Ноотропил



Код АТХ:

- N06BX03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пирацетам

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой в блистере 15 шт.; в коробке 2 блистера (800 мг) или в блистере 10 шт.; в коробке 2 блистера (1200 мг).

Раствор для в/в и в/м введения в ампулах по 5 или 15 мл; в упаковках контурных пластиковых (в поддонах) 4 (15 мл) или 6 (5 мл) шт.; в пачке картонной 1 (по 4 амп.) или 2 (по 6 амп.) упаковки.

Раствор для приема внутрь во флаконах темного стекла по 125 мл; в коробке 1 флакон в комплекте с мерным стаканчиком.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: пирацетам 800 мг или 1200 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид — 14,7/22,05 мг; магния стеарат — 2/3 мг; макрогол 6000 — 20/30 мг; натрия кроскармеллоза — 16,7/25,05 мг

Оболочка: Opadry Y-1-7000 (титана диоксид (E171) — 8/12 мг, макрогол 400 — 1,6/2,4 мг, гипромеллоза 2910 5cP (E464) — 16/24 мг) — 25,6/38,4 мг; Opadry OY-S-29019 (гипромеллоза 2910 50cP0,95/1,425 мг, макрогол 6000 — 0,05/0,075 мг) — 1/1,5 мг.

Одна ампула раствора для в/в и в/м введения содержит

Активное вещество: пирацетам 1 г/5 мл или 3 г/15 мл

Вспомогательные вещества: натрия ацетата тригидрат — 0,005/0,015 г; ледяная уксусная кислота —

0,000245/0,000735 г; вода для инъекций — 4,194/12,585.

100 мл раствора для приема внутрь содержат

Активное вещество: пирацетам 20 г

Вспомогательные вещества: глицерол 85% — 27,0 г; натрия сахарин — 0,300 г; натрия ацетат — 0,200 г; метилпарагидроксибензоат — 0,135 г; пропилпарагидроксибензоат — 0,015 г; 52247/А абрикосовый (ароматизатор) — 0,03 г; 52939/А карамельный (ароматизатор) — 0,015 г; кислота уксусная ледяная — 0, 016±5% г; вода очищенная — 62,10 г±5 %.

Описание:

Таблетки, покрытые оболочкой продолговатые, белого или почти белого цвета, покрытые оболочкой, с разделительной поперечной риской с обеих сторон; на одной стороне таблетки справа и слева от риски гравировка «N».

Раствор для в/в и в/м введения прозрачная, бесцветная жидкость.

Раствор для приема внутрь прозрачная, бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Активный компонент — пирацетам, циклическое производное ГАМК.

Имеющиеся данные свидетельствуют, что основной механизм действия пирацетама не является клеточноспецифичным или органоспецифичным.

Пирацетам связывается с полярными головками фосфолипидов и образует мобильные комплексы пирацетам-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 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 простациклинов здоровым эндотелием.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь пирацетам быстро и практически полностью абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность пирацетама близка к 100%. После однократного приема препарата в дозе 3,2 г C_{max}составляет 84 мкг/мл, после многократного приема 3,2 мг 3 раза в день — 115 мкг/мл и достигается через 1 ч в плазме крови и через 5 ч — в спинно-мозговой жидкости. Прием пищи снижает C_{max}на 17% и увеличивает T_{max}до 1,5 ч. У женщин при приеме пирацетама в дозе 2,4 г C_{max}и AUC на 30% выше, чем у мужчин.

Распределение. V_dсоставляет около 0,6 л/кг. Пирацетам проникает через ГЭБ и плацентарный барьер. 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. $T_{1/2}$составляет 4–5 ч из плазмы крови и 8,5 ч — из спинномозговой жидкости. $T_{1/2}$не зависит от пути введения. 80–100% пирацетама выводится почками в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации. Общий клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 80–90 мл/мин. $T_{1/2}$удлиняется при почечной недостаточности (при терминальной хронической почечной недостаточности — до 59 ч). Фармакокинетика пирацетама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью.

Показания к применению:

Общие для всех лекарственных форм

У взрослых

— симптоматическое лечение психоорганического синдрома, в частности у пожилых пациентов, сопровождающегося снижением памяти, головокружением, пониженной концентрацией внимания и снижением общей активности, изменением настроения, расстройствами поведения, нарушением походки, а также у пациентов с болезнью Альцгеймера и сенильной деменцией альцгеймеровского типа;

— лечение головокружения и связанных с ним расстройств равновесия, за исключением головокружения сосудистого и психического происхождения;

— лечение кортикальной миоклонии в качестве моно- или комплексной терапии;

Для раствора для в/в и в/м введения дополнительно

— лечение серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза у взрослых и детей.

Для таблеток дополнительно

— лечение последствий ишемического инсульта, таких как нарушение речи, нарушение эмоциональной сферы, снижение двигательной и психической активности;

— хронический алкоголизм — для лечения психоорганического и абстинентного синдромов;

— в составе комплексной терапии низкой обучаемости у детей с психоорганическим синдромом;

— период восстановления после коматозных состояний, в т.ч. после травм и интоксикаций головного мозга;

— в составе комплексной терапии серповидноклеточной анемии.

Для раствора для приема внутрь дополнительно:

У взрослых

— профилактика серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза.

У детей

— лечение дислексии (в комплексе с другими методами);

— профилактика серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза.

Относится к болезням:

- Алкоголизм
- Головокружение
- Инсульт
- Кортикальная миоклония
- Психоорганический синдром
- Серповидно-клеточный вазоокклюзивный криз
- Серповидноклеточная анемия
- Черепно-мозговая травма

Противопоказания:

Препарат не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— повышенная чувствительность к пирацетаму или производным пирролидона, а также другим компонентам препарата;

— психомоторное возбуждение на момент назначения препарата;

— хорея Гентингтона;

— острое нарушение мозгового кровообращения (геморрагический инсульт);

— терминальная стадия почечной недостаточности (Cl креатинина <20 мл/мин);

— детский возраст до 1 года (раствор для приема внутрь) и до 3 лет (раствор для в/в и в/м введения, капсулы и таблетки, покрытые оболочкой).

С осторожностью: нарушение гемостаза, обширные хирургические вмешательства. тяжелое кровотечение, хроническая почечная недостаточность (при Cl креатинина 20–80 мл/мин).

Способ применения и дозы:

В/в, в/м, внутрь во время приема пищи или натощак; таблетки следует запивать жидкостью (вода, сок).

Парентеральное введение пирацетама назначается при невозможности применения пероральньгх форм препарата (бессознательном состоянии, затруднении глотания). Предпочтительным является в/в введение.

Раствор для в/в, в/м введения

В/в инфузия суточной дозы выполняется через катетер с постоянной скоростью на протяжении 24 ч в сутки (например в начальной стадии лечения тяжелой миоклонии).

Предварительно препарат разводят в одном из совместимых инфузионных растворов: декстрозы 5, 10 или 20%; фруктозы 5, 10, 20%; натрия хлорида 0,9%; декстрана 40 10% (в растворе натрия хлорида 0,9%); растворе Рингера; растворе маннитола 20%.

Общий объем раствора, предназначенный для введения, определяется с учетом клинических показаний и состояния пациента.

Болюсное в/в введение (например неотложное лечение криза при серповидно-клеточной анемии) выполняется в течение не менее 2 мин, суточная доза при этом распределяется на несколько введений (2–4) с равномерными интервалами так, чтобы доза на одно введение не превышала 3 г.

В/м препарат вводится, если введение через вену затруднено. Объем раствора, вводимого в/м, не может превышать 5 мл. Кратность введения препарата аналогична таковой при его в/в или пероральном применении. При появлении возможности переходят на пероральный прием препарата. Продолжительность лечения определяется врачом в зависимости от заболевания и с учетом динамики симптомов.

Симптоматическое лечение хронического психоорганического синдрома: — 2,4–4,8 г/сут (капсулы, раствор для приема внутрь — в 2–3 приема).

Лечение головокружения и связанного с ним нарушения равновесия — 2,4–4,8 г/сут (капсулы, раствор для приема внутрь — в 2–3 приема).

Кортикальная миоклония. Лечение начинают с дозы 7,2 г/сут, каждые 3–4 дня дозу увеличивают на 4,8 г/сут до достижения максимальной дозы (24 г/сут); капсулы, раствор для приема внутрь — в 2–3 приема. Лечение продолжают на протяжении всего периода заболевания. Каждые 6 мес следует предпринимать попытки уменьшения дозы или отмены препарата, постепенно сокращая дозу на 1,2 г/сут каждые 2 дня.

Серповидно-клеточная анемия. В период криза — 300 мг/кг в/в, разделенная на 4 равные дозы.

Дозирование больным с нарушением функции почек. Дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (см. нижеприведенную таблицу).

Клиренс креатинина для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

Cl креатинина, мл/мин

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

Таблетки, покрытые оболочкой

Суточная доза — 30–160 мг/кг массы тела, кратность приема — 2–4 раза в сутки.

При лечении хронического психоорганического синдрома в зависимости от выраженности симптомов назначают

Ноотропил4,8 г/сут в течение первой недели, а затем переходят на поддерживающую дозу 1,2–2,4 г/сут.

При лечении последствий инсульта — 4,8 г/сут.

При алкогольном абстинентном синдроме — 12 г/сут в 2–3 приема. Поддерживающая доза — 2,4 г/сут.

При лечении головокружения и связанных с ним расстройств равновесия — 2,4–4,8 г/сут.

При лечении коматозных состояний, а также трудностей восприятия у лиц с травмами головного мозга начальная доза — 9–12 г/сут, поддерживающая — 2,4 г/сут. Лечение продолжают не менее 3 нед.

Детям для коррекции низкой обучаемости Ноотропилназначают в дозе 3,3 г/сут (примерно 8 мл раствора для приема внутрь 2 раза в сутки). Лечение продолжают в течение всего учебного года.

При кортикальной миоклонии лечение начинают с дозы 7,2 г/сут, каждые 3–4 дня дозу увеличивают на 4,8 г/сут до достижения максимальной дозы 24 г/сут. Лечение продолжают на протяжении всего периода болезни. Каждые 6 мес следует предпринимать попытки уменьшения дозы или отмены препарата, постепенно сокращая дозу на 1,2 г/сут каждые 2 дня. При отсутствии эффекта или незначительном терапевтическом эффекте лечение прекращают.

При серповидноклеточной анемии суточная профилактическая доза составляет 160 мг/кг массы тела, разделенная на 4 приема.

Раствор для приема внутрь

Профилактика серповидно-клеточного вазоокклюзивного криза. Суточная профилактическая доза составляет 160 мг/кг, разделенная на 4 равные дозы.

Лечение дислексии у детей (в комплексе с другими методами лечения): рекомендуемая суточная доза для детей от 8 лет и подростков — 3,2 г, разделенная на 2 приема.

Пожилым больным дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек. Дозирование больным с нарушением с нарушением функции печени: больные с нарушением функции печени в коррекции дозы не нуждаются. Больным с нарушением функции и почек и печени, дозирование осуществляется по схеме (см. раздел «Дозирование больным с нарушением функции почек»).

Поскольку Ноотропилвыводится из организма почками, при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью и пациентам пожилого возраста дозу следует корректировать в зависимости от величины Cl креатинина.

Дозирование больным с нарушением функции почек

Почечная недостаточность	Cl креатинина, мл/мин	Режим дозирования
Отсутствует (норма)	>80	Обычная доза
Легкая	50–79	2/3 обычной дозы в 2–3 приема
Средняя	30–49	1/3 обычной дозы в 2 приема
Тяжелая	<30	1/6 обычной дозы однократно
Терминальная стадия	<20	Противопоказано

Пожилым больным дозу корректируют при наличии почечной недостаточности, при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Пациентам с нарушением функции печени коррекции дозы не требуется.

Пациентам с нарушением функций почек и печени дозирование осуществляется по таблице, приведенной выше.

Меры предосторожности

При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прерывания лечения, т.к. это может вызвать возобновление приступов.

При лечении серповидно-клеточной анемии доза менее 160 мг/кг или нерегулярный прием препарата могут вызвать обострение заболевания.

При лечении пациентов, находящихся на гипонатриевой диете, рекомендуется учитывать, что раствор пирацетама для приема внутрь в дозе 24 г содержит 80,5 мг натрия.

В период лечения следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Побочное действие:

Общие для всех лекарственных форм

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: двигательная расторможенность (1,72%), раздражительность (1,13%), сонливость (0,96%), депрессия (0,83%), астения (0,23%).

Эффекты частота которых не установлена (из-за недостаточности данных): головная боль, бессонница, возбуждение, нарушение равновесия, атаксия, обострение течения эпилепсии, тревога, галлюцинации, спутанность сознания.

Со стороны пищеварительной системы: в единичных случаях — тошнота, рвота, диарея, боли в животе (в т.ч. гастралгия).

Со стороны кожных покровов: дерматит, зуд, крапивница.

Со стороны обмена веществ: увеличение массы тела (1,29%)

Со стороны органов слуха: вертиго.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, гиперчувствительность, анафилактические реакции.

Для раствора для в/в/ и в/м введения дополнительно

Другие: в редких случаях — боль в месте введения, тромбофлебит, гипертермия и гипотония (при в/в введении).

Передозировка:

Симптомы: после перорального приема пирацетама в дозе 75 г отмечены диспептические явления, такие как диарея с кровью и боли в животе. По-видимому, это было связано с употреблением большой суммарной дозы сорбитола, ранее входившего в состав препарата для лекарственной формы раствор для приема внутрь.

Лечение: сразу после приема препарата внутрь можно промыть желудок или вызвать искусственную рвоту. Рекомендуется проведение симптоматической терапии, которая может включать гемодиализ. Специфического антидота нет. Эффективность гемодиализа для пирацетама составляет 50–60%.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Для раствора для в/в и в/м введения, раствора для приема внутрь

Контролируемых исследований применения препарата во время беременности не проводилось. Пирацетам проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко. Концентрация препарата у новорожденных достигает 70–90 % от концентрации его в крови у матери. Пирацетам не должен назначаться во время беременности. Следует воздержаться от грудного вскармливания при назначении женщине пирацетама.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под воздействием других лекарственных препаратов низкая, т.к. 90% препарата выводится в неизмененном виде с мочой.

При одновременном применении с гормонами щитовидной железы отмечены сообщения о спутанности сознания, раздражительности и нарушении сна.

Согласно опубликованному исследованию, пациентов с рецидивирующим венозным тромбозом пирацетам в дозе 9,6 г/сут повышает эффективность непрямых антикоагулянтов (отмечалось более выраженное снижение агрегации тромбоцитов, концентрации фибриногена, факторов Виллебранда, вязкости крови и плазмы по сравнению с применением только непрямых антикоагулянтов).

Пирацетам не угнетает изоферменты цитохрома Р450. Метаболическое взаимодействие с другими препаратами маловероятно.

Прием пирацетама в дозе 20 г/сут в течение 4 нед не изменял максимальную концентрацию в сыворотке и AUC противоэпилептических препаратов (карбамазепина, фенитоина, фенобарбитала, вальпроата).

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 и меры предосторожности:

В связи с влиянием пирацетама на агрегацию тромбоцитов с осторожностью следует назначать препарат пациентам с нарушением гемостаза, во время обширных хирургических вмешательств или больным с симптомами тяжелого кровотечения. При лечении кортикальной миоклонии следует избегать резкого прерывания лечения, что может вызвать возобновление приступов.

При длительной терапии пациентам пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль показателей функции почек, при необходимости проводят коррекцию дозы в зависимости от результатов исследования клиренса креатинина. Проникает через фильтрующие мембраны аппаратов для гемодиализа.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Принимая во внимание возможные побочные эффекты, следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и выполнении работы с механизмами.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Nootropil