

## ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

### ПИРАЦЕТАМ

**Регистрационный номер:** ЛП-002053

**Торговое название препарата:** Пирацетам

**Международное непатентованное наименование:** Пирацетам

**Лекарственная форма:** раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

**Состав на 1 мл**

**Активное вещество**

Пирацетам 200,0 мг

**Вспомогательные вещества**

натрия ацетат тригидрат

(натрий уксуснокислый 3-водный) 1 мг

уксусная кислота

разведенная 30% до рН 5,6-5,8

вода для инъекций до 1,0 мл

**Описание**

Прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

**Фармакотерапевтическая группа:** ноотропное средство.

**Код АТХ** N06ВХ03

**ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

**Фармакодинамика**

Активным компонентом препарата 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 познавательные способности, 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 простаглиннов здоровым эндотелием.

**Фармакокинетика**

Фармакокинетический профиль пирацетама носит линейный характер и не зависит от времени. Характерна низкая вариабельность в большом диапазоне доз. Постоянная концентрация в плазме достигается спустя 3 дня от начала приема. 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. Не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме. 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 неизменном виде путем клубочковой фильтрации. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 80-90 мл/мин.  $T_{1/2}$  удлинняется при почечной недостаточности (при терминальной ХГПН – 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 болезнь Альцгеймера и сенильная деменция альцгеймеровского типа);
- Лечение головокружения и связанного с ним нарушения равновесия, за исключением вазомоторного и психогенного головокружения;
- Комплексная терапия и монотерапия кортикальной миоклонии;
- Профилактика серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза.

У детей

- Профилактика 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**

Риск кровотечений, нарушение гемостаза; геморрагические цереброваскулярные нарушения в анамнезе, хирургические вмешательства (в том числе обширные стоматологические вмешательства), у пациентов, принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в том числе низкие дозы аспирина, 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. Исследования на животных не показали прямого и опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона, роды и постнатальное развитие.

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**

Внутривенно. Внутримышечно.

Парентеральное введение пирацетама назначается при невозможности применения пероральных форм препарата (бессознательном состоянии, затруднении глотания). Предпочтительным является внутривенное введение.

Внутривенная инфузия суточной дозы выполняется через катетер с постоянной скоростью на протяжении 24 часов в сутки (например, в начальной стадии лечения тяжелой миоклонии).

Предварительно препарат разводят в одном из совместимых инфузионных растворов:

Декстрозы 5 %, 10 % или 20 %;

Фруктозы 5 %, 10 % , 20 %;

Натрия хлорида 0,9 %;

Декстрана 40 10% (в растворе натрия хлорида 0,9%);

Растворе Рингера;

Растворе маннитола 20 %.

Общий объем раствора, предназначенный для введения, определяется с учетом клинических показаний и состояния пациента.

Болюсное внутривенное введение (например, неотложное лечение криза при серповидно-клеточной анемии) выполняется в течение не менее 2 мин, суточная доза при этом распределяется на несколько введений (2-4) с равномерными интервалами так, чтобы доза на одно введение не превышала 3 г.

Внутримышечно препарат вводится, если введение через вену затруднено или пациент пере-

возбужден. Объем раствора, вводимого внутримышечно, не может превышать 5 мл. Кратность введения препарата аналогична таковой при его внутривенном или пероральном применении. При появлении возможности переходят на пероральный прием препарата (см. инструкции по медицинскому применению соответствующих форм выпуска препарата).

Продолжительность лечения определяется врачом в зависимости от заболевания и с учетом динамики симптомов.

Симптоматическое лечение хронического психоорганического синдрома 2,4-4,8 г/сут.

Лечение головокружения и связанных с ним расстройств равновесия – 2,4-4,8 г/сут.

Кортикальная миоклония Лечение начинают с дозы 7,2г/сут, каждые 3-4 дня дозу увеличивают на 4,8 г/сут до достижения максимальной дозы 24 г/сут. Лечение продолжают на протяжении всего периода заболевания. Каждые 6 мес. следует предпринимать попытки уменьшения дозы или отмены препарата, постепенно сокращая дозу на 1,2 г/сут каждые 2 дня. При отсутствии эффекта или незначительном терапевтическом эффекте лечение прекращают.

Серповидно-клеточная анемия Суточная профилактическая доза составляет 160 мг/кг массы тела, разделенная на 4 равные дозы. В период криза – 300 мг/кг внутривенно, разделенная на 4 равные дозы.

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:

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

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	20-30	1/6 обычной дозы однократно
Конечная стадия	<20	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 и психической сферы: двигательная расторможенность, нервозность, раздражительность, сонливость, депрессия, астения, головная боль, бессонница, возбуждение, нарушение равновесия, атаксия, гиперкинезы, 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, ангионевротический отек.

Аллергические реакции: гиперчувствительность, анафилактические реакции.

Другие: боль в области инъекции, тромбофлебит, гипертермия, гипотензия (после внутривенного введения)

**ПЕРЕДОЗИРОВКА**

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

Лечение: рекомендуется проведение симптоматической терапии, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа для пирацетама со-

ставляет 50-60%.

**ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ**

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под воздействием других лекарственных препаратов низкая, т.к. 90% пирацетама выводится в неизменном 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 не изменяет дозы аценокумарола, но значительно снижает агрегацию тромбоцитов (отмечалось более выраженное снижение уровня агрегации тромбоцитов, высвобождение β-тромбоглобина, уровня фибриногена, факторов Виллебранда, вязкости крови и плазмы по сравнению с применением только непрямым антикоагулянтов).

Пирацетам не угнетает изоферменты цитохрома Р450. 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» у пациентов с эпилепсией, принимающих стабильные дозы противосудорожных 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.

При лечении пациентов, находящихся на гипонатриевой диете, рекомендуется учитывать, что раствор пирацетама в дозе 2,4 г содержит 12 мг натрия.

При длительном лечении пожилых пациентов необходим регулярный контроль клиренса креатинина, т.к. может потребоваться коррекция дозы.

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**

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 200 мг/мл.

По 5 мл в ампулы бесцветного нейтрального стекла тип I с цветным кольцом излома или с цветной точкой и насечкой или без кольца излома, цветной точки и насечки. На ампулы дополнительно может наноситься одно, два или три цветных кольца и/или двухмерный штрих-код, и/или буквенно-цифровая кодировка или без дополнительных цветных колец, двухмерного штрих-кода, буквенно-цифровой кодировки.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой лакированной или пленки полимерной или без фольги и без пленки. Или по 5 ампул в предварительно изготовленную форму (трей) из картона с ячейками для укладки ампул.

Одну или две контурных ячейковых упаковок или картонных треев вместе с инструкцией по применению и скарификатором или ножом ампульным, или без скарификатора и ножа ампульного помещают в картонную упаковку (пачку).

**Условия хранения**

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

Хранить в местах, недоступных для детей.

**Срок годности**

3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

**Отпуск из аптек**

По рецепту.

**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-А.  
Тел./факс: (84862) 3-41-09**

**ПРОИЗВОДИТЕЛЬ ООО «Озон»**