

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Пирацетам

раствор для внутривенного и внутримышечного введения 200 мг/мл

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: ПИРАЦЕТАМ

Международное непатентованное название (МНН): Пирацетам

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Состав:

активное вещество – пирацетам 200 мг;

вспомогательные вещества:

натрия ацетата тригидрат – 1 мг,

кислота уксусная разведенная 30 % до pH 5, 8,

вода для инъекций – до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

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 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 изменениями на электроэнцефалограмме (повышением α и β активности, снижением δ активности).

Способствует восстановлению когнитивных функций вследствие различных нарушений, таких как гипоксия, интоксикация или электросудорожная терапия.

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.

Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, удаляется при гемодиализе. Объем распределения составляет 0,6 л/кг. При исследовании на животных пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного

мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных долях, в мозжечке и базальных ядрах. Не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме и выделяется почками в неизменном виде путем почечной фильтрации. Почечный клиренс пирacetам у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин. Период полувыведения препарата из плазмы крови составляет 4-5 часов, из спинномозговой жидкости – 8,5 часов, период полувыведения удлиняется при почечной недостаточности (при терминальной хронической почечной недостаточности – до 59 ч). Фармакокинетика пирacetам не изменяется у больных с печеночной недостаточностью.

Показания к применению

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

Противопоказания

Гиперчувствительность к пирacetам или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата. Геморрагический инсульт. Терминальная стадия хронической почечной недостаточности. Болезнь Гентингтона.

С осторожностью:

Нарушение гемостаза, обширные хирургические вмешательства, тяжелое кровотечение, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина 20-80 мл/мин).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

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

Пирacetам проникает через плацентарный барьер. Концентрация препарата у новорожденных достигает 70-90 % от концентрации его в крови у матери. За исключением особых обстоятельств, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода, а клиническое состояние беременной требует лечения пирacetамом, пирacetам не должен назначаться во время беременности.

Кормление грудью

Пирacetам проникает в грудное молоко. Пирacetам не следует применять в период кормления грудью или следует прекратить грудное вскармливание при лечении пирacetамом. При принятии решения о необходимости отмены грудного вскармливания или отказа от лечения пирacetамом следует

соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

Способ применения и дозы

При невозможности перорального приема пирацетам вводят внутривенно.

При расстройствах памяти, интеллектуальных нарушениях

По 2,4-4,8 г/сут в несколько приемов в течение первых нескольких недель, затем переходят на поддерживающую терапию 2,4 г/сут в 2-3 приема, возможен прием 1,2 г/сут.

Лечение кортикальной миоклонии

Лечение начинают с 7,2 г в сутки, повышая ее на 4,8 г каждые 3-4 дня вплоть до 24 г, разделенных на 2-3 введения. Дозу остальных препаратов для лечения миоклонии не изменяют. В дальнейшем по результатам лечения, необходимо, по возможности, снизить дозу других лекарственных препаратов для лечения миоклонии.

После начала лечения пирацетамом лечение 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 1,2 г каждые 2 дня (в целях предотвращения возможности внезапного рецидива судорог при синдроме Ланса-Адамса – каждые 3-4 дня).

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

Пожилые пациенты

Пожилым пациентам с почечной недостаточностью следует проводить коррекцию дозы (см. ниже «Почечная недостаточность»). При длительном лечении в целях определения необходимости коррекции дозы следует регулярно проводить оценку клиренса креатинина.

Почечная недостаточность

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

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

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

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

Печеночная недостаточность

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 «Почечная недостаточность»).

Побочное действие

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

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

Со стороны иммунной системы: частота неизвестна – гиперчувствительность, анафилактоидные реакции, ангионевротический отек.

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, нарушение равновесия, атаксия, обострение течения эпилепсии, тремор.

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

Со стороны сосудов: редко – тромбоз, артериальная гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: частота неизвестна – тошнота, рвота, диарея, абдоминальная боль.

Со стороны обмена веществ: часто – повышение массы тела.

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

Со стороны репродуктивной системы: частота неизвестна – усиление сексуального влечения.

Общие нарушения и расстройства в месте введения: нечасто – астения; редко – боль в месте введения, лихорадка.

Передозировка

Симптомы: усиление возможных побочных действий.

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

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Гормоны щитовидной железы

При одновременном применении пираретама 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 пираретам 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 пираретама 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 пираретама под влиянием других лекарственных препаратов низкая, поскольку 90 % пираретама выводится в неизменном виде с мочой.

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

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 пираретама с другими препаратами маловероятны.

Противосудорожные средства

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

Алкоголь

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

Фармацевтическая совместимость

Сведения о фармацевтической несовместимости отсутствуют.

Особые указания

Вследствие антиагрегантного эффекта (см. раздел «Фармакодинамика»), с осторожностью назначают пациентам с нарушением гемостаза, тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений, перед предстоящими хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства, у пациентов принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в т.ч. низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

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

При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прекращения лечения, т.к. это может вызвать возобновление приступов.

При длительной терапии у пациентов пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль функции почек, при необходимости проводят коррекцию дозы в зависимости от клиренса креатинина.

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и 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 бесцветного стекла 1 гидролитического класса с точкой излома.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку. 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

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

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

ОАО «Фармстандарт-УфаВИТА», Россия, 450077, Республика Башкортостан, г. Уфа, ул. Худайбердина, д. 28,
тел./факс: (347) 272 92 85,
www.pharmstd.