ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ПІРАЦЕТАМ-ДАРНИЦЯ

(PIRACETAM-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: piracetam;

1 таблетка містить пірацетаму 200 мг;

допоміжні речовини: магнію карбонат важкий, крохмаль картопляний, повідон, кальцію стеарат, гіпромелоза, макрогол 4000, титану діоксид (Е 171), хіноліновий жовтий (Е 104).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки, вкриті оболонкою, від світло-жовтого до жовтого або жовтого з червонуватим відтінком кольору, круглої форми з двоопуклою поверхнею. На поперечному зрізі видно два шари.

Фармакотерапевтична група.

Психостимулюючі та ноотропні засоби. Пірацетам. Код АТХ N06B X03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Пірацетам є ноотропним засобом, який діє на головний мозок, покращуючи когнітивні (пізнавальні) процеси, такі як здатність до навчання, пам’ять, увага, а також розумову працездатність. Пірацетам впливає на центральну нервову систему різними шляхами: зміною швидкості розповсюдження збудження в головному мозку, покращанням метаболічних процесів у нервових клітинах, покращанням мікроциркуляції, впливаючи на реологічні характеристики крові і не спричиняючи судинорозширювальної дії.

Покращує зв’язок між півкулями головного мозку і синаптичну провідність у неокортикальних структурах. Пірацетам пригнічує агрегацію тромбоцитів і відновлює еластичність мембрани еритроцитів, зменшує адгезію еритроцитів. Пірацетам спричиняє протекторну і відновлювальну дію при порушенні функції головного мозку внаслідок гіпоксії та інтоксикації.

Пірацетам знижує вираженість і тривалість вестибулярного ністагму.

Фармакокінетика.

Після прийому перорально пірацетам швидко і практично повністю всмоктується, пікова концентрація досягається через 1 годину після прийому. Біодоступність становить майже 100 % після прийому одноразової дози 2 г. Об'єм розподілу пірацетаму – приблизно 0,6 л/кг. Період напіввиведення лікарського засобу з плазми крові становить 4−5 годин і 6−8 годин – зі спинномозкової рідини, який подовжується при нирковій недостатності. Не зв'язується з білками плазми крові, не метаболізується в організмі. 80−100 % пірацетаму виводиться нирками в незмінному стані шляхом ниркової фільтрації. Нирковий кліренс пірацетаму у здорових добровольців становить 86 мл/хв. Фармакокінетика пірацетаму не змінюється у пацієнтів з печінковою недостатністю. Пірацетам проникає крізь гематоенцефалічний і плацентарний бар'єри і мембрани, які використовуються при гемодіалізі. При дослідженні на тваринах пірацетам вибірково накопичується у тканинах кори головного мозку, переважно в лобних, тім'яних і потиличних долях, у мозочку і базальних гангліях.

Клінічні характеристики.

Показання.

У дорослих:

− симптоматичне лікування патологічних станів, що супроводжуються зниженням пам'яті, когнітивними розладами, за винятком діагностованої деменції (слабоумства);

− лікування кортикальної міоклонії: як монопрепарат або у складі комплексної терапії.

Протипоказання.

− Індивідуальна гіперчутливість до пірацетаму або до похідних піролідону, а також до інших компонентів лікарського засобу.

− Гостре порушення мозкового кровообігу (геморагічний інсульт).

− Термінальна стадія ниркової недостатності (при кліренсі креатиніну менше 20 мл/хв).

− Хорея Хантінгтона.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Фармакокінетичні взаємодії

Можливість зміни фармакодинаміки пірацетаму під дією інших лікарських засобів низька, оскільки 90 % пірацетаму виводиться в незміненому стані з сечею.

In vitro пірацетам не пригнічує цитохром Р450 ізоформи CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 і 4A9/11 у концентрації 142, 426, 1422 мкг/мл.

При концентрації 1422 мкг/мл спостерігається незначне пригнічення CYP2A6 (21 %) і 3A4/5 (11 %). Однак рівень K_i цих двох CYP-ізомерів достатній при перевищенні 1422 мкг/мл. Тому метаболічна взаємодія з препаратами, що піддаються біотрансформації цими ферментами, малоймовірна.

Тиреоїдні гормони

При одночасному застосуванні з тиреоїдними гормонами (T_3 T_4) можливі підвищена дратівливість, дезорієнтація та порушення сну.

Аценокумарол

Клінічні дослідження показали, що у хворих з тяжким перебігом рецидивуючого тромбозу застосування пірацетаму у високих дозах (9,6 г/добу) не вимагало зміни дозування аценокумаролу для досягнення значення протромбінового часу (МНВ) 2,5−3,5, але при його одночасному застосуванні відзначалося значне зниження рівня агрегації тромбоцитів, рівня фібриногену, факторів Віллебранда [коагуляційна активність (VIII: C); кофактор ристоцетину (VIII: vW: Rco) та протеїну плазмі крові (VIII: vW: Ag;)], в'язкості крові та плазми крові.

Протиепілептичні лікарські засоби

Застосування пірацетаму в дозі 20 мг на добу щоденно протягом 4 тижнів не змінювало криву рівня концентрації і максимальну концентрацію протиепілептичних препаратів (карбамазепіну, фенітоїну, фенобарбіталу, натрію вальпроату) у хворих на епілепсію.

Алкоголь

Сумісний прийом з алкоголем не впливає на концентрацію пірацетаму в сироватці крові, і рівень концентрації алкоголю в сироватці крові не змінюється при одноразовому прийомі 1,6 г пірацетаму.

У людей літнього віку пірацетам посилює дію антиангінальних засобів, підвищує ефективність антидепресантів.

Особливості застосування.

Вплив на агрегацію тромбоцитів.

У зв'язку з тим, що пірацетам знижує агрегацію тромбоцитів, необхідно з обережністю призначати лікарський засіб хворим з порушенням гемостазу; станами, що можуть супроводжуватися крововиливами (виразка шлунково-кишкового тракту); під час великих хірургічних операцій (включно з стоматологічними операціями); хворим із симптомами тяжкої кровотечі; хворим, які мають в анамнезі геморагічний інсульт; пацієнтам, які застосовують антикоагулянти, тромбоцитарні антиагреганти, включаючи низькі дози ацетилсаліцилової кислоти.

Порушення функції нирок.

Лікарський засіб виводиться нирками, тому необхідно особливу увагу приділяти хворим із нирковою недостатністю.

Пацієнти літнього віку.

При тривалій терапії для хворих літнього віку рекомендується регулярний контроль показників функції нирок, при необхідності слід коригувати дозу залежно від результатів дослідження кліренсу креатиніну.

Переривання застосування.

При лікуванні хворих на кортикальну міоклонію слід уникати різкого переривання лікування у зв'язку із загрозою генералізації міоклонії або виникнення судом.

Лікарський засіб проникає через фільтрувальні мембрани апаратів для гемодіалізу.

Важлива інформація про допоміжні речовини.

Цей лікарський засіб містить сполуки натрію. Слід бути обережним при застосуванні пацієнтам, які дотримуються дієти з контрольованим вмістом натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати лікарський засіб у період вагітності або годування груддю.

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

Слід бути обережними під час керування автотранспортом або роботі з іншими механізмами через можливість розвитку побічних реакцій з боку центральної нервової системи.

Спосіб застосування та дози.

Лікарський засіб застосовувати всередину до або під час їди. Таблетки слід запивати рідиною (водою або соком). Тривалість лікування і вибір індивідуальної дози залежать від тяжкості стану хворого і швидкості зворотної динаміки клінічної картини захворювання.

Застосування дорослим

Лікування станів, що супроводжуються погіршенням пам'яті, когнітивними розладами.

Початкова добова доза становить 4,8 г протягом першого тижня лікування. Дозу слід розподіляти на 2−3 прийоми. Підтримуюча доза становить 2,4 г на добу (розподілена на 2−3 прийоми). У подальшому можливе поступове зниження дози на 1,2 г на добу.

Лікування кортикальної міоклонії.

Початкова доза становить 24 г протягом 3 днів. Якщо за цей час не досягнуто бажаного терапевтичного ефекту, слід продовжувати застосування лікарського засобу у тому ж дозуванні (24 г/добу) до 7 діб. Якщо терапевтичний ефект слабкий або зовсім відсутній – продовжувати застосування лікарського засобу в тій же дозі до 7 діб. Якщо на 7-му добу лікування не

отримано бажаного терапевтичного ефекту, лікування пірацетамом слід припинити. Якщо терапевтичного ефекту було досягнуто, то починаючи з дня, коли досягнуто стійке покращення, слід починати знижувати дозу лікарського засобу на 1,2 г кожні 2 доби, поки знову не з’являться прояви кортикальної міоклонії. Це дасть можливість встановити середню ефективну дозу.

Добову дозу необхідно розподіляти на 2−3 прийоми. Лікування іншими антиміоклонічними засобами підтримувати у попередньо призначених дозах. Лікування слід продовжувати до зникнення симптомів захворювання. Для попередження погіршення стану хворих не можна різко припиняти застосування лікарського засобу. Необхідно поступово знижувати дозу на 1−2 г кожні 2−3 дні. Необхідно кожні 6 місяців призначати повторні курси лікування, коригуючи 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. При довготривалому лікуванні у разі необхідності таким пацієнтам потрібно контролювати кліренс креатиніну з метою адекватної корекції дози.

Дозування хворим із порушенням функції нирок

Оскільки лікарський засіб виводиться з організму нирками, слід проявляти обережність при лікуванні хворих із нирковою недостатністю.

Збільшення періоду напіввиведення безпосередньо пов’язане з погіршенням функції нирок і кліренсу креатиніну. Це також стосується пацієнтів літнього віку, в яких виведення креатиніну залежить від віку. Інтервал між прийомами необхідно скоригувати керуючись показниками функції нирок.

Розрахунок дози слід проводити на основі оцінки кліренсу креатиніну у пацієнта за формулою:

$$К_{кр} = \frac{[140 - \text{вік (у роках)}] \times \text{маса тіла (у кг)}}{72 \times С_{\text{креатиніну у плазмі}}\,(\text{мг/дл})} \; (\times 0{,}85 \text{ для жінок})$$

Призначати лікування таким хворим залежно від ступеня тяжкості ниркової недостатності, дотримуючись таких рекомендацій:

Ступінь ниркової недостатності	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Дозування
−	> 80	Звичайна доза, розділена на 2 або 4 прийоми
Легкий	50−79	$^2/_3$ звичайної дози за 2−3 прийоми
Помірний	30−49	$^1/_3$ звичайної дози за 2 прийоми
Тяжкий	< 30	$^1/_6$ звичайної дози одноразово
Термінальна стадія	−	Протипоказано

Хворим з порушенням функції печінки коригування дози не потрібне. У разі діагностованих або підозрюваних розладів функції печінки та нирок корекцію дози слід проводити так, як вказано у розділі «Дозування хворим з порушенням функції нирок».

Діти.

Лікарський засіб не застосовувати дітям.

Передозування.

Симптоми: посилення проявів побічної дії лікарського засобу. При прийомі 75 г пірацетаму всередину відзначені диспепсичні явища, такі як діарея з домішками крові і біль у животі. Симптоми передозування спостерігалися при пероральному застосуванні лікарського засобу у дозі 75 г.

Лікування симптоматичне. Одразу після значного перорального передозування необхідно промити шлунок або викликати блювання. Специфічного антидоту немає, можна застосовувати гемодіаліз (виведення 50−60 % пірацетаму).

Побічні реакції.

Побічні ефекти класифіковані за системами органів та частотою виникнення.

Частота визначається таким чином: дуже часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100, < 1/10), нечасто (≥ 1/1000, ≤ 1/100), рідко (≥ 1/10000, ≤ 1/1000), дуже рідко (≤ 1/10000), поодинокі випадки (неможливо оцінити частоту на базі доступних даних).

Побічні реакції, відзначені у ході постмаркетингових спостережень, перераховані нижче за системами органів.

З боку вестибулярного апарату.

Поодинокі випадки: вертиго.

З боку шлунково-кишкового тракту.

Поодинокі випадки: анорексія, абдомінальний біль, біль у верхній частині живота, нудота, діарея, блювання, запор.

З боку обміну речовин, метаболізму.

Часто: збільшення маси тіла.

З боку нервової системи:

Часто: гіперкінезія.

Нечасто: сонливість.

Поодинокі випадки: екстрапірамідні порушення, атаксія, тремор, порушення рівноваги, запаморочення, головний біль, збудження, дратівливість, порушення сну, безсоння, підвищення частоти нападів епілепсії, судоми.

З боку психіки:

Часто: нервозність.

Нечасто: депресія.

Поодинокі випадки: підвищена збудливість, збентеження, тривожність, сплутаність свідомості, галюцинації.

З боку серцево-судинної системи.

Поодинокі випадки: погіршення перебігу стенокардії, артеріальна гіпертензія.

З боку крові та лімфатичної системи.

Поодинокі випадки: тромбофлебіт, геморагічні розлади.

З боку імунної системи.

Поодинокі випадки: реакції гіперчутливості, у тому числі анафілаксія.

З боку шкіри та підшкірної клітковини.

Поодинокі випадки: ангіоневротичний набряк, дерматити, свербіж, висипання, кропив’янка.

З боку репродуктивної системи.

Поодинокі випадки: підвищення сексуальної активності.

Загальні розлади.

Поодинокі випадки: гіпертермія, астенія.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу є важливою процедурою. Це дозволяє продовжувати моніторинг співвідношення «користь/ризик» для відповідного лікарського засобу. Медичним працівникам необхідно повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції через національну систему повідомлень.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці; по 6 контурних чарункових упаковок в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.