

## ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

### ПИРАЦЕТАМ

**Регистрационный номер:** ЛП-002415

**Торговое название:** Пирацетам

**Международное непатентованное название:** пирацетам

**Лекарственная форма:** капсулы

**Состав на одну капсулу**

Дозировка 200 мг

**Активное вещество:** пирацетам - 200 мг;

**Вспомогательные вещества:** кроскармеллоза натрия - 6,0 мг, магния стеарат - 2,0 мг, повидон-К17 - 5,0 мг.

Капсулы твердые желатиновые № 2.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид - 2,0 %, желатин до 100 %.

Состав крышечки капсулы: краситель железа оксид черный - 0,53 %, краситель железа оксид красный - 0,93 %, краситель железа оксид желтый - 0,2 %, титана диоксид - 0,3333 %, желатин до 100%.

Дозировка 400 мг

**Активное вещество:** пирацетам - 400 мг;

**Вспомогательные вещества:** кроскармеллоза натрия - 12,0 мг, магния стеарат - 4,0 мг, повидон-К17-10,0 мг.

Капсулы твердые желатиновые № 0.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид - 2,0 %, желатин до 100 %.

Состав крышечки капсулы: краситель азорубин - 0,1445 %, краситель синий патентованный -0,002 %, титана диоксид - 2,0 %, желатин до 100 %.

**Описание**

Дозировка 200 мг

Капсула №2: корпус белого цвета, крышечка темно-коричневого цвета непрозрачные.

Дозировка 400 мг

Капсула №0: корпус белого цвета, крышечка темно-розового цвета непрозрачные.

Содержимое капсул - смесь порошка и гранул белого или почти белого цвета. Допускается уплотнение содержимого капсулы по форме капсулы, распадающееся при надавливании.

**Фармакотерапевтическая группа:** ноотропное средство

**Код АТХ:** N06ВХ03

#### 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 простаглицлинов 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<sub>max</sub>) 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<sub>max</sub> на 17 % и увеличивает время его достижения (T<sub>max</sub>) до 1,5 часов. У женщин при приеме пирацетама в дозе 2,4 г C<sub>max</sub> и площадь под кривой «концентрация - время» (AUC) на 30% выше, чем у мужчин.

Распределение. Объем распределения (V<sub>d</sub>) 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<sub>1/2</sub>) 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<sub>1/2</sub> удлинняется при почечной недостаточности (при терминальной ХГН - до 59 часов). Фармакокинетика пирацетама не изменяется у пациентов с печеночной недостаточностью.

#### ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Симптоматическое лечение интеллектуально-мнестических нарушений при отсутствии установленного диагноза деменции.
- Уменьшение проявлений кортикальной миоклонии у чувствительных к пирацетаму пациентов как в качестве монотерапии, так и в составе комплексной терапии.

В целях определения чувствительности к пирацетаму в конкретном случае может быть проведен пробный курс лечения.

#### ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Индивидуальная непереносимость пирацетама или производных пирролидона, а также других компонентов 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

Вследствие антиагрегантного эффекта, пирацетам должен назначаться с осторожностью пациентам с тяжелыми геморрагическими нарушениями, риском кровотечений, нарушениями гемостаза; геморрагическими цереброваскулярными нарушениями в анамнезе; у пациентов с хирургическими вмешательствами, включая стоматологические вмешательства; у пациентов, принимающих антикоагулянты и антиагреганты, в том числе низкие дозы аспирина; при хронической почечной недостаточности (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 или опосредованного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие. Пирацетам проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко. Плазменная концентрация пирацетама у новорожденных

достигает 70-90 % от таковой 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 натошак, запивая жидкостью.

При расстройствах памяти, интеллектуальных нарушениях:

2,4 -4,8 г/сутки в 2-3 приема.

Лечение кортикальной миоклонии:

Лечение 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.

Дозирование пациентам 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:

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

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

Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Режим дозирования
Норма	>80	обычная доза в 2-4 приема
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 пациентам дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Дозирование пациентам с нарушением функции печени:

Пациенты с нарушением функции печени в коррекции дозы не нуждаются. Пациентам с нарушением функции и почек, и печени дозирование осуществляется по схеме (см. раздел «Дозирование пациентам 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 репродуктивной системы: повышение сексуального влечения.

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 об-

ласти 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 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 повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (отмечалось более выраженное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллбранда, вязкости крови и плазмы по сравнению с применением только прямых 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» противозипилептических препаратов (карбамазепина, фенитоина, фенobarбитала, 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. 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

Капсулы 200 мг, 400 мг.

По 5, 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 100 или 120 капсул в банки полимерные для лекарственных средств.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6, 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

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**

**Тел./факс: (84862) 3-41-09, 7-18-51**

**E-mail: ozon\_pharm@samtel.ru**

**www.ozonpharm.ru**

**ПРОИЗВОДИТЕЛЬ ООО «Озон»**