ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ПІРАЦЕТАМ-ЗДОРОВ’Я

Склад:

діюча речовина: 1 мл розчину містить пірацетаму 200 мг;

допоміжні речовини: натрію ацетат, тригідрат; кислота оцтова розведена; вода для ін’єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін’єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий злегка забарвлений розчин.

Фармакотерапевтична група. Психостимулюючі і ноотропні засоби. Код АТХ N06B X03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Пірацетам є ноотропним засобом, тобто психотропним препаратом, що безпосередньо покращує ефективність когнітивних функцій. Механізмів впливу препарату на центральну нервову систему, ймовірно, кілька: зміна швидкості поширення збудження в головному мозку; посилення метаболічних процесів у нервових клітинах; поліпшення мікроциркуляції шляхом впливу на реологічні характеристики крові, при цьому судинорозширювальна дія відсутня.

Тривале або одноразове застосування пірацетаму пацієнтам із церебральною дисфункцією спричиняє значні зміни на електроенцефалограмі, які демонструють підвищення уважності та покращення когнітивної функції (підвищена α- та β-активність і знижена δ-активність).

Пірацетам пригнічує гіперагрегацію активованих тромбоцитів. У разі патологічної ригідності еритроцитів пірацетам підвищує їхню здатність до фільтрації та еластичність. Пірацетам чинить протекторну і відновлювальну дію при порушенні функцій головного мозку внаслідок гіпоксії, інтоксикації та електрошокової терапії.

Пірацетам застосовують як монопрепарат або у складі комплексного лікування кортикальної міоклонії для зниження вираженості провокуючого фактора – вестибулярного нейроніту.

Фармакокінетика.

Абсорбція. Після одноразового введення 2 г препарату максимальна концентрація (C_{max}) досягається у плазмі крові через 30 хв, а у спинномозковій рідині – протягом 2-8 годин і становить 40-60 мкг/мл.

Розподіл. Пірацетам не зв'язується з білками плазми крові, а видимий об'єм розподілу становить майже 0,6 л/кг. Пірацетам розподіляється по всіх тканинах та проникає через гематоенцефалічний та плацентарний бар'єри і мембрани, що використовуються при гемодіалізі. Пірацетам накопичується в тканинах кори головного мозку, переважно в лобних, тім'яних та потиличних зонах, мозочку і базальних гангліях.

Біотрансформація. Пірацетам є активним у незміненому вигляді і не метаболізується у тварин.

Виведення. Період напіввиведення препарату з крові становить 4-5 годин і 6-8 годин – зі спинномозкової рідини. Цей період може подовжуватися при нирковій недостатності. Пірацетам виводиться нирками у незміненому вигляді. Виводиться із сечею практично повністю (понад 95 %) через 30 годин. Нирковий кліренс пірацетаму у здорових добровольців становить 86 мл/хв.

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. Для перевірки чутливості до пірацетаму можна провести пробний курс лікування протягом обмеженого періоду часу.

Протипоказання. Підвищена чутливість до пірацетаму або похідних піролідону, а також до інших компонентів лікарського засобу. Гостре порушення мозкового кровообігу (геморагічний інсульт). Термінальна стадія ниркової недостатності. Хорея Хантінгтона.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тиреоїдні гормони. При сумісному застосуванні з тиреоїдними гормонами можлива підвищена дратівливість, дезорієнтація і порушення сну.

Аценокумарол. Під час клінічних досліджень у хворих із тяжким перебігом рецидивуючого тромбозу застосування пірацетаму у дозі 9,6 г/добу не вимагало зміни дозування аценокумаролу для досягнення значення міжнародного нормалізованого відношення 2,5-3,5, але при його одночасному застосуванні відзначалося значне зниження рівня агрегації тромбоцитів, вивільнення β-тромбоглобуліну, рівнів фібриногену, факторів Віллебранда (коагуляційна активність (VIII: C), ко-факторів ристоцетину (VIII: vW: Rco) та протеїну у плазмі крові (VIII: vW: Ag)), в'язкості цільної крові і плазми.

Фармакокінетичні взаємодії. Імовірність зміни фармакокінетики пірацетаму під дією інших лікарських засобів низька, оскільки приблизно 90 % препарату виводиться в незміненому вигляді із сечею.

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

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

Протиепілептичні лікарські засоби. Застосування пірацетаму в дозі 20 г щоденно протягом 4 тижнів і більше не змінювало криву концентрації і C_{max} протиепілептичних препаратів у сироватці крові (карбамазепіну, фенітоїну, фенобарбіталу, натрію вальпроату) у хворих на епілепсію, які отримували стабільні дози.

Алкоголь. Сумісний прийом з алкоголем не впливав на рівень концентрації пірацетаму в плазмі крові, і концентрація алкоголю не змінювалась 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 з порушенням гемостазу, станами, що можуть супроводжуватися крововиливами (виразка шлунково-кишкового тракту), під час великих 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.

Порушення функції нирок. Препарат виводиться нирками, тому необхідно особливу увагу приділяти хворим з нирковою недостатністю (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

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

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

Застереження, пов'язані з допоміжними речовинами. Лікарський засіб містить менше 1 ммоль (або 23 мг) натрію у розрахунку на дозу 24 г пірацетаму, тобто практично вільний від натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Не слід застосовувати препарат у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. З огляду на побічні реакції, що спостерігаються при застосуванні цього лікарського засобу, вплив на здатність керувати транспортними засобами та працювати з іншими механізмами можливий, і це слід враховувати.

Спосіб застосування та дози. Препарат у вигляді ін'єкційного розчину застосовують при неможливості застосування пероральних форм пірацетаму. Препарат застосовують шляхом внутрішньовенної ін'єкції (вводять повільно, протягом кількох хвилин) або інфузії (застосовують протягом 24 годин безперервно).

Препарат застосовують дорослим.

Лікування станів, що супроводжуються погіршенням пам'яті, когнітивними розладами. Рекомендована добова доза становить від 2,4 г до 4,8 г, які розподіляють на 2 або 3 введення.

Лікування кортикальної міоклонії. Початкова добова доза становить 7,2 г, яку збільшують на 4,8 г кожні три або чотири дні до максимальної дози 24 г, яку розподіляють на два або три введення. Лікування іншими антиміоклонічними лікарськими засобами слід продовжувати у тих самих дозах. Залежно від отриманого терапевтичного ефекту, якщо можливо, слід знизити дозу інших антиміоклонічних лікарських засобів.

Лікування пірацетамом слід продовжувати до зникнення симптомів первинного захворювання мозку. У пацієнтів із гострим перебігом захворювання з часом може спостерігатися спонтанне покращення, тому кожні 6 місяців варто робити спробу знизити дозу або відмінити лікування препаратом. З цією метою дозу пірацетаму знижують на 1,2 г кожні два дні (кожні три або чотири дні – у разі синдрому Ланца-Адамса з метою попередження раптового рецидиву або виникнення судом, пов'язаних із відміною препарату).

Особливі групи пацієнтів.

Пацієнти літнього віку. Корекція дози рекомендується пацієнтам літнього віку з діагностованими або підозрюваними розладами функції нирок (див. розділ «Пацієнти з порушенням функції нирок»). При лікуванні необхідно контролювати кліренс креатиніну з метою адекватної корекції дози таким пацієнтам у разі необхідності.

Пацієнти з порушенням функції нирок. Оскільки препарат виводиться з організму нирками, слід виявляти обережність при лікуванні хворих з нирковою недостатністю, у таких пацієнтів рекомендується контролювати функцію нирок.

Збільшення періоду напіввиведення безпосередньо пов'язано з погіршенням функції нирок і кліренсу креатиніну. Це також стосується пацієнтів літнього віку, у яких рівень виведення креатиніну залежить від віку. Інтервал між застосуванням повинен бути скоригований на основі функції нирок.

Дозу розраховують за кліренсом креатиніну з використанням такої формули:

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

Ступінь тяжкості ниркової недостатності	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Дозування
Нормальна функція нирок (відсутня ниркова недостатність)	> 80	Звичайна доза, розподілена на 2 або 4 введення
Легкий	50–79	2/3 звичайної добової дози за 2-3 введення
Помірний	30–49	1/3 звичайної добової дози за 2 введення
Тяжкий	< 30	1/6 звичайної добової дози одноразово
Термінальна стадія захворювання нирок	–	Протипоказано

Пацієнти з порушенням функції печінки. Коригування дози не потрібне для хворих з порушенням тільки функції печінки. У разі діагностованих або підозрюваних розладів функції печінки та нирок корекцію дози проводять так, як вказано у підрозділі «Пацієнти з порушенням функції нирок».

Діти. Не застосовують.

Передозування. *Симптоми:* посилення проявів побічної дії препарату. Симптоми передозування спостерігалися при оральному застосуванні препарату у дозі 75 г.

Лікування симптоматичне. Специфічного антидоту немає, можна застосовувати гемодіаліз (виведення 50-60 % пірацетаму).

Побічні реакції. Побічні реакції, відзначені у ході клінічних випробувань та протягом постмаркетингового спостереження, перелічено за класами систем органів та частотою.

Частота визначається таким чином: дуже часто (≥ 1/10), часто (від ≥ 1/100 до < 1/10), нечасто (від ≥ 1/1000 до < 1/100), рідко (від ≥ 1/10000 до < 1/1000), дуже рідко (< 1/10000), частота невідома (не можна оцінити частоту на основі доступних даних).

Постмаркетингові дані недостатні для розрахунку частоти виникнення побічних реакцій у пролікованій популяції.

З боку крові та лімфатичної системи.

Частота невідома: геморагічні розлади.

З боку імунної системи.

Частота невідома: гіперчутливість, анафілактоїдні реакції.

Психічні розлади.

Часто: знервованість.

Нечасто: депресія.

Частота невідома: підвищена збуджуваність, тривожність, збентеження, галюцинації.

З боку нервової системи.

Часто: гіперактивність.

Нечасто: сонливість.

Частота невідома: атаксія, порушення рівноваги, підвищення частоти нападів епілепсії, головний біль, безсоння, тремтіння.

З боку органів слуху та лабіринту.

Частота невідома: запаморочення.

З боку травної системи.

Частота невідома: абдомінальний біль, біль у верхній частині живота, діарея, нудота, блювання.

З боку шкіри та підшкірних тканин.

Частота невідома: ангіоневротичний набряк, дерматити, кропив’янка, свербіж.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз.

Частота невідома: підвищення сексуальної активності.

З боку судин.

Рідко: гіпотензія, тромбофлебіт.

Загальні розлади та стан місця введення.

Нечасто: астенія.

Рідко: біль у місці введення, пропасниця.

Дослідження.

Часто: збільшення маси тіла.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції.

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їхнім законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: https://aisf.dec.gov.ua.

Термін придатності. 4 роки.

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Досліджень не проводилося. Не слід змішувати препарат з іншими лікарськими засобами.

Упаковка. По 5 мл в ампулах № 10 у коробці, № 5×2 у блістерах у коробці; по 10 мл в ампулах № 5, № 10 у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ’Я».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності. Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.