

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПИРАЦЕТАМ

Торговое название: Пирацетам.

Действующее вещество (МНН): пирацетам

Лекарственная форма: раствор для инъекций 20%.

Состав:

1 л раствора содержит:

активное вещество: пирацетам - 200,0 мг.

вспомогательные вещества: натрия ацетат тригидрат; кислота уксусная разведенная; вода для инъекций до 1 мл.

Описание: прозрачный, бесцветный или слегка желтоватый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: ноотропное лекарственное средство.

Код АТХ: N06BX03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Пирацетам – ноотропное средство со сложным механизмом действия, является циклическим производным гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК). Пирацетам непосредственно воздействует на головной мозг. Улучшает когнитивные процессы, такие как способность к обучению, память, внимание, способность к запоминанию, а также повышает умственную работоспособность, без развития седативного и психостимулирующего эффекта.

Оказывает влияние на ЦНС различными путями: изменяет скорость распространения возбуждения в головном мозге, улучшает нейрональную пластичность и метаболические процессы в нервных клетках. Улучшает взаимодействие между полушариями головного мозга и синаптическую проводимость в неокортикальных структурах, повышает умственную активность, улучшает мозговой кровоток.

Пирацетам улучшает микроциркуляцию в головном мозге, воздействуя на реологические характеристики крови, и не вызывает сосудорасширяющего действия. Ингибирует агрегацию тромбоцитов и восстанавливает эластичность мембраны эритроцитов, а также способность последних к прохождению через микроциркуляторное русло. Уменьшает адгезию эритроцитов.

Пирацетам оказывает протекторное и восстанавливающее действие при нарушении функции головного мозга вследствие гипоксии, интоксикации или травмы. Уменьшает выраженность и длительность вестибулярного нистагма.

Фармакокинетика

Распределение

Биодоступность препарата составляет около 100%. Объем распределения (V_d) составляет около 0,6 л/кг. Пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных долях, в мозжечке и базальных ядрах.

Пирацетам не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер и мембраны.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) пирацетама из плазмы крови составляет 4-5 часов и 8,5 часов из спинномозговой жидкости.

80-100% парацетама выводится почками в неизменном виде, путём почечной фильтрации. Почечный клиренс парацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Парацетам проникает через мембраны, используемые при гемодиализе. Фармакокинетика парацетама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью. При почечной недостаточности $T_{1/2}$ парацетама удлиняется.

Показания к применению

- симптоматическое лечение психоорганического синдрома, в частности у пожилых пациентов, сопровождающегося нарушением памяти, головокружением, пониженной концентрацией внимания и общей активности, изменением настроения, расстройством поведения, нарушением походки, а также у пациентов с болезнью Альцгеймера и сенильной деменцией альцгеймеровского типа;
- лечение последствий нарушений мозгового кровообращения (в т. ч. ишемического инсульта), таких как афазия (нарушения речи), нарушения эмоциональной сферы, двигательной и психической активности;
- в составе комплексной терапии при лечении хронического алкоголизма, для лечения психоорганического, абстинентного синдромов и когнитивных нарушений;
- в период восстановления после травм и интоксикаций головного мозга;
- лечение головокружения (вертиго) и связанных с ним расстройств равновесия, за исключением головокружения вазомоторного и психического происхождения;
- для лечения кортикальной миоклонии в качестве моно- или комплексной терапии;
- купирование (парентерально) серповидно-клеточного вазооклюзионного криза;
- в составе комплексной терапии дислексии (низкая обучаемость) у детей, особенно в случаях приобретения специфических навыков чтения, письма, счета, которые не могут быть объяснены умственной отсталостью, неадекватным обучением или особенностями семейной обстановки, включая логопедическое лечение.

Способ применения и дозы

Вводят внутривенно (в/в), медленно струйно или капельно, или внутримышечно (в/м).

Парентеральное введение парацетама назначается при невозможности применения пероральных форм препарата, например, при затруднении глотания, или когда пациент находится в коме.

Доза зависит от тяжести заболевания, состояния организма, данных лабораторных исследований, возраста, веса и функции почек у пациента.

Назначают в суточной дозе 30-160 мг/кг (3-12 г/сут), кратность введения – 2-4 раза/сут.

При *симптоматическом лечении хронического психоорганического синдрома* в зависимости от выраженности симптомов назначают 1,2-2,4 г/сут, а в течение первой недели – 4,8 г/сут.

При *лечении последствий инсульта* назначают 4,8 г/сут.

При *алкогольном абстинентном синдроме* – 12 г/сут. Поддерживающая доза – 2,4 г/сут.

Лечение *головокружения и связанных с ним расстройств равновесия* назначают 2,4-4,8 г/сут.

При *кортикальной миоклонии* лечение начинают с дозы 7,2 г/сут, каждые 3-4 дня дозу повышают на 4,8 г/сут. до достижения максимальной дозы 24 г/сут. В дальнейшем переходят на пероральную форму препарата. Лечение продолжают на протяжении всего периода болезни. Каждые 6 месяцев следует предпринять попытку уменьшить дозу или отменить препарат, постепенно сокращая дозу на 1,2 г каждые 2 дня (3-4 дня при синдроме Ланса-Адамса) с целью предотвращения приступа. При отсутствии эффекта или незначительного терапевтического эффекта лечение прекращают.

При лечении коматозных состояний, а также трудностей восприятия у лиц с травмами препарат вводят в/м или в/в в начальной дозе 9-12 г/сут, поддерживающая доза – 2,4 г/сут. Лечение продолжают не менее 3 недель.

Купирование (парентерально) серповидно-клеточного вазоокклюзионного криза – применяют в дозе 300 мг/кг массы тела, разделяя на 4 дозы.

В составе комплексной терапии дислексии у детей в возрасте от 8 лет назначают в дозе 3,2 г/сут., разделяя на 2 введения с возможным переходом на пероральную форму. Лечение продолжается в течение всего учебного года.

Купирование серповидно-клеточного вазоокклюзионного криза у детей старше 3 лет – 300 мг/кг массы тела, разделяя на 4 приёма.

Раствор Пирацетама совместим со следующими инфузионными растворами:

- раствор натрия хлорида 0,9%;
- раствор глюкозы (декстрозы) 5%, 10%, 20%;
- раствор фруктозы 5%, 10%, 20%;
- раствор левулозы 5%;
- раствор декстрана 40, 10% в 0,9% растворе натрия хлорида;
- раствор декстрана 100 6% в 0,9% растворе натрия хлорида;
- раствор Рингера;
- раствор Рингера с лактатом;
- раствор маннитол-декстрана;
- раствор гидроксиэтилкрахмала 6%.

Инфузионные растворы пирацетама стабильны не менее 24 часов.

Способ применения и дозы в особых клинических случаях

У пациентов с нарушениями функции почек требуется коррекция режима дозирования в зависимости от клиренса креатинина (КК):

Степень почечной недостаточности	КК (мл/мин)	Доза
Норма	>80	Обычная доза
Легкая	50-79	2/3 обычной дозы в 2-3 приёма
Средняя	30-49	1/3 обычной дозы в 2 приёма
Тяжелая	<30	1/6 обычной дозы, однократно
Терминальная стадия	-	противопоказано

У пациентов пожилого возраста дозу корректируют при наличии почечной недостаточности и при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

У пациентов с нарушениями функции печени коррекции режима дозирования не требуется.

Побочные действия

Аллергические реакции: редко – дерматит, зуд, высыпания, отёк, крапивница, очень редко – анафилаксия, ангионевротический отёк (отёк Квинке).

Со стороны нервной системы: очень редко – гиперкинезы, раздражительность, сонливость, депрессия, астения (общая слабость и утомляемость); в единичных случаях – головокружение (в т. ч. вертиго), головная боль, атаксия (нарушение походки), тремор, спутанность сознания, нарушение равновесия, обострение течения эпилепсии, бессонница, замешательство, возбуждение, тревога, галлюцинации, повышение либидо.

Со стороны кроветворной системы: кровоточивость.

Со стороны сердца и сосудов: снижение или повышение артериального давления.

Со стороны пищеварительной системы: очень редко – тошнота, рвота, диарея, абдоминальная боль, эпигастральная боль.

Со стороны обмена веществ: повышение массы тела.

Прочие: боль в месте введения, тромбоз, гипертермия, астения.

Побочные эффекты чаще возникают у пациентов пожилого возраста, получающих препарат в дозе более 2,4 г/сут, и в большинстве случаев исчезают при снижении дозы.

Противопоказания

-повышенная чувствительность к пираретаму или производным пирролидона также других компонентам препарата;

-геморрагические нарушения мозгового кровообращения (в т. ч. геморрагический инсульт);

-психомоторное возбуждение на момент назначения препарата;

-Хорея Гентингтона;

-тяжёлая хроническая почечная недостаточность (при КК менее 20 мл/мин);

-детский возраст до 1 года;

С осторожностью:

-нарушение гемостаза;

-обширные хирургические вмешательства;

-тяжелое кровотечение;

-хроническая почечная недостаточность (при клиренсе креатинина (КК) менее 20-80 мл/мин).

Лекарственные взаимодействия

При одновременном применении с препаратами, стимулирующими ЦНС, может усилить их стимулирующий эффект.

При одновременном применении с нейролептиками может усилить дискинезию.

При одновременном применении с гормонами щитовидной железы (Т3+Т4) (экстракт щитовидной железы) может усилить центральные эффекты (возможна повышенная раздражительность, тремор, беспокойство, спутанное состояние сознания, дезориентация и нарушения сна).

При одновременном применении с циннаризином усиливается эффект пираретама.

Этилтиобензимидазол усиливает эффекты пираретама.

При сочетанном применении с пираретамом (в составе комбинации пираретам + тиотриазолин) усиливается эффект антиангинальных лекарственных средств.

Не отмечено взаимодействия с клоназепамом, фенитоином, фенобарбиталом, вальпроатом натрия.

Пираретам в высоких дозах (9,6 г/сут) повышает эффективность аценокумарола у пациентов с венозным тромбозом (отмечалось более выраженное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллебранда, вязкости крови и плазмы по сравнению с применением только аценокумарола).

Возможность изменения фармакодинамики пираретама под влиянием других лекарственных препаратов низкая, т.к. 90% препарата выводится в неизменном виде с мочой.

In vitro пираретам не угнетает изоферменты CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11 в концентрации 142, 426 и 1422 мкг/мл. При концентрации пираретама 1422 мкг/мл отмечено небольшое угнетение CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако уровень Ki данных двух изоферментов достаточный при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с другими препаратами маловероятно.

Пирацетам (в составе комбинации пирацетам + тиотриазолин) не угнетает изоферменты цитохрома P450. Метаболическое взаимодействие с другими лекарственными средствами маловероятно.

Приём пирацетама в дозе 20 мг/сут не изменял пик и кривую уровня концентрации противосудорожных препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, вальпроат) у больных эпилепсией, получающих препарат в постоянной дозе.

Совместный приём с этанолом не влиял на уровень концентрации пирацетама в сыворотке, концентрация этанола в сыворотке крови не изменялась при приёме 1,6 г пирацетама. Комбинация пирацетам+циннаризин усиливает эффекты этанола.

Комбинацию пирацетам + тиотриазолин не следует одновременно применять с лекарственными средствами, имеющими кислое значение pH.

Особые указания

Раствор, который будет применяться, должен быть прозрачным, комнатной температуры, а флакон – герметичным. Не вводить помутневший раствор или из поврежденной ёмкости. В связи с влиянием пирацетама на агрегацию тромбоцитов с осторожностью следует назначать препарат пациентам с нарушением гемостаза, во время больших хирургических операций или больным с симптомами тяжёлого кровотечения.

При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прерывания лечения, что может вызвать возобновление приступов.

При эпилепсии и других спазмофиллических состояниях пирацетам может снижать порог судорожной готовности. Для изменения установленной противосудорожной терапии больных эпилепсией необходима подробная консультация специалиста, даже если пирацетам улучшит состояние пациента.

При длительной терапии пациентам пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль показателей функции почек, при необходимости проводят коррекцию дозы в зависимости от результатов исследования КК.

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Принимая во внимание возможные побочные эффекты, пациент должен соблюдать осторожность при вождении автомобиля и работе с механизмами.

Применение при беременности и лактации

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата при беременности не проводилось.

Применение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Пирацетам проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком. Концентрация пирацетама в крови у новорожденных достигает 70-90% от его концентрации в крови у матери. При необходимости применения в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Передозировка

Симптомы: абдоминальная боль, диарея с примесью крови.

Лечение: симптоматическое, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа для пирацетама составляет 50-60%.

Форма выпуска

Препарат по 5 мл или 10 мл в ампулах из стекла, или полипропилена, или полиэтилена медицинского. По 5 ампул в контурно ячеевых упаковках. 2 контурно ячеевые упаковки в пачки или по 5, 10, 20, 30, 40 или 50 ампул в виде цельных блоков вместе с инструкцией по применению вкладывают в коробку из картона коробочного.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

Наименование и адрес организации принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан:

СП ООО "Jurabek Laboratories"

Республика Узбекистан, 100003, г. Ташкент, ул. Алмазар 165,

тел/факс: (99878) 150-03-03

Web: www.jurabek.uz