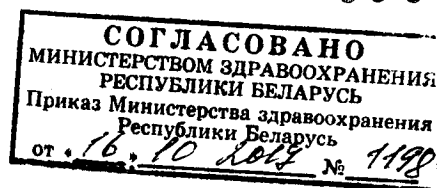


5960 - 2017



Инструкция по медицинскому применению

ТИОЦЕТАМ (ТНЮСЕТАМ)

Общая характеристика:

Международное непатентованное название (МНН): отсутствует.

основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или с едва желтоватым оттенком жидкость.

Состав: 1 мл раствора содержит морфолиниевой соли тиазотной кислоты, в пересчете на 100% вещество 25 мг, что эквивалентно 16,6 мг тиазотной кислоты; пирацетама 100 мг;

вспомогательное вещество: вода для инъекций.

Форма выпуска. Раствор для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа. Прочие психостимулирующие и ноотропные средства.
Код АТС N06B X.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Лекарственное средство обладает антиоксидантными, мембраностабилизирующими и ноотропными свойствами.

Лекарственное средство улучшает интегративную и когнитивную деятельность мозга, способствует устранению симптомов амнезии, повышает показатели кратковременной и долговременной памяти.

Фармакологический эффект лекарственного средства обусловлен взаимопотенцирующим действием тиотриазолина и пирацетама.

Лекарственное средство способно ускорять окисление глюкозы в реакциях аэробного и анаэробного окисления, влиять на биоэнергетические процессы, повышать уровень АТФ.

Лекарственное средство тормозит пути образования активных форм кислорода, реактивирует антиоксидантную систему ферментов, особенно супероксиддисмутазу, тормозит свободнорадикальные процессы в тканях мозга при ишемии, улучшает реологические свойства крови за счет активации фибринолитической системы.

Фармакокинетика.

Объем распределения пирацетама – почти 0,6 л/кг. Период полувыведения пирацетама из плазмы крови составляет 4-5 часов и, соответственно, 6-8 часов из спинномозговой жидкости. Этот период может удлиняться при почечной недостаточности. Не связывается с белками плазмы крови, не метаболизируется в организме. 80-100 % пирацетама выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации. Почечный клиренс пирацетама у здоровых добровольцев составляет 86 мл/мин. Фармакокинетика пирацетама не изменяется у больных с печеночной недостаточностью. Пирацетам проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, мембраны, используемые 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.

Максимальная концентрация тиазотной кислоты в плазме крови достигается при внутримышечном введении – через 0,84 часа, при внутривенном – через 0,1 часа. Связывание с белками крови не превышает 10 %.

5960 - 2017

Показания к применению.

Симптоматическое лечение расстройств памяти и интеллектуальных нарушений при отсутствии диагноза деменции (симптоматическое лечение хронического психоорганического синдрома) у пациентов с хроническими нарушениями мозгового кровообращения (дисциркуляторная энцефалопатия), диабетической энцефалопатией, последствиями перенесенного ишемического инсульта или черепно-мозговой травмы.

Способ применения и дозы.

При лечении последствий ишемического инсульта назначают по 20-30 мл лекарственного средства, предварительно разведенного в 100-150 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, и вводят внутривенно капельно 1 раз в сутки. Курс лечения составляет 2 недели.

Для лечения энцефалопатии назначают внутримышечно 5 мл лекарственного средства 1 раз в сутки в течение 10-15 суток.

При диабетической энцефалопатии по 5 мл внутримышечно 1 раз в сутки на протяжении 10 дней с дальнейшим назначением таблетированной формы лекарственного средства на протяжении 45 дней за 30 минут до приема пищи.

Пациентам с почечной недостаточностью требуется коррекция дозы лекарственного средства в соответствии со следующей схемой:

| Почечная недостаточность | Клиренс креатинина (мл/мин) | Доза и частота применения |
|--------------------------|-----------------------------|-------------------------------|
| Норма | >80 | Обычная доза |
| Легкая степень | 50-79 | 2/3 обычной дозы в 2-3 приема |
| Средняя степень | 30-49 | 1/3 обычной дозы в 2 приема |
| Тяжелая степень | <30 | 1/6 обычной дозы, однократно |
| Конечная стадия | - | Противопоказано |

У пациентов пожилого возраста дозу корректируют при наличии почечной недостаточности; при длительной терапии необходим контроль функционального состояния почек.

Пациентам с нарушениями функции печени коррекции дозы не требуется.

Пациентам с нарушениями функции почек и печени дозы корректируют в зависимости от показателей клиренса креатинина (см. выше).

Дозировку и длительность лечения определяет врач в каждом индивидуальном случае отдельно в зависимости от характера и течения заболевания.

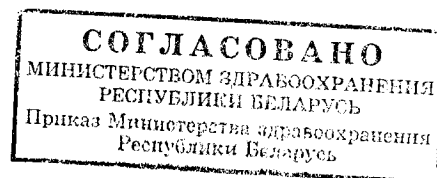
Лекарственное средство применяют сразу после вскрытия ампулы. Ампула с лекарственным средством предназначена только для однократного применения. Остатки препарата необходимо уничтожить. Приготовленный для внутривенного введения раствор следует использовать немедленно.

Побочное действие.

При клиническом применении препарата Тиоцетам, раствор для инъекций, могут наблюдаться случаи побочных реакций:

со стороны центральной и периферической нервной системы: головная боль, общая слабость;

со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота;



со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая высыпания, зуд, крапивницу, ангионевротический отек, анафилактический шок;

со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение артериального давления;

со стороны вестибулярной системы: головокружение;

общие нарушения и нарушения в месте введения: гиперемия кожи и зуд в месте введения.

У больных возможно развитие побочных реакций, обусловленных отдельными компонентами препарата:

- пираретамом:

со стороны крови и лимфы: геморрагические нарушения;

со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, анафилактоидные реакции;

психические расстройства: нервозность, депрессия, повышенная возбудимость, тревожность, спутанность сознания, галлюцинации;

со стороны нервной системы: гиперкинезия, сонливость, атаксия, нарушения равновесия, повышение частоты приступов эпилепсии, головная боль, бессонница, тремор;

со стороны органов слуха и лабиринта: головокружение;

со стороны пищеварительной системы: абдоминальная боль, боль в верхней части живота, диарея, тошнота, рвота;

со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, дерматиты, сыпь, крапивница, зуд;

со стороны репродуктивной системы: повышение сексуальной активности;

сосудистые нарушения: гипотензия, тромбозы;

общие нарушения и нарушения в месте введения: астения, боль в месте введения, лихорадка, увеличение массы тела.

– тиазотной кислотой:

аллергические реакции: гиперемия кожи, лихорадка;

со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, шум в ушах;

со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, повышение артериального давления;

со стороны желудочно-кишечного тракта: сухость во рту, вздутие живота;

со стороны дыхательной системы: одышка, приступы удушья.

В случае возникновения побочных реакций, в том числе не указанных в инструкции по применению, необходимо прекратить применение лекарственного средства и обратиться к врачу.

Противопоказания.

- повышенная чувствительность к пираретаму, тиазотной кислоте, а также к производным пирролидона или тиазотной кислоты;

- терминальная стадия почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 20 мл/мин);

- хорея Хантингтона;

- острое нарушение мозгового кровообращения по геморрагическому типу;

- психомоторное возбуждение на момент назначения препарата;

- период беременности;

- период кормления грудью.

Передозировка.

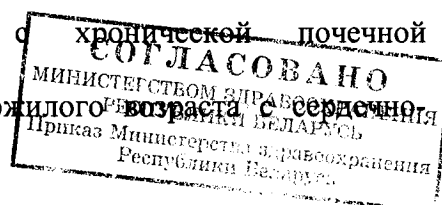
Симптомы: усиление проявлений побочного действия препарата.

В таких случаях прекращают применение препарата и назначают симптоматическое лечение.

Особенности применения.

С осторожностью препарат назначают больным с хронической почечной недостаточностью.

С осторожностью следует применять препарат лицам пожилого возраста с сердечно-



сосудистой патологией в связи с тем, что описанные выше побочные реакции у данной группы больных отмечаются чаще.

В связи с влиянием пирацетама на агрегацию тромбоцитов следует соблюдать осторожность при назначении лекарственного средства пациентам с нарушениями гемостаза, хирургическим вмешательством (в том числе стоматологическим), факторами риска развития кровотечений (например, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки), перенесенным ранее геморрагическим инсультом или внутримозговым кровоизлиянием, пациентам, принимающим антикоагулянты или антиагреганты, в том числе низкие дозы ацетилсалициловой кислоты.

При назначении лекарственного средства пациентам пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль за показателями функции почек.

Применение у детей.

Лекарственное средство противопоказано для применения у детей до 18 лет в связи с отсутствием достаточных данных.

Применение в период беременности и кормления грудью.

Безопасность применения лекарственного средства во время беременности и лактации не установлена. В связи с отсутствием данных применять во время беременности и лактации противопоказано.

Пирацетам проникает через плацентарный барьер. Концентрация пирацетама у новорожденных достигает 70-90 % от концентрации его в крови у матери. Пирацетам выделяется с грудным молоком.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. Не рекомендовано применение лекарственного средства при вождении автотранспорта и работе с механизмами, требующими повышенного внимания, в связи с риском развития возможных нежелательных реакций со стороны нервной системы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами.

Тиоцетам нельзя назначать с препаратами, имеющими кислую рН.

За счет наличия в составе пирацетама возможны следующие виды взаимодействия:

Тиреоидные гормоны. При комбинации с тиреоидными гормонами возможна повышенная раздражительность, дезориентация и нарушение сна.

Аценокумарол. У больных с тяжелым течением рецидивирующего тромбоза применение пирацетама в высоких дозах (9,6 г/сутки) не влияло на дозировку аценокумарола для достижения значения протромбинового времени 2,5-3,5, но при его одновременном применении отмечалось значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллебранда (коагуляционная активность (VIII: C); ко-фактор ристоцетин (VIII: vW: Rco) и протеин в плазме крови (VIII: vW: Ag)), вязкости крови и плазмы.

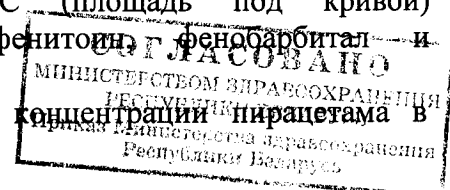
Фармакокинетические взаимодействия. Возможность изменения фармакокинетики пирацетама под воздействием других препаратов низкая, поскольку 90 % препарата выводится в неизменном виде с мочой.

В опытах *in vitro* пирацетам не угнетает цитохром P450 изоформы CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11 в концентрации 142, 426, 1422 мкг/мл. При концентрации 1422 мкг/мл отмечено незначительное угнетение CYP2A6 (21 %) и 3A4/5 (11 %). Однако уровень K_i этих двух CYP-изомеров достаточный при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, которые подвергаются биотрансформации этими ферментами, маловероятно.

Противоэпилептические средства.

Прием пирацетама в дозе 20 г/сутки на протяжении 4 недель у пациентов с эпилепсией, получавших стабильные дозы противоэпилептических препаратов, не изменял максимальную сывороточную концентрацию и AUC (площадь под кривой) противоэпилептических препаратов (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал и вальпроаты).

Совместный прием с алкоголем не влиял на уровень



сыворотке, и концентрация этанола в сыворотке крови не изменялась при приеме 1,6 г парацетама внутрь.

Условия и срок хранения. Хранить в оригинальной упаковке, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 5 лет.

НД РБ
5960 - 2017

Условия отпуска. По рецепту.

Упаковка. По 5 мл в ампуле, по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, покрытой пленкой, по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

По 10 мл в ампуле, по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Производитель.

ПАО «Галичфарм», Украина,
79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.

