

Состав

действующее вещество: пирацетам;

1 мл раствора содержит пирацетама 200 мг;

вспомогательные вещества: натрия ацетата тригидрат Е 262, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакодинамика

Активным компонентом препарата является пирацетам, циклическое производное гамма-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; улучшение 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. Пирацетам подавляет агрегацию тромбоцитов и восстанавливает эластичность мембраны эритроцитов, уменьшает адгезию эритроцитов. Пирацетам оказывает протекторное и восстанавливающее действие при нарушении функции головного мозга вследствие гипоксии, интоксикации и электрошоковой терапии.

Пирацетам снижает выраженность и длительность вестибулярного нистагма.

Пирацетам следует применять в качестве монопрепарата или в комплексном лечении кортикальной миоклонии, как средство для снижения выраженности провоцирующего фактора – вестибулярного нейронита.

Фармакокинетика

Стах после введения 2 г препарата достигается в плазме крови через 30 минут, а в спинномозговой жидкости – в течение 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, соответственно, 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 % пирацетама выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации. Почечный клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин. Фармакокинетика пирацетама не изменяется у пациентов с печеночной недостаточностью. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический, плацентарный барьер и мембраны, используемые при гемодиализе. При исследовании на животных установлено, что пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных зонах, мозжечке и базальных ганглиях.

Показания

Взрослые:

- симптоматическое лечение патологических состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами, исключая диагностированной деменции (слабоумия)
- лечение кортикальной миоклонии в составе моно- или комплексной терапии.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к пирацетаму или к производным пирролидона, а также к 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.

Есть данные, что у пациентов с тяжелым течением рецидивирующего тромбоза применения пирасетама в высоких дозах (9,6 г/сутки) не влияло на дозировку аценокумарола для достижения значения протромбинового времени (INR) 2,5-3,5, но при одновременном применении отмечалось значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллибрандта (коагуляционная активность (VIII: C) ко-фактор ристоцетину (VIII: vW: Rco) и протеин в плазме крови (VIII: vW: Ag), вязкости крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия.

Вероятность изменения фармакодинамики пирасетама под воздействием других лекарственных препаратов низкая, поскольку 90 % препарата выводится в неизменном виде с мочой.

In vitro пирасетам 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 Ки двух CYP-изомеров достаточный при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, которые подвергаются биотрансформации этими ферментами, мало возможна.

Противоэпилептические лекарственные средства.

Применение пирасетама в дозе 20 г ежедневно в течение 4 недель и больше не меняло кривую уровня концентрации и максимальную концентрацию (Cmax) противоэпилептических препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, натрия вальпроат) у больных эпилепсией.

Алкоголь.

Совместный прием с алкоголем не влиял на уровень концентрации пирасетама в сыворотке крови и концентрация алкоголя в сыворотке крови не изменялась при приеме 1,6 г пирасетама.

Особенности применения

Влияние на агрегацию тромбоцитов.

В связи с тем, что пирасетам снижает агрегацию тромбоцитов (см. раздел «Фармакодинамика») необходимо с осторожностью назначать препарат больным с нарушением гемостаза, состояниями, которые могут сопровождаться

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

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»).

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

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Препарат содержит 1 ммоль (23 мг) натрия в расчете на 24 г парацетама. Это необходимо учитывать пациентам, находящимся на диете с контролем потребления натрия.

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

Следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или работе с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Не следует применять препарат в период беременности или кормления грудью.

Способ применения и дозы

Препарат в виде инъекционного раствора применять в острых случаях или при невозможности применения пероральных форм парацетама. Препарат применять или внутривенно (вводить медленно, в течение нескольких минут), или в виде инфузии (применять в течение 24 часов непрерывно).

Препарат применять взрослым пациентам.

Лечение состояний, сопровождающихся ухудшением памяти, когнитивными расстройствами.

Начальная суточная доза составляет 4,8 г в течение первой недели лечения. Обычно дозу следует разделять на 2-3 введения. Поддерживающая доза составляет 2,4 г в сутки. 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 достигнуто желаемого терапевтического эффекта, продолжать применение препарата в той же дозировке (24 г/сутки) до 7 суток. Если на 7 суток лечения не получено терапевтического эффекта, лечение следует прекратить. Если терапевтический эффект был достигнут, то начиная со дня, когда достигнуто устойчивое улучшение, начинать снижать дозу на 1,2 г пирацетама каждые 2 суток до тех пор, пока снова не появятся проявления кортикальной миоклонии. Это даст возможность установить среднюю эффективную дозу.

Лечение другими антимиоклоническими средствами поддерживается в дозах, которые были назначены ранее. Лечение продолжать до исчезновения симптомов заболевания. Для предупреждения ухудшения состояния больным нельзя резко прекращать применение препарата. Необходимо постепенно снижать дозу на 1,2 г пирацетама каждые 2-3 дня. Каждые 6 месяцев назначать повторные курсы лечения, корректируя при этом дозу в зависимости от состояния пациента, к исчезновению или уменьшению проявлений болезни.

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 при необходимости.

Пациенты с нарушением функции почек.

Поскольку препарат выводится из организма почками, следует соблюдать осторожность при лечении пациентов с почечной недостаточностью.

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

Расчет дозы должен исходить из оценки клиренса креатинина у пациента.
Рассчитывают по формуле:

Клиренс креатинина = $[140 - \text{возраст(в годах)}] * \text{маса тела(у кг)}/72 * \text{концентрация креатинина в плазме крови (мг/дл)}$

Для женщин: $\text{Ккр} * 0,85$

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

Степень почечной недостаточности	Клиренс креатинина (мл/мин)	Дозирование
Нормальная (отсутствует почечная недостаточность)	> 80	Обычная доза, разделенная на 2 або 4 введения
Легкая	50-79	2/3 обычной дозы за 2-3 введения
Умеренная	30-49	1/3 обычной дозы за 2 введения
Тяжелая	< 30	1/6 обычной дозы однократно
Терминальная стадия	-	Противопоказано

Пациенты с нарушением функции печени

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

Дети

Не применять этой категории пациентов.

Передозировка

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

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

Побочные реакции

Частота определяется следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 < 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000 < 1/100$), редко ($\geq 1/10000 < 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), единичные случаи (невозможно оценить частоту на базе доступных данных).

Система или орган по системе классификации органов и систем ВОО	Часто ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)	Нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$)
Со стороны нервной системы	Гиперкинезия	
Расстройства метаболизма и питания	Увеличение массы	
Психические расстройства	Нервозность	Депрессия
Общие расстройства и расстройства в месте введения		Астения

Побочные реакции, отмеченные в ходе постмаркетинговых наблюдений, перечислены ниже по системам органов.

Со стороны крови и лимфы.

Единичные случаи: геморрагические расстройства.

Со стороны иммунной системы.

Единичные случаи: гиперчувствительность, анафилактоидные реакции.

Психические расстройства.

Часто: нервозность.

Нечасто: депрессия.

Единичные случаи: повышенная возбудимость, тревожность, замешательство, галлюцинации.

Со стороны нервной системы.

Часто: гиперкинезия.

Нечасто: сонливость.

Единичные случаи: атаксия, нарушение равновесия, повышение частоты приступов эпилепсии, головная боль, бессонница, дрожь.

Со стороны органов слуха и равновесия.

Единичные случаи: головокружение.

Со стороны пищеварительной системы.

Единичные случаи: абдоминальная боль, боль в верхней части живота, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей.

Единичные случаи: ангионевротический отек, дерматиты, сыпь, крапивница, зуд.

Со стороны репродуктивной системы.

Единичные случаи: повышение сексуальной активности.

Сосудистые расстройства.

Очень редко: гипотензия, тромбоз, тромбоз вен.

Общие расстройства и расстройства в месте введения.

Нечасто: астения.

Очень редко: боль в месте введения, гипертермия.

Со стороны метаболизма и питания.

Часто: увеличение массы тела.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 5 мл в ампуле; по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

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

Источник инструкции

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