

НООТРОПИЛ® (NOOTROPIL®)

PIRACETAMUM N06B X03

UCB Pharma

СОСТАВ И ФОРМА ВЫПУСКА:

табл. п/о 800 мг, № 30

Пирацетам 800 мг

№ UA/0054/04/02 от 04.06.2009 до 04.06.2014

табл. п/о 1200 мг, № 20

Пирацетам 1200 мг

Прочие ингредиенты: макрогол 6000, кремния ангидрид коллоидный (Аэросил R 972).

№ UA/0054/04/01 от 04.06.2009 до 04.06.2014

капс. 400 мг, № 60

Пирацетам 400 мг

№ UA/0054/05/01 от 18.05.2010 до 18.05.2015

р-р д/перорал. прим. 200 мг/мл фл. 125 мл, № 1

Пирацетам 200 мг/мл

№ UA/0054/02/01 от 25.08.2009 до 25.08.2014

р-р д/ин. 20 % амп. 5 мл, № 12

р-р д/ин. 20 % амп. 15 мл, № 4

Пирацетам 200 мг/мл

Прочие ингредиенты: натрия ацетат, кислота уксусная ледяная, вода для инъекций.

№ UA/0054/01/01 от 22.01.2009 до 22.01.2014

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА:

Фармакодинамика. Активным компонентом препарата является пирацетам, циклическое производное ГАМК. Пирацетам — ноотропное средство, действующее на головной мозг, улучшая когнитивные (познавательные) функции, такие как способность к обучению, память, внимание, а также умственную трудоспособность. Механизмов влияния препарата на ЦНС, вероятно, несколько: изменение скорости распространения возбуждения в головном мозгу; усиление метаболических процессов в нервных клетках; улучшение микроциркуляции путем влияния на реологические характеристики крови, не вызывая при этом сосудорасширяющего действия. Улучшает связи между полушариями головного мозга и синаптическую проводимость в неокортикальных структурах. После продолжительного применения препарата у пациентов со снижением функции головного мозга отмечают улучшение когнитивных функций, улучшение внимания. Эти изменения объективно фиксируются на ЭЭГ (усиление α - и β -ритмов мозга и ослабление δ -ритмов). Пирацетам подавляет агрегацию тромбоцитов и восстанавливает эластичность мембраны эритроцитов, уменьшает адгезию эритроцитов. В дозе 9,6 г снижает уровень фибриногена и фактора Виллебранда на 30–40% и удлиняет время кровотечения. Пирацетам оказывает протекторное и восстанавливающее действие при нарушении функции головного мозга вследствие гипоксии, интоксикации, электроимпульсной терапии. Пирацетам снижает выраженность и продолжительность вестибулярного нистагма, в качестве монотерапии эффективен при лечении кортикальной миоклонии.

Фармакокинетика. C_{max} после в/в введения достигается в крови через 30 мин, а в СМЖ — через 5 ч и составляет 40–60 мкг/мл. Объем распределения пирацетама — почти 0,6 л/кг массы тела. $T_{1/2}$ препарата из плазмы крови составляет 4–5 ч и соответственно 8,5 ч — из СМЖ. Этот период может удлиняться при почечной недостаточности. Не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме. 80–100% пирацетама выделяется почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации. Почечный клиренс пирацетама у здоровых добровольцев

составляет 86 мл/мин. Фармакокинетика пирацетама не изменяется у больных печеночной недостаточностью. Пирацетам проникает через ГЭБ и плацентарный барьер и мембраны, которые используются при гемодиализе. При исследовании на животных установлено, что пирацетам избирательно накапливается в тканях коры головного мозга, преимущественно в лобных, теменных и затылочных зонах, мозжечке и базальных ганглиях.

ПОКАЗАНИЯ:

взрослые:

- симптоматическое лечение психоорганического синдрома, который сопровождается снижением памяти, головокружением, снижением концентрации внимания;
- лечение головокружения и связанных с ним нарушений равновесия, за исключением головокружения вазомоторного и психического происхождения;
- лечение кортикальной миоклонии как монопрепарат или в составе комплексной терапии;
- в составе комплексной терапии серповидно-клеточной анемии для уменьшения проявлений вазоокклюзионного криза.

Дети:

- лечение дизлексии у детей в возрасте старше 8 лет в сочетании с другими надлежащими методами, включая логопедию;
- лечение кортикальной миоклонии как монопрепарат или в составе комплексной терапии;
- в составе комплексной терапии серповидно-клеточной анемии у детей в возрасте от 3 лет для уменьшения проявлений вазоокклюзионного криза.

ПРИМЕНЕНИЕ:

препарат в форме инъекционного р-ра применяют в острых случаях или при невозможности использования пероральных форм пирацетама. Для взрослых суточная доза составляет — 30–160 мг/кг массы тела (кратность применения — 2–3 раза в сутки).

Препарат применяют в/в (вводят медленно, на протяжении нескольких минут), начиная с 2–4 г и быстро доводят дозу до 4–6 г/сут. После улучшения состояния переходят на пероральное применение. В форме таблеток, капсул и р-ра для перорального применения препарат принимают внутрь. Продолжительность лечения и выбор индивидуальной дозы зависит от тяжести состояния больного и скорости обратной динамики клинической картины заболевания.

Лечение психоорганического синдрома

Рекомендуемая суточная доза составляет 2,4–4,8 г. Обычно дозу распределяют на 2–3 приема.

Лечение кортикальной миоклонии

Начальная суточная доза обычно составляет 7,2 г, которую на протяжении 3–4 дней повышают до 24 г/сут. Суточная доза распределяется на 3–4 приема (2–3 введения для инъекционного р-ра).

Если терапевтический эффект слабый или отсутствует — продолжают применять препарат в той же дозе до 7 сут. Если за этот период не получено желаемого терапевтического эффекта, лечение пирацетамом следует прекратить и назначить другие антимиоклонические средства. При достижении необходимого терапевтического эффекта терапию продолжают до исчезновения симптомов заболевания. Для предупреждения ухудшения состояния больных нельзя резко прекращать применение препарата. Необходимо постепенно снижать дозу на 1–2 г каждые 2 дня (каждые 3–4 дня в случае синдрома Ланца — Адамса). При применении во время лечения других антимиоклонических средств дозу пирацетама не снижают, но в зависимости от клинической картины дозирование других препаратов может снижаться, если это возможно. Больным с острыми спонтанными приступами необходимо каждые 6 мес назначать повторные курсы лечения препаратом, корректируя при этом дозу в зависимости от состояния пациента, до исчезновения или уменьшения проявлений болезни.

Лечение головокружения и связанных с ним нарушений равновесия

Рекомендуемая суточная доза составляет 2,4–4,8 г. Обычно дозу распределяют на 2–3 приема.

В составе комплексной терапии серповидно-клеточной анемии для уменьшения проявлений вазоокклюзионного криза

Применяют в дозе 300 мг/кг массы тела, распределенной на 4 введения.

Применение у детей

В составе комплексной терапии дизлексии

Применяют у детей в возрасте старше 8 лет. Суточная доза составляет обычно 3,2 г, распределенная на 2 приема.

В составе комплексной терапии серповидно-клеточной анемии для уменьшения проявлений вазоокклюзионного криза

Применяют у детей в возрасте от 3 лет в дозе 300 мг/кг массы тела, распределенной на 4 введения.

Дозирование у больных с нарушением функции почек. Поскольку препарат выделяется из организма почками, следует соблюдать осторожность при лечении больных с почечной недостаточностью. Лечение таким пациентам назначают в зависимости от степени тяжести почечной недостаточности, соблюдая такие рекомендации:

Степень почечной недостаточности	Клиренс креатинина, мл/мин	Дозирование
–	>80	Обычная доза
Легкая	50–79	$\frac{2}{3}$ обычной дозы за 2–3 введения
Умеренная	30–49	$\frac{1}{3}$ обычной дозы за 2 введения
Тяжелая	<30	$\frac{1}{6}$ обычной дозы однократно
Терминальная стадия	–	Противопоказано

Для больных с нарушением функции печени нет необходимости корректировать дозу. В случае диагностированных нарушений функции печени и почек, коррекцию дозы проводят так, как указано в разделе

Дозирование у больных с нарушением функции почек

Применение у пациентов пожилого возраста. Коррекция дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с диагностированным нарушением функции почек (см. Дозирование у больных с нарушением функции почек). При длительном лечении необходимо контролировать клиренс креатинина с целью адекватной коррекции дозы препарата таким пациентам.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

повышенная чувствительность к парацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата.

Острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт).

Терминальная стадия почечной недостаточности (при клиренсе креатинина <20 мл/мин). Хорея Хантингтона. Для р-ра — период беременности и кормления грудью. Детский возраст до 8 лет.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

Со стороны нервной системы: часто — гиперкинезия; иногда — атаксия, головная боль, бессонница, повышение частоты приступов эпилепсии, нарушение равновесия, сонливость, тремор.

Со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, в том числе анафилаксия.

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, боль в верхней части живота, тошнота, диарея, рвота.

Со стороны вестибулярной системы: вертиго.

Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, дерматит, зуд, сыпь, крапивница.

Психические нарушения: часто — повышенная возбудимость, сонливость, депрессия; иногда — тревожность, спутанность сознания, галлюцинации.

Другие: часто — увеличение массы тела; иногда — астения; очень редко — АГ, сексуальное возбуждение, тромбоз, гипертермия.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ:

в связи с тем, что пираретам снижает агрегацию тромбоцитов, необходимо с осторожностью назначать препарат больным с нарушением гемостаза, во время обширных хирургических операций или больным с симптомами тяжелого кровотечения. При лечении больных с кортикальной миоклонией следует избегать резкого прерывания лечения, поскольку это может вызвать возобновление приступов. При продолжительной терапии у лиц пожилого возраста рекомендуют регулярный контроль за показателями функции почек, при необходимости корректируют дозу в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина. Проникает через фильтровальные мембраны аппаратов для гемодиализа.

Препарат в форме капсул содержит лактозу. Поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять данное лекарственное средство.

Пациенты пожилого возраста. При длительной терапии у больных пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль показателей функции почек, при необходимости корректируют дозу в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина.

Предупреждения, связанные с содержанием в препарате вспомогательных веществ: препарат содержит 2 ммоль (46 мг) натрия в расчете на 24 г пираретама.

Применение в период беременности и кормления грудью. Не применять препарат в период беременности. Препарат проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

Дети. Применяют препарат у детей в возрасте старше 8 лет для лечения дизлексии.

Способность влиять на скорость реакции при управлении транспортными средствами и работе с механизмами. Следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами или работе с механизмами, учитывая возможность возникновения побочных реакций со стороны ЦНС.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ:

при сочетанном применении с тиреоидными гормонами (Т3+Т4) возможна повышенная раздражительность, дезориентация и нарушения сна. Не отмечено взаимодействия с клоназепамом, фенитоином, фенобарбиталом, вальпроатом натрия. При применении пираретама в высоких дозах (9,6 г/сут) повышается эффективность аценокумарола у больных с венозным тромбозом: отмечено значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, фактора Виллебрандта, вязкости крови и плазмы крови. Вероятность изменения фармакодинамики пираретама под действием других лекарственных средств низкая, поскольку 90% препарата выводится в неизменном виде с мочой. *In vitro* пираретам не подавляет цитохром Р450 изоформы СYP 1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2Э1 и 4A9/11 в концентрации 142; 426; 1422 мкг/мл. При концентрации 1422 мкг/мл отмечено незначительное угнетение СYP 2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако уровень K_i этих двух СYP-изомеров достаточен при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, которые подвергаются биотрансформации этими ферментами, маловероятно. Применение пираретама в дозе 20 мг/сут не изменяло пик и кривую уровня концентрации противосудорожных препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, вальпроат) у больных эпилепсией. Сочетанный прием с алкоголем не влиял на уровень концентрации пираретама в сыворотке крови, и концентрация алкоголя в сыворотке крови не изменялась при приеме 1,6 г пираретама.

ПЕРЕДОЗИРОВКА:

симптомы: усиление проявлений побочного действия препарата. При приеме 75 г пираретама внутрь отмечены диспептические проявления, такие как диарея с кровью и боль в животе. Других симптомов передозировки пираретама не отмечено.

Лечение симптоматическое. Сразу после значительной пероральной передозировки можно промыть желудок или вызвать рвоту. Специфического антидота нет, можно применять гемодиализ (выводится 50–60% пираретама).

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ:

в сухом месте при температуре не выше 25 °С. После вскрытия флакона р-р для перорального применения следует использовать в течение 1 мес.