

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛУЦЕТАМ®

(LUCETAM®)

Склад:

Однocy речовина: пірацетам;

1 таблетка містить 400 мг або 800 мг, або 1200 мг пірацетаму;

допоміжні речовини: магнію стеарат, повідон, дибутилсебацинат;

склад оболонки таблеток: Opadry O3F28561 білий (макрогол, титану діоксид (E 171), тальк, етицеллолози водна дисперсія, гіпромелоза).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 400 мг - білі або майже білі двоопуклі овальної форми таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з фаскою, з гравіруванням «E 241» з одного боку таблетки, без запаху;

таблетки 800 мг - білі або майже білі двоопуклі овальної форми таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з фаскою, з рискою з обох сторін, з гравіруванням «E 242» з одного боку таблетки, без запаху;

таблетки 1200 мг - білі або майже білі двоопуклі овальної форми таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з фаскою, з гравіруванням «E 243» з одного боку таблетки, без запаху.

Фармакотерапевтична група. Психостимулюючі та ноотропні засоби.

Код АТХ N06B X03.

Фармакологічні властивості.

Фармакокінетика.

Активним компонентом Луцетаму® є пірацетам, циклічне похідне гамма-аміномасляної кислоти.

Пірацетам є ноотропним засобом, що діє на мозок, покращуючи когнітивні функції, такі як здатність до навчання, пам'яті, уваги, а також розумову працездатність у здорових осіб та хворих з когнітивними порушеннями. Ці ефекти не пов'язані із седативною або стимулювальною дією. Ефекти пірацетаму пов'язані зі стимуляцією нуклеотидного метаболізму у нейронах,

підвищенням рівня глюкози та утилізації кисню в головному мозку, а також із посиленням колінергічних та дофамінергічних механізмів передачі збудження у нервовій тканині. Пірацетам має властивість доозалежного зв'язування з фосфоліпідом подвійним шаром клітинних мембран, причому він відновлює їх структуру, таким чином, підвищується плінність і поліпшується функція мембран.

Механізми впливу препарату на центральну нервову систему, зокремо, кілька: зміна швидкості поширення збудження у головному мозку; посилення метаболічних процесів у нервових клітинах; поліпшення мікроциркуляції шляхом впливу на реологічні характеристики крові без спричинення при цьому судинорозширювальної дії. Покращує зв'язи між пікулами головного мозку і синхронічну провідність у неокортикальних структурах. Пірацетам притігує агрегацію тромбоцитів і відновлює еластичність мембрани еритроцитів, зменшує адгезію еритроцитів. У дозі 9,6 г знижує рівень фібриногену і факторів Віллібранда на 30-40 % та подовжує час кровотечі. Пірацетам чинить протекторну або відновлювальну когнітивну дію при порушенні функції головного мозку (гіпоксія, отруєнні, електросудовий терапії) або після цих станів. Пірацетам знижує вираженість і тривалість вестибулярного нистатку. Експерименти на тваринах показали, що пірацетам захищає центральну нервову систему від гіпоксії, травми головного мозку, токсичних та електросудових впливів, а також зменшує шкідливий вплив цих факторів.

Фармакокінетика.

Після прийому препарату внутрішньо пірацетам швидко і майже повністю всмоктується. Максимальна концентрація (C_{max}) у плазмі крові досягається приблизно через 30 хвилин після прийому: C_{max} у спинономозковій рідині досягається через 5 годин і становить 40-60 мкг/мл. Біодоступність препарату становить майже 100 %. Об'єм розподілу пірацетаму – майже 0,6 л/кг. Одночасне вживання їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, однак знижується значення C_{max} і підвищується t_{max}.

Період напіввиведення препарату з плазми крові становить 4-5 годин, зі спинономозкової рідини - 8-5 годин. Цей період може подовжуватися при нирковій недостатності. Не зв'язується з білками плазми крові, не метаболізується в організмі. 80-100 % пірацетаму виводиться нирками у незміненому вигляді шляхом клубочкової фільтрації. Нирковий кліренс пірацетаму у здорових добровольців становить 86 мл/хв. Фармакокінетика пірацетаму не змінюється у хворих із печінковою недостатністю. Пірацетам проникає через гематоенцефалічний та плацентарний бар'єри (концентрація у плоді досягає 70-90 % його концентрації у материнському організмі) і проникає у грудне молоко. Пірацетам піддається діалізу (ефективність виведення - 50-60 %). При дослідженні на тваринах установлено, що пірацетам вибірково накопичується у тканинах кори головного мозку, переважно у зовніш, тім'яних та потиличних зонах, мозочку, базальних гангліях, хвостатому ядрі, гіпокамі, латеральному колінчастому тілі та судинному сплетінні головного мозку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Дорослі:

- симптоматичне лікування патологічних станів, що супроводжуються погіршенням пам'яті, когнітивними розладами, за винятком діагностованої деменції (слабоумства);
- лікування кортикальної міоклонії: як монопрепарат або у складі комплексної терапії.

Противпоказання.

Підвищена чутливість до пірацетаму та до інших похідних піролідону, а також до інших компонентів препарату.

Гостре порушення мозкового кровообігу (геморагічний інсульт).

Термінальна стадія ниркової недостатності.

Хворя Хантингтона.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тиреоїдні гормони

При сумісному застосуванні з тиреоїдними гормонами (T₃, T₄) можлива підвищена дратівливість, дезорієнтація і порушення сну.

Ацетасаломид

Клінічні дослідження показали, що у хворих з тяжким перебігом рецидивуючого тромбозу застосування пірацетаму у високих дозах (9,6 г/добу) не впливало на дозування ацетасаломару для досягнення значення протромбінового часу (INR) 2,5-3,5, але при його одночасному застосуванні відзначалося значне зниження рівня агрегації тромбоцитів, рівня фібриногену, факторів Віллібранда (VIII: C; VIII: vW: Ag; VIII: vW: Rco), в'язкості крові і плазми.

Фармакокінетичні взаємодії

Ймовірність зміни фармакодинаміки пірацетаму під дією інших лікарських засобів низька, оскільки 90 % препарату виводиться у незміненому вигляді із сечею.
Ін ніщо пірацетам не пригнічує застоском P450 ізоформи CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 і 4A9/11 у концентрації 142, 426, 1422 мкг/мл.
При концентрації 1422 мкг/мл відмічено незначне пригнічення CYP2A6 (21 %) і 3A4/5 (11 %).
Однак рівень К цих двох CYP-ізомерів достатній при перевищенні 1422 мкг/мл. Тому метаболічна взаємодія з препаратами, що піддаються біотрансформації цими ферментами, мало можлива.
Протипептичні лікарські засоби
Застосування пірацетаму у дозі 20 мг/добу щоденно протягом 4 тижнів і більше не змінювало криву рівня концентрації і C_{max} протипептичних препаратів у сироватці крові (карбамазепін, фенітоїн, фенобарбітал, натрію валпроат) у хворих на епілепсію.
Алкогoль
Сумісний прийом з алкоголем не впливав на рівень концентрації пірацетаму в сироватці крові, і концентрація алкоголю в сироватці крові не змінювалася при застосуванні 1,6 г пірацетаму.

Особливості застосування.

Вплив на агрегацію тромбоцитів

У зв'язку з тим, що пірацетам знижує агрегацію тромбоцитів (див. розділ «Фармакологічні властивості»), необхідно з обережністю призначати препарат хворим із порушеннями гемостазу, станами, що можуть супроводжуватися кровоточивими (виразка шлунково-кишкового тракту), під час значних хірургічних операцій (включаючи стоматологічні втручання), хворим із симптомами тяжкої кровотечі або хворим, які мають в анамнезі геморагічний інсульт; пацієнтам, які застосовують антикоагулянти, тромбоцитарні антиагреганти, включаючи низькі дози ацетилсаліцилової кислоти. Препарат виводиться нирками, тому необхідно особливу увагу приділяти хворим з нирковою недостатністю.

Цілісхислі літнього віку

При довготривалій терапії у хворих літнього віку рекомендується регулярний контроль показників функції нирок, у разі необхідності коригувати дозу залежно від результатів дослідження кліренсу креатиніну (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Підприємства застосування

При лікуванні хворих на кортикальну міоклонію слід уникати різкого переривання лікування у зв'язку з загрозою генералізації міоклонії або виникнення судом.
Попередження пов'язані з вмістом допоміжних речовин.
Препарат містить 2 моль (46 мг) натрію з розрахунку на 24 г пірацетаму. Це необхідно враховувати пацієнтам, які дотримуються дієти з контролем споживання натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати препарат у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Слід дотримуватися обережності під час керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Застосовувати препарат перорально, запиваючи невеликою кількістю води.

Дорослі.

Лікування станів, що супроводжуються погіршенням пам'яті, когнітивними розладами. Початкова добова доза становить 4,8 г протягом першого тижня лікування. Звичай дозу слід розподіляти на 2-3 прийоми.
Підтримуюча доза становить 2,4 г на добу, які розподіляють на 2-3 прийоми.

У подальшому можливе поступове зниження дози на 1,2 г на добу.

Лікування кортикальної міоклонії.

Початкова добова доза становить 24 г протягом 3 днів. Якщо за цей час не досягнуто бажаного терапевтичного ефекту, продовжувати застосування препарату у тому ж дозуванні (24 г/добу) до 7 діб. Якщо на 7-му добу лікування не отримано бажаного терапевтичного ефекту, лікування слід припинити. Якщо терапевтичний ефект було досягнуто, то починаючи з дня, коли досягнуто стійке покращення, починати знижувати дозу препарату на 1,2 г кожні 2 доби, поки знову не з'являться прояви кортикальної міоклонії. Це дасть можливість встановити середню ефективну дозу.

Добову дозу розподіляти на 2-3 прийоми. Лікування іншими антимиоклонічними засобами підтримується у попередньо призначених дозах. Лікування продовжувати до зникнення симптомів захворювання. Для попередження погіршення стану хворих не можна різко припиняти застосування препарату. Необхідно поступово знижувати дозу на 1,2 г кожні 2-3 доби. Необхідно кожні 6 місяців призначати повторні курси лікування препаратом, корегуючи при цьому дозу залежно від стану пацієнта, до зникнення або зменшення проявів хвороби.

Застосування пацієнтам літнього віку.

Корекція дози рекомендується пацієнтам літнього віку з діагностованими або підозрюваними розладами функції нирок (див. розділ «Дозування хворим із порушеннями функції нирок»). При довготривалому лікуванні у разі необхідності таким пацієнтам потрібно контролювати кліренс креатиніну з метою адекватної корекції дози.

Дозування хворим із порушеннями функції нирок.

Оскільки препарат виводиться з організму нирками, слід проявляти обережність при лікуванні хворих із нирковою недостатністю.
Збільшення періоду напіввиведення безпосередньо пов'язано з погіршенням функції нирок і кліренсу креатиніну. Це також стосується пацієнтів літнього віку, у яких виведення креатиніну залежить від віку. Інтеграція між прийомом потрібно скоригувати на основі функції нирок. Розрахунок дози проводити на основі оцінки кліренсу креатиніну у пацієнта за формулою:

☐

Лікування таким хворим призначати залежно від ступеня тяжкості ниркової недостатності, дотримуючись таких рекомендацій:

Ступінь ниркової недостатності	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Дозування
нормальна функція нирок	> 80	Звичайна доза, розділена на 2 або 4 прийоми
легкий	50-79	1/2 звичайної дози за 2-3 прийоми
середній	30-49	1/3 звичайної дози за 2 прийоми
тяжкий	< 30	1/4 звичайної дози одноразово
термінальна стадія	< 10	Протипоказано

Дозування хворим із порушеннями функції печінки

Коригування дози не потрібне тільки для хворих із порушеннями функції печінки.
У разі діагностованих або підозрюваних розладів функції печінки та нирок корекцію дози проводити, як указано у розділі «Дозування хворим із порушеннями функції нирок».

Діти. Не застосовувати.

Передозування.

Симптоми: посилення проявів побічної дії препарату. Симптоми передозування спостерігалися при пероральному застосуванні препарату у дозі 75 г.
Лікування симптоматичне: промити шлунок, викликати блювання. Специфічного антидоту немає, можна застосовувати гемодіаліз (виведення 50-60 % пірацетаму).

Побічні реакції.

Побічні реакції, відзначені у ході клінічних випробувань пірацетаму.
З боку нервової системи: гіперкінезія.
З боку метаболізму та харчування: збільшення маси тіла.
Психічні розлади: знервованість, депресія.
Загальні розлади та розлади у місці введення: астения.

Побічні реакції, відзначені у ході постмаркетингових спостережень, перераховані нижче за системами органів.
З боку крові та лімфи: геморагічні розлади.
З боку імунної системи: гіперчутливість, анафілактоїдні реакції.
Психічні розлади: знервованість, депресія; підвищена збудливість, тривожність, збентеження, галюцинації.
З боку нервової системи: гіперкінезія, сонливість, атаксія, порушення рівноваги, підвищення частоти нападів епілепсії, головний біль, безсоння, тремтіння.
З боку органів слуху та лабіринту: запаморочення.
З боку травної системи: абдомінальний біль, біль у верхній частині живота, діарея, нудота, блювання.
З боку шкіри та підшкірних тканин: ангіоневротичний набряк, дерматити, висипання, кропив'янка, свербіж.
З боку репродуктивної системи та годування груддю: підвищення статевій активності.
Дослідження: збільшення маси тіла.

Термін придатності.

5 років.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °C у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

Таблетки 400 мг: по 60 таблеток у скляному флаконі або по 15 таблеток у блістері (4 блістери) у картонній коробці.
Таблетки 800 мг: по 30 таблеток у скляному флаконі або по 15 таблеток у блістері (2 блістери) у картонній коробці.
Таблетки 1200 мг: по 20 таблеток у скляному флаконі або по 10 таблеток у блістері (2 блістери) у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ЗАТ Фармацевтичний завод ЕПІС, Угорщина.

Місцезнаходження виробника та адреса місця впровадження його діяльності.

9900, Керменд, вул. Матяш кірай, 65, Угорщина.

