МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Пирацетам

Регистрационный номер:

Торговое название: Пирацетам

Международное непатентованное название: пирацетам

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на одну таблетку:

Дозировка 800 мг

Активное вещество: пирацетам – 800,0 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): кроскармеллоза натрия - 12,0 мг, крахмал прежелатинизированный - 12,0 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 20,0 мг, магния стеарат - 8,0 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): гипромеллоза - 15,2 мг, макрогол-4000 - 4,0 мг, титана диоксид - 8,8 мг.

Дозировка 1200 мг

Активное вещество: пирацетам –1200,0 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): кроскармеллоза натрия - 18,0 мг, крахмал прежелатинизированный - 18,0 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 30,0 мг, магния стеарат - 12,0 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): гипромеллоза - 22,8 мг, макрогол-4000 - 6,0 мг, титана диоксид - 13,2 мг.

Описание:

Дозировка 800 мг

Капсулообразные таблетки двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с риской с одной стороны. Допускается незначительная шероховатость поверхности. На изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Дозировка 1200 мг

Овальные таблетки двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с риской с одной стороны. Допускается незначительная шероховатость поверхности. На изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: ноотропное средство.

Код АТХ: N06BX03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Активным компонентом является пирацетам, циклическое производное гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК).

Имеющиеся данные свидетельствуют, что основной механизм действия пирацетама не является клеточноспецифичным или органоспецифичным.

Пирацетам связывается с полярными головками фосфолипидов и образует мобильные комплексы препарат-фосфолипид. В результате восстанавливается двухслойная структура клеточной мембраны и ее стабильность, что в свою очередь, приводит к восстановлению трехмерной структуры мембранных и трансмембранных белков и восстановлению их функции.

На нейрональном уровне пирацетам облегчает различные типы синаптической передачи, оказывая преимущественное воздействие на плотность и активность постсинаптических рецепторов (данные получены в исследованиях на животных). Пирацетам улучшает такие функции как обучение, память, внимание и сознание, не оказывая седативного или психостимулирующего воздействия.

Гемореологические эффекты пирацетама связаны с его влиянием на эритроциты, тромбоциты и стенку сосудов.

У пациентов с серповидно-клеточной анемией пирацетам увеличивает способность эритроцитов к деформации, снижает вязкость крови и предотвращает формирование «монетных столбиков». Кроме того, он снижает агрегацию тромбоцитов, не оказывая существенного влияния на их количество.

В исследованиях на животных показано, что пирацетам тормозит спазм сосудов и противодействует различным вазоспастическим веществам.

В исследованиях на здоровых добровольцах пирацетам снижал адгезию эритроцитов к эндотелию сосудов и стимулировал выработку простациклинов здоровым эндотелием.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь пирацетам быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Биодоступность пирацетама близка к 100%. После однократного приема препарата в дозе 3,2 г максимальная концентрация (C_{max}) составляет 84 мкг/мл, после многократного приема 3,2 мг 3 раза в день - 115 мкг/мл и достигается через 1 час в плазме крови и через 5 час в спинномозговой жидкости. Прием пищи снижает C_{max} на 17 % и увеличивает время его достижения (T_{max}) до 1,5 часов. У женщин при приеме пирацетама в дозе 2,4 г C_{max} и площадь под кривой «концентрация - время» (AUC) на 30 % выше, чем у мужчин.

Распределение. Объем распределения (V_d) составляет около 0,6 л/кг. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры. При 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 связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме.

Выведение. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 4-5 ч из плазмы крови и 8,5 ч из спинномозговой жидкости. Период полувыведения не зависит от пути введения. 80-100% пирацетама выводится почками в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 80-90 мл/мин. $T_{1/2}$ удлиняется при почечной недостаточности (при терминальной хронической почечной недостаточности – до 59 часов). Фармакокинетика пирацетама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью.

Показания к применению

У взрослых

- Симптоматическое лечение психоорганического синдрома, в частности, у пожилых пациентов, сопровождающегося снижением памяти, головокружением, пониженной концентрацией внимания и снижением активности, изменением настроения, расстройством поведения, нарушением походки (эти симптомы могут быть ранними признаками возрастных заболеваний, таких как

5 0 2 3 4

болезнь Альцгеймера и сенильная деменция альцгеймеровского типа);
- Лечение головокружения и связанного с ним нарушения равновесия, за исключением сосудистого и психогенного головокружения;
- Комплексная терапия и монотерапия кортикальной миоклонии;
- Комплексная терапия серповидно-клеточной анемии (для профилактики серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза).

У детей
- Лечение дислексии (в комплексе с другими методами);
- Комплексная терапия серповидно-клеточной анемии (для профилактики серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза).

Противопоказания
- Индивидуальная непереносимость пирацетама или производных пирролидона, а также других компонентов препарата;
- Психомоторное возбуждение на момент назначения препарата;
- Хорея Гентингтона;
- Острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);
- Конечная стадия почечной недостаточности (при клиренсе креатинина менее 20 мл/мин);
- Детский возраст до 3 лет.

С осторожностью: нарушение гемостаза; обширные хирургические вмешательства; тяжелое кровотечение; хроническая почечная недостаточность (при клиренсе креатинина 20-80 мл/мин).

Применение во время беременности и лактации
Контролируемых исследований применения препарата во время беременности не проводилось. Пирацетам проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко. Концентрация препарата у новорожденных достигает 70-90 % от концентрации его в крови у матери. Пирацетам не должен назначаться во время беременности. В период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Способ применения и дозы
Внутрь.
Во время приема пищи или натощак, запивая жидкостью.
Симптоматическое лечение психоорганического синдрома: 2,4 - 4,8 г/сутки в 2-3 приема.
Лечение головокружения и связанного с ним нарушения равновесия: 2,4 - 4,8 г/сутки в 2-3 приема.
Лечение кортикальной миоклонии: начинают с дозы 7,2 г/сутки, каждые 3-4 дня дозу увеличивают на 4,8 г/сутки до достижения максимальной дозы 24 г/сутки в 2 -3 приема. Лечение продолжают на протяжении всего периода заболевания. Каждые 6 месяцев следует предпринимать попытки уменьшения дозы или отмены препарата, постепенно сокращая дозу на 1,2 г/сутки каждые 2 дня.
Лечение серповидно-клеточной анемии: суточная профилактическая доза составляет 160 мг/кг массы тела, разделенная на 4 равные дозы.
Лечение дислексии у детей (в комплексе с другими методами лечения): рекомендуемая суточная доза для детей от 8 лет и подростков – 3,2 г, разделенная на 2 приема.
Дозирование больным с нарушением функции почек:
дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (КК):
Клиренс креатинина для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

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

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

Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Режим дозирования
Норма	> 80	обычная доза
Легкая	50-79	2/3 обычной дозы в 2-3 приема
Средняя	30-49	1/3 обычной дозы в 2 приема
Тяжелая	< 30	1/6 обычной дозы однократно
Конечная стадия	-	противопоказано

Пожилым больным дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Дозирование больным с нарушением функции печени:

больные с нарушением функции печени в коррекции дозы не нуждаются. Больным с нарушением функции и почек и печени, дозирование осуществляется по схеме (см. раздел «Дозирование больным с нарушением функции почек»).

Побочное действие

Со стороны нервной системы: двигательная расторможенность, раздражительность, сонливость, депрессия, астения, головная боль, бессонница, возбуждение, нарушение равновесия, атаксия, обострение течения эпилепсии, тревога, галлюцинации, спутанность сознания.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боли в животе (в том числе гастралгия).

Со стороны обмена веществ: увеличение массы тела.

Со стороны органов слуха: вертиго.

Со стороны кожных покровов: дерматит, зуд, крапивница.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, гиперчувствительность, анафилактические реакции.

Передозировка

Симптомы: диарея с примесью крови, боль в области живота.

Лечение: при значительной передозировке следует промыть желудок или вызвать рвоту. Рекомендуется проведение симптоматической терапии, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа для пирацетама составляет 50-60%.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под воздействием других лекарственных препаратов низкая, т.к. 90% пирацетама выводится в неизмененном виде почками.

При одновременном применении с гормонами щитовидной железы отмечены сообщения о спутанности сознания, раздражительности и нарушении сна.

Согласно опубликованному исследованию у пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г/сутки повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (отмечалось более выраженное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллебранда, вязкости крови и плазмы по сравнению с применением только непрямых антикоагулянтов).

In vitro пирацетам не угнетает изоферменты цитохрома P450, такие как CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2B6, 2E1 и 4A9/11 в концентрации 142, 426 и 1422 мкг/мл. При концентрации 1422 мкг/мл отмечено небольшое угнетение CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%), однако уровень Ki этих двух изоферментов достаточен при превышении 1422 мкг/мл, в связи с чем метаболическое взаимодействие с другими препаратами маловероятно.

Прием пирацетама в дозе 20 г/сутки в течение 4 недель не изменял максимальную концентрацию в сыворотке и площадь под кривой «концентрация - время» противоэпилептических препаратов (карбамазепина, фенитоина, фенобарбитала, вальпроевой кислоты).

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

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

При лечении серповидно-клеточной анемии доза менее 160 мг/кг или нерегулярный прием препарата могут вызвать обострение заболевания.

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами

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

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 800 мг и 1200 мг.

По 10, 20, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60, 80, 90, 100 или 120 таблеток в банки полимерные для лекарственных средств.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6, 8, 9, 10 или 12 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

ООО «Озон»

Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11.

Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий):

445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел./факс: (84862) 3-41-09, 7-18-51

E-mail: ozon_pharm@samtel.ru

www.ozonpharm.ru

Директор ООО «Озон» Корнев Ю.Р.