

Состав

действующее вещество: piracetam;

1 мл раствора содержат 200 мг пирацетама;

вспомогательные вещества: натрия ацетат, тригидрат; кислота уксусная ледяная; вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Психостимулирующие и ноотропные средства.

Код АТХ N06B X03.

Фармакодинамика

Пирацетам является ноотропным средством, то есть психотропным препаратом, непосредственно улучшает эффективность когнитивных функций. Механизмов влияния препарата на центральную нервную систему, вероятно, несколько: изменение скорости распространения возбуждения в головном мозге; усиление метаболических процессов в нервных клетках; улучшение микроциркуляции путем влияния 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 снижена δ -активность).

Пирацетам подавляет гиперагрегацию активированных тромбоцитов. В случае патологической ригидности эритроцитов пирацетам повышает их способность к фильтрации и эластичность. Пирацетам оказывает протекторное и восстанавливающее 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

Абсорбция

После однократного введения 2 г препарата максимальная концентрация (max) достигается в плазме крови через 30 мин, а в спинномозговой жидкости - в течение 2-8 ч и составляет 40-60 мкг/мл.

Распределение

Пирацетам не связывается с белками плазмы крови, а видимый объем распределения составляет около 0,6 л/кг. Пирацетам распределяется по всем тканям и проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры и мембраны, используемые при гемодиализе. Пирацетам накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных зонах, мозжечке и базальных ганглиях.

Метаболизм

Пирацетам является активным в неизмененном виде и не метаболизируется в животных.

Вывод

Период полувыведения препарата 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

Взрослые:

- симптоматическое лечение патологических состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами, за исключением диагностированной деменции (слабоумия);
- лечение кортикальной миоклонии как монопрепарат или в составе комплексной терапии. Для проверки чувствительности к пирацетама можно провести пробный курс лечения в течение ограниченного периода времени.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к пирацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата.

Острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт).

Терминальная стадия почечной недостаточности.

Хорея Хантингтона.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

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 применения пирацетама в дозе 9,6 г/сут не влияло на дозировку аценокумарола для достижения значения INR 2,5-3,5, но при одновременном применении отмечалось значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, высвобождение β -тромбоглобулина, уровней фибриногена, факторов Виллебранда (коагуляционная активность (VIII: C), кофакторы ристоцетин (VIII: vW: Rco) и протеина в плазме крови (VIII: vW: Ag;)), вязкости цельной крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия.

Вероятность изменения фармакокинетики пирацетама под воздействием других лекарственных препаратов низкая, поскольку около 90% выводится в неизмененном виде с мочой.

In vitro пирацетам не угнетает 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 K_i для ингибирования этих двух CYP изомеров достаточный при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, подвергаются биотрансформации этими ферментами, маловероятно.

Противоэпилептические лекарственные средства.

Применение пирацетама в дозе 20 г ежедневно в течение 4 недель и больше не меняло кривую концентрации и максимальной концентрации противоэпилептических препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, натрия вальпроат) у больных эпилепсией, получающих стабильные дозы.

Алкоголь.

Совместный прием с алкоголем не влиял на уровень концентрации пирацетама в плазме крови, и концентрация алкоголя без изменений при применении 1,6 г пирацетама.

Особенности применения

Влияние на агрегацию тромбоцитов.

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

Нарушение функции почек.

Выводится почками, поэтому необходимо особое внимание уделять больным с почечной недостаточностью (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Пациенты пожилого возраста.

При длительной терапии у больных пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль за показателями функции почек, при необходимости корректируют дозу в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Отмена препарата.

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

Оговорки, связанные с вспомогательными веществами.

Препарат содержит 1 ммоль (23 мг) натрия в расчете на 24 г пирацетама. Это необходимо учитывать пациентам, находящимся на диете с контролируемым потреблением натрия.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Учитывая побочные реакции, наблюдающиеся при применении этого лекарственного средства, влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с другими механизмами возможен, и это следует учитывать.

Применение в период беременности или кормления грудью

Не следует применять препарат в период беременности и кормления грудью.

Способ применения и дозы

Препарат в виде инъекционного раствора применяют при невозможности применения пероральных форм пирацетама. Препарат применяют путем внутривенной инъекции (вводят медленно, в течение нескольких минут) или инфузии (применяют в течение 24 часов непрерывно).

Препарат применяют взрослым.

Лечение состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами.

Рекомендуемая суточная доза 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 24 г, которую распределяют на два или три введения. Лечение другими антимиоклоническими лекарственными средствами следует продолжать в тех же дозах. В зависимости от полученного терапевтического эффекта, если возможно, 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 делать попытку снизить дозу или отменить лечения. С этой целью дозу пирарцетама 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).

Особые группы пациентов.

Пациенты пожилого возраста.

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

Пациенты с нарушением функции почек.

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

Увеличение периода полувыведения непосредственно связано с ухудшением функции почек и клиренса креатинина. Это также касается пациентов пожилого возраста, у которых уровень выведения креатинина зависит от возраста. Интервал между применением должен быть скорректирован на основе функции почек.

Дозу рассчитывают клиренс креатинина с использованием следующей формулы:

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

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

$$72 \times \text{концентрация креатинина в сыворотке (мг / дл)}$$

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

Степень почечной недостаточности	Клиренс креатинина (мл/мин)	Дозировка
Нормальная функция почек	> 80	Обычная доза разделена на 2 или 4 приема
Легкий	50-79	2/3 обычной дозы в 2-3 приема
Умеренный	30-49	1/3 обычной дозы в 2 приема
Тяжелый	< 30	1/6 обычной дозы однократно
Терминальная стадия	–	противопоказано

Пациенты с нарушением функции печени.

Корректировка дозы не требуется для пациентов с нарушением только функции печени. В случае диагностированных или подозреваемых нарушений функции печени и почек коррекцию дозы проводят так, как указано в разделе «Пациенты с нарушением функции почек».

Дети

Не применяют.

Передозировка

Симптомы: усиление проявлений побочных эффектов препарата. Симптомы передозировки наблюдались при пероральном применении препарата в дозе 75 г.

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

Побочные реакции

Побочные реакции, отмеченные в ходе клинических испытаний и в течение постмаркетингового наблюдения, перечислены по классам систем органов и частотой.

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

Постмаркетинговые данные недостаточны для расчета частоты возникновения побочных реакций у пролеченных популяций.

Со стороны крови и лимфатической системы.

Частота неизвестна: геморрагические расстройства.

Со стороны иммунной системы.

Частота неизвестна: гиперчувствительность, анафилактоидные реакции.

Психические расстройства.

Часто нервозность.

Нечасто депрессия.

Частота неизвестна: повышенная возбудимость, тревожность, замешательство, 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: боль в животе, 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 нарушения и состояние места введения.

Нечасто астения.

Редко боль в месте введения, лихорадка.

Исследования.

Часто увеличение массы тела.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после получения регистрационного удостоверения на лекарственное средство является важным. Это позволяет постоянно контролировать соотношение польза/риск применения лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл в ампулах, по 6 ампул в блистере, по 2 блистера в пачке картонной.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Ейсика Фармасьютикалз С.Р.Л., Италия/Aesica Pharmaceuticals S.R.L., Italy.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Виа Праглия, 15 - 10044 Пианезза (ТО), Италия/Via Praglia, 15 - 10044 Pianezza (TO), Italy.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).