МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ПИРАЦЕТАМ АВЕКСИМА

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: ПИРАЦЕТАМ АВЕКСИМА

Международное непатентованное наименование: пирацетам

Лекарственная форма: таблетки шипучие

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-005592-180619
СОГЛАСОВАНО

Состав на одну таблетку

действующее вещество: пирацетам – 600 мг;

вспомогательные вещества: сорбитол - 150 мг, натрия гидрокарбонат - 600 мг, винная кислота - 472 мг, аспартам - 30 мг, повидон К-25 - 25 мг, эмульсия силиконовая (симетикон) - 1 мг, ароматизатор лимонный - 10 мг, макрогол 6000 - 112 мг.

Описание

Круглые, плоскоцилиндрической формы таблетки, белого или почти белого цвета с вкраплениями, с двухсторонней фаской, с характерным запахом лимона. Допускается шероховатость поверхности таблетки.

Фармакотерапевтическая группа: ноотропное средство.

Код АТХ: N06BX03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Пирацетам – ноотропный лекарственный препарат, который оказывает действие на центральную нервную систему различными путями: модифицирует нейротрансмиссию в головном мозге; улучшает условия, способствующие нейрональной пластичности; улучшает микроциркуляцию, воздействуя на реологические характеристики крови и не вызывая вазодилатацию.

Применение пирацетама у пациентов с церебральной дисфункцией повышает концентрацию внимания и улучшает когнитивные функции, что сопровождается изменениями на электроэнцефалограмме (повышение α и β активности, снижение δ активности).

Способствует восстановлению когнитивных функций вследствие различных нарушений, таких как гипоксия, интоксикация или электросудорожная терапия.

Уменьшает продолжительность вызванного вестибулярного нейронита.

Пирацетам ингибирует повышенную агрегацию активированных тромбоцитов и, в случае патологической ригидности эритроцитов, улучшает их деформируемость и способность к фильтрации.

Фармакокинетика

Абсорбция.

После приема внутрь пирацетам быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Биодоступность составляет около 100%.

После однократного приема пирацетама в дозе 2 г максимальная концентрация (C_{max}) достигается за 30 мин и составляет 40-60 мкг/мл, через 2-8 ч обнаруживается в спинномозговой жидкости.

Распределение.

Объем распределения (V_d) составляет около 0,6 л/кг. Общий клиренс – 80-90 мл/мин. Не связывается с белками плазмы крови. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, а также гемодиализные мембраны.

В исследовании на животных обнаружено, что пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных долях, в мозжечке и базальных ядрах.

Метаболизм.

Не метаболизируется.

Выведение.

Период полувыведения из плазмы крови ($T_{1/2}$) составляет 4-5 ч и 8,5 ч – из спинномозговой жидкости. $T_{1/2}$ удлиняется при хронической почечной недостаточности (при терминальной хронической почечной недостаточности – до 59 ч). Выводится в неизмененном виде почками. Экскреция почками почти полная (>95%) в течение 30 ч. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин.

Фармакокинетика пирацетама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью.

Показания к применению

- Симптоматическое лечение интеллектуально-мнестических нарушений при отсутствии установленного диагноза деменции.
- Уменьшение проявлений кортикальной миоклонии у чувствительных к пирацетаму пациентов как в качестве монотерапии, так и в составе комплексной терапии (в целях

определения чувствительности к пирацетаму в конкретном случае может быть проведен пробный курс лечения).

Противопоказания

- гиперчувствительность к пирацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата;
- терминальная стадия почечной недостаточности;
- геморрагический инсульт;
- хорея Гентингтона;
- психомоторное возбуждение на момент назначения;
- детский возраст до 18 лет;
- непереносимость фруктозы;
- фенилкетонурия.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Беременность.

Достаточные данные о применении пирацетама во время беременности отсутствуют. Исследования на животных не показали прямого или опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие. Пирацетам проникает через плацентарный барьер. Плазменная концентрация пирацетама у новорожденных достигает 70-90% от таковой у матери. Пирацетам следует назначать во время беременности лишь в исключительных случаях, если польза для матери превышает потенциальный риск для плода, а клиническое состояние беременной требует лечения пирацетамом.

Период грудного вскармливания.

Пирацетам проникает в грудное молоко. Пирацетам не следует применять в период кормления грудью или следует прекратить грудное вскармливание при лечении пирацетамом. При решении об отмене грудного вскармливания или отказа от лечения пирацетамом следует соотнести пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

Способ применения и дозы

Внутрь, независимо от времени приема пищи.

Таблетку растворить в стакане воды (200 мл).

Таблетки не жевать и не глотать.

При интеллектуально-мнестических нарушениях:

2,4-4,8 г/сутки (4-8 таблеток) в 2-3 приема.

Лечение кортикальной миоклонии: лечение начинают с дозы 7,2 г/сутки, постепенно увеличивая на 4,8 г каждые 3-4 дня до достижения максимальной дозы 24 г/сутки в 2-3 приема. Применение других препаратов для лечения миоклонии следует продолжить в той же дозировке. В зависимости от полученного эффекта следует по возможности уменьшить дозу этих препаратов.

Лечение пирацетамом следует продолжать до тех пор, пока сохраняются симптомы заболевания. У пациентов с острыми эпизодами миоклонии может произойти спонтанное улучшение, поэтому каждые 6 месяцев следует предпринимать попытки снижения дозы или отмене пирацетама, постепенно сокращая дозу на 1,2 г/сутки каждые 2 дня (в случае синдрома Ланса-Адамса каждые 3-4 дня для предотвращения внезапного рецидива или синдрома отмены).

Дозирование пациентам с почечной недостаточностью.

Пирацетам практически полностью выводится почками, при лечении пациентов с почечной недостаточностью или требующих контроля функции почек следует соблюдать осторожность. Период полувыведения увеличивается прямо пропорционально ухудшению функции почек и клиренса креатинина; это также справедливо в отношении пожилых, у которых экскреция креатинина зависит от возраста. Требуется коррекция дозы препарата в зависимости от величины клиренса креатинина (КК). Клиренс креатинина для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина ($К_{сыворот}$), по следующей формуле:

$$КК_{(мл/мин)} = \frac{[140\text{-возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times Ксыворот(мг/мл)}$$

Клиренс креатинина для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Почечная недостаточность	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и частота применения
Норма	>80	Стандартная доза в 2-4 приема
Легкая	50-79	2/3 стандартной дозы в 2-3 приема
Средняя	30-49	1/3 стандартной дозы в 2 приема
Тяжелая	20-30	1/6 стандартной дозы однократно
Терминальная	<20	Противопоказано

Пожилым пациентам дозу корректируют при наличии почечной недостаточности в соответствии со схемой. При длительном применении следует регулярно проводить оценку функции почек.

Дозирование пациентам с нарушениями функции печени: коррекции дозы не требуется.

Побочное действие

Перечисленные ниже нежелательные лекарственные реакции выявлены в клинических исследованиях и по результатам пострегистрационного наблюдения и сгруппированы по системно-органным классам.

Градация частоты определяется следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100 до <1/10), нечасто (≥1/1000 до <1/100), редко (≥1/10 000 до <1/1000), очень редко (до <1/10 000) и частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны крови и лимфатической системы:

частота неизвестна: кровоточивость.

Со стороны иммунной системы:

частота неизвестна: анафилактоидные реакции, гиперчувствительность.

Со стороны психики:

часто: нервозность;

нечасто: депрессия;

частота неизвестна: возбуждение, тревога, спутанность сознания, галлюцинации.

Со стороны нервной системы:

часто: гиперактивность;

нечасто: сонливость;

частота неизвестна: атаксия, нарушения равновесия, обострение течения эпилепсии, головная боль, бессонница, тремор.

Со стороны органа слуха и лабиринта:

частота неизвестна: вертиго.

Со стороны сосудов:

редко: тромбофлебит, артериальная гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы:

частота неизвестна: абдоминальная боль (в т.ч. в верхних отделах), диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

частота неизвестна: ангионевротический отек, дерматит, кожный зуд, крапивница.

Со стороны репродуктивной системы:

частота неизвестна: усиление сексуального влечения.

Общие расстройства:

часто: увеличение массы тела.

нечасто: астения.

Передозировка

Симптомы

Зарегистрирован единичный случай развития диспептических явлений в виде диареи с кровью и абдоминальной болью при приеме пирацетама внутрь в суточной дозе 75 г. По-видимому это было связано с употреблением большой суммарной дозы сорбитола, который ранее входил в состав препарата в форме выпуска раствор для приема внутрь.

Лечение

В случае значительной передозировки следует провести промывание желудка или вызвать искусственную рвоту. Рекомендуется проведение симптоматической терапии, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа составляет 50-60%.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Гормоны щитовидной железы.

При одновременном применении пирацетама с йодсодержащими гормонами щитовидной железы может возникнуть спутанность сознания, раздражительность и нарушение сна.

Аценокумарол.

Согласно опубликованному клиническому исследованию у пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г/сутки не влияет на дозу аценокумарола, необходимую для достижения международного нормализованного отношения, равного 2,5-3,5, но по сравнению с эффектами одного лишь аценокумарола, добавление пирацетама в дозе 9,6 г/сутки значительно снижает агрегацию тромбоцитов, высвобождение β-тромбоглобина концентрацию фибриногена и факторов Вилленбранда (VIII:C; VIII: vW: Ag; VIII: vW: RCo), а также вязкость цельной крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия.

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под влиянием других лекарственных препаратов низкая, поскольку 90 % пирацетама выводится в неизмененном виде с мочой. В концентрациях 142, 426, и 1422 мкг/мл пирацетам не ингибирует изоферменты цитохрома Р450 (CYP 1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11) in vitro. В концентрации 1422 мкг/мл наблюдалось минимальное ингибирование изофермента CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако значения константы ингибирования (Ki), вероятно, выходят далеко за пределы концентрации

1422 мг/мл. Таким образом, метаболические взаимодействия пирацетама с другими препаратами маловероятны.

Противосудорожные препараты.

Прием пирацетама в дозе 20 г/сутки на протяжении 4 недель у пациентов с эпилепсией, получавших стабильные дозы противоэпилептических препаратов, не изменял максимальную сывороточную концентрацию и площадь под кривой «концентрация-время» противоэпилептических препаратов (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал и вальпроевая кислота).

Алкоголь.

Совместный прием с алкоголем не влиял на концентрацию пирацетама в сыворотке; концентрация этанола в сыворотке крови не изменялась при приеме 1,6 г пирацетама.

Особые указания

Влияние на агрегацию тромбоцитов.

Вследствие антиагрегантного эффекта пирацетам следует назначать с осторожностью пациентам с тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений (например, при язве желудка), нарушениями гемостаза, у пациентов с хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства, у пациентов, принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в т.ч. низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

Отмена терапии.

При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прекращения лечения, так как это может вызвать возобновление приступов.

Почечная недостаточность.

Поскольку пирацетам выводится почками, следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью.

Пожилые пациенты.

При длительной терапии у пациентов пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль клиренса креатинина, при необходимости проводят коррекцию дозы в зависимости от клиренса креатинина.

Пирацетам проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки шипучие, 600 мг.

По 3 таблетки в контурную безъячейковую упаковку (стрип) из материала упаковочного комбинированного на бумажной основе.

По 10, 15, 20, 25 или 30 таблеток в тубу пластиковую, укупоренную пластиковой крышкой с влагопоглотителем и контролем первого вскрытия.

По 10, 15, 20, 25 или 30 таблеток в банку из полиэтилена низкого давления.

По 5, 10, 15 или 20 контурных безъячейковых упаковок (стрипов) с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

1 тубу пластиковую или банку с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование держателя (владельца) регистрационного удостоверения, адрес

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.

Производитель/Организация, принимающая претензии потребителей:

ОАО «Ирбитский химфармзавод»

623856, Россия, Свердловская обл., г. Ирбит, ул. Кирова, д. 172.

Тел/факс: (34355) 3-60-90.

Адрес производства:

Свердловская обл., г. Ирбит, ул. Карла Маркса, д. 124-а.

Генеральный директор
ОАО «Ирбитский химфармзавод» _____ Л.А. Солодухина