

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
06.11.14 № 812
Регистрационное удостоверение
№ UA/0901/02/01

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

ПИРАЦЕТАМ
(PIRACETAM)

Состав:

действующее вещество: piracetam;

1 мл таблетка содержит пирацетама 200 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, повидон, магния карбонат тяжелый, кальция стеарат.

состав оболочки: сахар-рафинад, кремния диоксид, повидон, магния карбонат легкий, титана диоксид (E 171), тартразин (E 102), воск пчелиный, масло подсолнечное.

Лекарственная форма. Таблетки, покрытие оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые оболочкой, желтого цвета, двояковыпуклые. На поперечном разрезе видно два шара.

Фармакотерапевтическая группа.

Психостимулирующие и ноотропные средства. Пирацетам. Код АТХ N06B X03.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Активным компонентом препарата является пирацетам, циклическое производное γ -аминомасляной кислоты.

Пирацетам является ноотропным средством, действует на мозг, улучшая когнитивные (познавательные) функции, такие как способность к обучению, память, внимание, а также умственную работоспособность. Механизмов влияния препарата на центральную нервную систему, вероятно, несколько: изменение скорости распространения возбуждения в головном мозге, усиление метаболических процессов в нервных клетках, улучшения микроциркуляции путем влияния на реологические характеристики крови, не вызывая при этом сосудорасширяющего действия. Улучшает связи между полушариями головного мозга и синаптическую проводимость в неокортикальных структурах, снижает агрегацию тромбоцитов и восстанавливает эластичность мембраны эритроцитов, уменьшает адгезию эритроцитов. Пирацетам оказывает протекторное и восстановительное действия при нарушении функции головного мозга вследствие гипоксии, интоксикации, электроконвульсивной терапии, снижает силу и продолжительность вестибулярного нистагма. Пирацетам применяют как монопрепарат или в составе комплексного лечения кортикальной миоклонии для снижения выраженности провоцирующего фактора-вестибулярного нейронита.

Фармакокинетика.

После перорального применения быстро и полностью всасывается в пищеварительном тракте. Биодоступность составляет почти 100 %. C_{max} после введения 2 г препарата достигается в плазме крови через 30 мин, спинномозговой жидкости – на протяжении 2-8 часов и составляет 40-60 мкг/мл. Объем распределения пирацетама – почти 0,6 л/кг. Период полувыведения препарата из плазмы крови составляет 4-5 часов и 6-8 часов из спинномозговой жидкости.

Этот период может удлиняться при почечной недостаточности.

Не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме. 80-100 % пираретама выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации. Почечный клиренс пираретама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин. Фармакокинетика пираретама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью. Пираретам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры и мембраны, используемые при гемодиализе. При исследовании на животных установлено, что пираретам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных зонах, мозжечке и базальных ганглиях.

Клинические характеристики.

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.

Противопоказания.

- Повышенная чувствительность к пираретаму или к производным пирролидона, а также к другим компонентам препарата;
- острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);
- терминальная стадия почечной недостаточности (при клиренсе креатинина менее 20 мл/мин);
- 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.

Есть данные об усилении пираретамом эффекта антидепрессантов и антиангинальных препаратов. Также Пираретам в высоких дозах (9,6 г/сутки) повышает эффективность аценокумарола у больных венозным тромбозом, что может проявляться снижением уровня агрегации тромбоцитов, снижением уровня фибриногена, фактора Виллебранда, вязкости крови и плазмы крови.

Вероятность изменения фармакодинамики пираретама под действием других лекарственных средств низкая, поскольку 90 % препарата выводится в неизменном виде с мочой.

In vitro пираретам не угнетает цитохром P450 изоформы CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11 в концентрации 142, 426, 1422 мкг/мл.

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

Противоэпилептические лекарственные средства.

Применение пираретама в дозе 20 г ежедневно в течение 4 недель и больше не меняет кривую уровня концентрации и максимальную концентрацию (C_{max}) противоэпилептических препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, натрия вальпроат) у больных эпилепсией.

Одновременное применение 1,6 г пираретама с алкоголем не влияет на концентрацию пираретама и алкоголя в сыворотке крови.

Особенности применения.

Чаще всего побочные реакции возникают у пациентов гериатрической группы, получающих суточную дозу выше 2,4 г. У больных пожилого возраста может возникнуть обострение

коронарной недостаточности (следует уменьшить дозу или отменить препарат).

Следует постоянно контролировать показатели функции почек (особенно у пациентов с хронической почечной недостаточностью) – остаточный азот и креатинин, а у пациентов с заболеваниями печени – функциональное состояние печени.

В связи с тем, что пираретам снижает агрегацию тромбоцитов, необходимо с осторожностью назначать больным с нарушением гемостаза, состояниями, которые могут сопровождаться кровоизлияниями (язва желудочно-кишечного тракта), при больших хирургических операциях (включая стоматологические вмешательства), больным с симптомами тяжелого кровотечения или больным, имеющим в анамнезе геморрагический инсульт; пациентам, которые принимают антикоагулянты, тромбоцитарные антиагреганты, включая низкие дозы ацетилсалициловой кислоты. При лечении больных кортикальной миоклонией следует избегать резкого прерывания лечения в связи с угрозой генерализации миоклонии или возникновения судорог.

Пациенты пожилого возраста. При длительной терапии у больных пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль показателей функции почек, при необходимости дозу следует корректировать в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина.

Во время терапии пираретамом следует обязательно продолжать основную терапию, поскольку порог судорожной готовности может снижаться.

В случае возникновения нарушений сна рекомендуется отменять вечерний прием препарата, присоединяя эту дозу к дневному приему.

Проникает сквозь фильтровальные мембраны аппаратов для гемодиализа.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Не следует применять Пираретам в период беременности или кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Следует придерживаться осторожности при применении пираретама лицам, управляющим автотранспортом или работающим с опасными механизмами, учитывая возможное развитие нежелательных реакций со стороны нервной системы.

Способ применения и дозы.

Применяют препарат перорально, запивая небольшим количеством воды.

Взрослые.

Лечение состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами.

Начальная суточная доза составляет 4,8 г в течение первой недели лечения. Обычно дозу следует делить на 2-3 приема. Поддерживающая доза составляет 2,4 мг в сутки, которую распределяют на 2-3 приема. В дальнейшем возможно постепенное снижение дозы на 1,2 г в сутки.

Лечение кортикальной миоклонии.

Начальная суточная доза составляет 24 г в течение 3 дней. Если за это время не достигнут желаемый терапевтический эффект, продолжают применение препарата в той же дозировке (24 г/сутки) до 7 суток. Если на 7 суток лечения не достигнут желаемый терапевтический эффект, лечение прекращают. Если терапевтический эффект был достигнут, то начиная с дня, когда достигнуто стойкое улучшение, начинают снижать дозу препарата на 1,2 г каждые 2 суток до тех пор, пока снова не появятся проявления кортикальной миоклонии. Это даст возможность установить среднюю эффективную дозу.

Суточную дозу распределяют на 2-3 приема. Лечение другими антимиоклоническими средствами поддерживается предварительно назначенными дозами. Лечение продолжают до исчезновения симптомов заболевания. Для предупреждения ухудшения состояния больных нельзя резко прекращать применения препарата. Необходимо постепенно снижать дозу на 1,2 г каждые 2-3 дня. Необходимо каждые 6 месяцев назначать повторные курсы лечения препаратом, корректируя при этом дозу в зависимости от состояния пациента, до исчезновения или уменьшения проявлений болезни.

Применение пациентам пожилого возраста.

Коррекция дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с диагностированными или

подозреваемыми расстройствами функции почек (см. разд. «Дозировка больным с нарушением функции почек»). При длительном лечении в случае необходимости таким пациентам необходимо контролировать клиренс креатинина с целью адекватной коррекции дозы.

Дозировка больным с нарушением функции почек. Поскольку препарат выводится из организма почками, следует соблюдать осторожность при лечении больных с почечной недостаточностью.

Увеличение периода полувыведения непосредственно связано с ухудшением функции почек и клиренса креатинина. Это также касается пациентов пожилого возраста, у которых выведение креатинина зависит от возраста. Интервал между приемами необходимо провести коррекцию на основании функции почек.

Расчет дозы проводят на основании оценки клиренса креатинина на формулой:

$$K_{кр} = \frac{[140 - \text{возраст (в годах)}] * m \text{ (у кг)}}{72 * C \text{ креатинина в плазме (мг/дл)}} \quad (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

Лечение таким больным назначают, в зависимости от степени тяжести почечной недостаточности, придерживаясь таких рекомендаций:

Степень почечной недостаточности	Клиренс креатинина (мл/мин)	дозировка
Нормальная функция почек	> 80	Обычная доза, распределена на 2 или 4 приема
Легкая	50-79	2/3 обычной дозы на 2-3 приема
Умеренная	30-49	1/3 обычной дозы на 2 приема
Тяжелая	< 30	1/6 обычной дозы однократно
Терминальная стадия	–	Противопоказано

Дозировка больным с нарушением функции печени.

Корректировка дозы не нужна только для больных с нарушением функции печени. В случае диагностированных или подозреваемых расстройств функции печени и почек коррекцию дозы проводят так, как указано в разделе «Дозировка больным с нарушением функции почек».

Дети.

Не применяют.

Передозировка.

Симптомы: усиление проявлений побочного действия препарата. Симптомы передозировки наблюдались при оральном применении препарата в дозе 75 г.

Лечение симптоматическое, промывание желудка, вызвать рвоту. Специфического антидота нет, можно применять гемодиализ (выведение 50-60% парацетама).

Побочные реакции.

Со стороны нервной системы: гиперкинезия; нарушения сна, в том числе бессонница и сонливость; атаксия, нарушение равновесия, повышение частоты приступов эпилепсии, головная боль, дрожь.

Психические расстройства: нервозность, депрессия, повышенная возбудимость, тревожность, смятение, галлюцинации.

Со стороны крови и лимфы: геморрагические расстройства.

Со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, в том числе анафилактикоидные реакции.

Со стороны органов слуха и равновесия: головокружение.

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

Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, дерматиты, сыпь, крапивница, зуд.

Со стороны репродуктивной системы: повышение сексуальной активности.

Сосудистые расстройства: гипотензия, тромбофлебит.

Общие расстройства: астения, лихорадка, увеличение массы тела.

Срок годности. 3 года.

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

Упаковка. По 10 таблеток в блистере; 3 или 6 блистеров в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места ведения деятельности.

Украина ,79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.

Дата последнего пересмотра.