

Состав

действующее вещество: пирацетам;

1 мл раствора содержит пирацетама 200 мг;

другие составляющие: натрия ацетат тригидрат, уксусная кислота ледяная, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или со слегка желтоватым оттенком жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Психостимулирующие и ноотропные средства.

Код АТХ N06B X03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Пирацетам является ноотропным средством, то есть психотропным препаратом, непосредственно улучшающим эффективность когнитивных функций.

Механизмов воздействия препарата на ЦНС, вероятно, несколько: изменение скорости распространения возбуждения в головном мозге; усиление метаболических процессов в нервных клетках; улучшение микроциркуляции путем воздействия на реологические характеристики крови, при этом сосудорасширяющее действие отсутствует.

Длительное или однократное применение пирацетама пациентам с церебральной дисфункцией приводит к значительным изменениям на электроэнцефалограмме, которые демонстрируют повышение внимательности и улучшение когнитивной функции (повышенная α - и β -активность и пониженная δ -активность).

Пирацетам ингибирует гиперагрегацию активированных тромбоцитов. При патологической ригидности эритроцитов пирацетам повышает их способность к фильтрации и эластичность. Пирацетам оказывает протекторное и восстановительное действие при нарушении функций головного мозга

вследствие гипоксии, интоксикации и электрошоковой терапии.

Пирацетам применяют как монопрепарат или в составе комплексного лечения кортикальной миоклонии для снижения выраженности провоцирующего фактора – вестибулярного нейронита.

Фармакокинетика.

После однократного введения 2 г препарата максимальная концентрация (C_{max}) достигается в плазме крови через 30 мин, а в спинномозговой жидкости – в течение 2–8 ч и составляет 40–60 мкг/мл. Пирацетам распределяется по всем тканям и проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры и мембраны, используемые при гемодиализе. Пирацетам не связывается с белками плазмы крови, а накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных зонах, мозжечке и базальных ганглиях. Объем распределения пирацетама составляет около 0,6 л/кг.

Пирацетам активен в неизмененном виде и не метаболизируется у животных.

Период полувыведения из крови составляет 4–5 часов и 6–8 часов — из спинномозговой жидкости. Этот период может удлиняться при почечной недостаточности. Пирацетам выводится почками в неизмененном виде. Выводится с мочой практически полностью (более 95%) через 30 часов. Почечный клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Показания

Применять взрослым:

для симптоматического лечения патологических состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами, за исключением диагностированной деменции (слабоумия);

для лечения кортикальной миоклонии – как монопрепарат или в составе комплексной терапии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к пирацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам лекарственного средства;

острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);

терминальная стадия почечной недостаточности;

хорея Гантингтона.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Тиреоидные гормоны. При совместном применении с тиреоидными гормонами возможна повышенная раздражительность, дезориентация и нарушение сна.

Аценокумарол. Клинические исследования показали, что у больных с тяжелым течением рецидивирующего тромбоза применение пирацетама в дозе 9,6 г/сут не требовало изменения дозировки аценокумарола для достижения значения МНВ [международное нормализованное отношение] 2,5–3,5, но при его одновременном применении отмечалось значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, высвобождения β -тромбоглобулина, уровней фибриногена, факторов Виллебранда [коагуляционная активность (VIII: C), кофакторы ристоцетина (VIII: vW: Rco) и протеина в плазме крови (VIII: vW: Ag;)] цельной крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия. Вероятность изменения фармакокинетики пирацетама под действием других лекарственных средств низка, поскольку примерно 90% препарата выводится в неизмененном виде с мочой.

In vitro пирацетам не ингибирует основные изоформы цитохрома P450 человека CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11 в концентрациях 142, 426 и 1422 мкг/мл.

При концентрации 1422 мкг/мл отмечено незначительное угнетение CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако уровень Ki для ингибирования этих двух CYP-изомеров достаточен при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, подвергающимися биотрансформации этими ферментами, маловероятно.

Противоэпилептические лекарственные средства. Применение пирацетама в дозе 20 г ежедневно в течение 4 недель и более не изменяло кривую концентрации и C_{max} противоэпилептических препаратов в сыворотке крови (карбамазепина, фенитоина, фенобарбитала, натрия вальпроата) у больных эпилепсией, получающих стабильные дозы.

Алкоголь. Совместимый прием с алкоголем не влиял на уровень концентрации пирацетама в плазме крови и концентрация алкоголя не изменялась при применении 1,6 г пирацетама.

Особенности по применению

Воздействие на агрегацию тромбоцитов. В связи с тем, что пирацетам снижает агрегацию тромбоцитов (см. раздел Фармакодинамика), необходимо с осторожностью назначать препарат больным с нарушением гемостаза, состояниями, которые могут сопровождаться кровоизлияниями (язва желудочно-кишечного тракта), во время крупных хирургических операций (включая стоматологические вмешательства), больным с симптомами тяжелого кровотечения или больным, имеющим в анамнезе геморрагический инсульт, пациентам, применяющим антикоагулянты, тромбоцитарные антиагреганты, включая низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

Препарат выводится почками, поэтому необходимо особое внимание уделять больным с почечной недостаточностью.

Пациенты пожилого возраста. При длительной терапии у больных пожилого возраста рекомендуется регулярно контролировать показатели функции почек, при необходимости корректировать дозу в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина (см. способ применения и дозы).

При лечении больных кортикальной миоклонией следует избегать резкого прерывания лечения в связи с угрозой генерализации миоклонии или возникновения судорог.

Лекарственное средство содержит 1 ммоль (23 мг) натрия на 24 г пирацетама. Это необходимо учитывать, если пациент соблюдает диету с контролем содержания натрия.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Не следует применять лекарственное средство в период беременности и кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Учитывая побочные реакции, которые наблюдаются при применении этого лекарственного средства, воздействие на способность управлять транспортными средствами и работать с другими механизмами возможно, и это следует учитывать.

Способ применения и дозы

Пирацетам в виде инъекционного раствора применяют при невозможности применения пероральных форм препарата.

Лекарственное средство применять путем в/в инъекции (вводить медленно, в течение нескольких минут) или инфузии (в течение 24 часов непрерывно).

Назначать взрослым.

Лечение состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами

Рекомендуемая суточная дозировка составляет от 2,4 г до 4,8 г, которые распределяют на 2 или 3 введения.

Лечение кортикальной миоклонии

Начальная суточная доза составляет 7,2 г, которую увеличивают на 4,8 г каждые три или четыре дня до максимальной дозы 24 г, распределяемой на два или три введения. Лечение другими антимиоклоническими лекарственными средствами следует продолжать в одних и тех же дозах. В зависимости от полученного терапевтического эффекта, по возможности, следует снизить дозу других антимиоклонических лекарственных средств.

Лечение пирацетамом следует продолжать до исчезновения симптомов первичного заболевания мозга. У пациентов с острым течением заболевания со временем может наблюдаться спонтанное улучшение, поэтому каждые 6 месяцев следует попытаться снизить дозу или отменить лечение препаратом. С этой целью дозу пирацетама снижают на 1,2 г каждые два дня (каждые три или четыре дня в случае синдрома Ланца-Адамса с целью предупреждения внезапного рецидива или возникновения судорог, связанных с отменой препарата).

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с диагностированными или подозреваемыми нарушениями функции почек (см. раздел «Пациенты с нарушением функции почек» ниже). При лечении следует контролировать клиренс креатинина с целью адекватной коррекции дозы для таких пациентов в случае необходимости.

Пациенты с нарушением функции почек

Поскольку препарат выводится из организма почками, следует проявлять осторожность при лечении больных с почечной недостаточностью – у таких пациентов рекомендуется контролировать функцию почек.

Увеличение периода полувыведения напрямую связано с ухудшением функции почек и клиренса креатинина. Это также касается пациентов пожилого возраста,

у которых уровень креатинина зависит от возраста. Интервал между применением должен быть скорректирован на основе функции почек.

Дозу рассчитывают в соответствии с клиренсом креатинина по формуле:

$$[140 - \text{возраст (в годах)}] \times \text{масса тела (в кг)}$$

Клиренс креатинина = ----- (× 0,85
для женщин)

72 × концентрация креатинина в сыворотке крови (в
мг/дл)

Лечение таким больным назначают в зависимости от степени тяжести почечной недостаточности, соблюдая следующие рекомендации:

Степень тяжести почечной недостаточности	Клиренс креатинина (мл/мин)	Дозировка
Нормальная функция почек (отсутствует почечная недостаточность)	> 80	Обычная доза, распределенная на 2 или 4 введения
Легкий	50-79	2/3 обычной суточной дозы за 2-3 введения
Умеренный	30-49	1/3 обычной суточной дозы за 2 введения
Тяжелый	< 30	1/6 обычной суточной дозы однократно
Терминальная стадия заболевания почек	-	Противопоказано

Пациенты с нарушением функции печени

Корректировка дозы не требуется для больных с нарушением функции печени. При диагностированных или подозреваемых расстройствах функции печени и почек коррекцию дозы проводят так, как указано в разделе «Пациенты с нарушением функции почек» выше.

Дети. Лекарственное средство не применять детям.

Передозировка

Симптомы: усиление проявлений побочного действия лекарственного средства. Симптомы передозировки наблюдались при пероральном применении пираретама в дозе 75 г.

Лечение симптоматическое. Специфического антидота нет, можно применять гемодиализ (выведение 50-60% пираретама).

Побочные эффекты

Побочные реакции, отмеченные в ходе клинических испытаний и постмаркетингового наблюдения, приведены по системам органов и частоте.

Частота 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 ($< 1/10\ 000$), частота неизвестна (нельзя оценить на основе доступных данных).

Постмаркетинговые данные недостаточны для расчета частоты побочных реакций в пролеченной популяции.

Со стороны крови и лимфатической системы: частота неизвестна – геморрагические расстройства.

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

Психические расстройства: часто — нервность; нечасто – депрессия; частота неизвестна – повышенная возбудимость, тревожность, смущение, галлюцинации.

Со стороны нервной системы: часто гиперактивность; нечасто – сонливость; частота неизвестна – атаксия, нарушение равновесия, повышение частоты приступов эпилепсии, головная боль, бессонница, дрожь.

Со стороны органов слуха и лабиринта: частота неизвестна – головокружение.

Со стороны пищеварительной системы: частота неизвестна – абдоминальная боль, боль в верхней части живота, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей: частота неизвестна – ангионевротический отек, дерматиты, крапивница, зуд.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: частота неизвестна – повышение сексуальной активности.

Со стороны сосудов: редко – гипотензия, тромбофлебит.

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

Исследование: часто – увеличение массы тела.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о побочных реакциях после регистрации лекарственного средства имеет важное значение. Это позволяет проводить мониторинг соотношения польза/риск при применении этого лекарственного средства. Медицинским и фармацевтическим работникам, а также пациентам или их законным представителям следует сообщать о всех случаях подозреваемых побочных реакций и отсутствии эффективности лекарственного средства через Автоматизированную информационную систему по фармаконадзору по ссылке: <https://aisf.dec.gov.ua>.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость

Исследования не проводились. Не следует смешивать лекарственное средство с другими препаратами.

Упаковка

По 5 мл или 10 мл в полиэтиленовой ампуле. По 10 ампул в пачке из картона.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

ООО «ФАРМАСЕЛ».

Местонахождение производителя и адрес места его деятельности.

Украина, 07408, Киевская обл., Броварской р-н, с. Квитневое, ул. Прорезная, 3.