случаях, если польза для матери превышает потенциальный риск для плода, а клиническое состояние беременной требует лечения парацетамом.

Период грудного вскармливания

Парацетам проникает в грудное молоко. Парацетам не следует применять в период грудного вскармливания или его следует прекратить при лечении парацетамом. При принятии решения о необходимости отмены грудного вскармливания или отказа от лечения парацетамом следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

Способ применения и дозы

Внутривенно струйно или капельно, внутримышечно.

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

Предпочтительным является внутривенное введение.

Внутривенное введение осуществляют в течение нескольких минут; при внутривенном инфузионном введении суточную дозу вводят через катетер с постоянной скоростью на протяжении 24 часов.

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.

Пациентам, получающим пролонгированную терапию и имеющим трудности при внутривенном введении, при появлении возможности рекомендуется перейти на пероральный прием препарата. Продолжительность лечения определяется врачом в зависимости от заболевания и с учетом динамики симптомов.

Последнюю дозу принимают не позднее 17 ч (для предотвращения нарушения сна).

Лечение интеллектуально-мнестических нарушений: по 2,4-4,8 г/сут в 2-4 приема как назначено врачом индивидуально пациенту.

Лечение кортикальной миоклонии: начинают с дозы 7,2 г/сут, каждые 3-4 дня дозу увеличивают на 4,8 г/сутки до достижения максимальной дозы 24 г/сут 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 пирацетамом терапию продолжают до тех пор, 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 1,2 г каждые 2 дня (в целях предотвращения возможности внезапного рецидива судорог при синдроме Ланса-Адамса каждые 3-4 дня).

Дозирование пациентам с нарушением функции почек

Пирацетам выводится почти исключительно почками, при лечении пациентов с почечной недостаточностью или требующих контроля функции почек следует соблюдать осторожность.

Период полувыведения увеличивается прямо пропорционально ухудшению функции почек и клиренса креатинина; это также справедливо в отношении пожилых, у которых экскреция креатинина зависит от возраста.

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

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

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

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

Дозу корректируют в соответствии с нижеприведенной таблицей:

Функция почек	КК (мл/мин)	Режим дозирования
Норма	>80	стандартная доза в 2-4 приема
Легкая почечная недостаточность	50-79	2/3 стандартной дозы в 2-3 приема
Средняя почечная недостаточность	30-49	1/3 стандартной дозы в 2 приема
Тяжелая почечная недостаточность	<30	1/6 стандартной дозы однократно
Терминальная почечная недостаточность	-	противопоказано

Пожилые пациенты

Пожилым пациентам дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Дозирование пациентам с нарушением функции печени

Пациенты с изолированным нарушением функции печени в коррекции дозы не нуждаются. Пациентам с нарушением функции и почек, и печени дозирование осуществляется по схеме (см. выше «Дозирование пациентам с нарушением функции почек»).

Побочное действие

Перечисленные ниже нежелательные реакции сгруппированы по системно-органным классам согласно MedDRA. Градация частоты определяется следующим образом: *очень часто* ($\geq 1/10$), *часто* (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), *нечасто* (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), *редко* (от $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), *очень редко* (от $< 1/10000$) и *частота неизвестна* (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны крови и лимфатической системы: частота неизвестна – кровоточивость.

Со стороны иммунной системы: частота неизвестна – анафилактические реакции, гиперчувствительность.

Со стороны психики: часто – нервозность; нечасто – депрессия; частота неизвестна – ажитация, тревога, спутанность сознания, галлюцинации.

Со стороны нервной системы: часто – гиперактивность; нечасто – сонливость; частота неизвестна – головная боль, бессонница, нарушения равновесия, атаксия, обострение течения эпилепсии, тремор.

Со стороны органа слуха и лабиринта: частота неизвестна – вертиго.

Со стороны сосудов: редко – тромбофлебит, артериальная гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: частота неизвестна – абдоминальная боль (в т.ч. в верхних отделах), диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: частота неизвестна – дерматит, зуд, крапивница, ангионевротический отек.

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 введения, лихорадка (только при парентеральном введении).

Лабораторно-инструментальные данные: часто – повышение массы тела.

Передозировка

Симптомы: усиление возможных побочных эффектов.

Лечение: индукция рвоты, промывание желудка, симптоматическая терапия, гемодиализ (эффективность 50-60 %). Специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Гормоны щитовидной железы

При одновременном применении пирацетама и экстракта щитовидной железы (трийодтиронин + тироксин) отмечались спутанность сознания, раздражительность и нарушение сна.

Аценокумарол

Согласно опубликованному слепому клиническому исследованию у пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г/сут 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/сут значительно снижает агрегацию тромбоцитов, высвобождение β -тромбоглобулина, концентрацию фибриногена и фактора Виллебранда (VIII: C; VIII: vW: Ag; VIII: vW: RCo), а также вязкость цельной 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 мг/мл пирацетам не ингибирует изоферменты цитохрома P450 (CYP 1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 4A9/11) *in vitro*.

В концентрации 1422 мг/мл наблюдалось минимальное ингибирование изофермента CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако, значения константы ингибирования (K_i), вероятно, выходят далеко за пределы концентрации 1422 мг/мл. Таким образом, метаболические взаимодействия пирацетама с другими препаратами маловероятны.

Противосудорожные средства

Прием пирацетама в дозе 20 г/сут на протяжении 4 недель у пациентов с эпилепсией, принимавших постоянные дозы противоэпилептических препаратов (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, вальпроевая кислота), не изменял их максимальную и минимальную концентрацию.

Алкоголь

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

Фармацевтическая совместимость

Сведения о фармацевтической несовместимости отсутствуют.

Фармацевтически совместим с растворами декстрозы (5 %, 10 %, 20 %), фруктозы (5 %, 10 %, 20 %), 0,9 % раствором натрия хлорида, раствором Рингера, 20 % раствором маннитола, раствором гидроксиэтилкрахмала (6 %, 10 %), 10 % раствором декстрана 40 (в 0,9 % растворе натрия хлорида).

Особые указания

Влияние на агрегацию тромбоцитов

Вследствие антиагрегантного эффекта (см. раздел «Фармакодинамика») 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 том числе низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

Почечная недостаточность

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

Пожилые пациенты

При длительном лечении пожилых пациентов необходим регулярный контроль клиренса креатинина, поскольку может потребоваться коррекция дозы.

Отмена терапии

При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прерывания лечения, так как это может вызвать возобновление приступов.

Натрий

При лечении пациентов, находящихся на гипонатриевой диете, рекомендуется учитывать, что раствор препарата Пирацетам содержит менее 1 ммоль (или приблизительно 23 мг) натрия в 24 г пирацетама.

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 200 мг/мл.

По 5 мл в ампулы с точкой или кольцом излома нейтрального стекла марки НС-1, НС-3 или стекла с классом сопротивления гидролизу HGA1 (первый гидролитический).

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ).

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

5 или 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары с гофрированным вкладышем.

Упаковка для стационаров. 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

50 или 100 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в коробку из картона гофрированного.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20,
стр. 2

Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20
тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24