

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Тиоктовая кислота

Регистрационный номер: ЛП-003918

Торговое наименование: Тиоктовая кислота

Международное непатентованное или группировочное наименование: тиоктовая кислота

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: тиоктовая кислота (α -липоевая кислота) – 30,0 мг;

Вспомогательные вещества: этилендиамин – 8,8 мг; пропиленгликоль – 93,2 мг; вода для инъекций – до 1 мл.

Описание: прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета с характерным запахом.

Фармакотерапевтическая группа: метаболическое средство.

Код АТХ: A16AX01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота - эндогенный антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого действия. В качестве кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов участвует в окислительном декарбоксилировании пировиноградной кислоты и альфа-кетокислот. Способствует снижению концентрации глюкозы в плазме крови и увеличению концентрации гликогена в печени, а также преодолению инсулинорезистентности. По характеру биохимического действия близка к витаминам группы В. Участвует в регулировании углеводного и липидного обменов, стимулирует обмен холестерина. Оказывает гепатопротекторное, гиполлипидемическое,

гипохолестеринемическое, гипогликемическое действие. Улучшает трофику нейронов. При сахарном диабете тиоктовая кислота уменьшает образование конечных продуктов гликирования, улучшает эндоневральный кровоток, повышает содержание глутатиона до физиологического значения, что в результате приводит к улучшению функционального состояния периферических нервных волокон при диабетической полинейропатии. Благодаря участию в метаболизме жиров, тиоктовая кислота увеличивает биосинтез фосфолипидов, в частности, фосфоинозитидов, восстанавливая повреждения клеточных мембран; нормализует энергетический обмен и проведение нервных импульсов. Тиоктовая кислота устраняет токсическое влияние метаболитов алкоголя (ацетальдегида, пировиноградной кислоты), уменьшает избыточное образование молекул свободных кислородных радикалов, уменьшает эндоневральную гипоксию и ишемию, ослабляя проявления полинейропатии в виде парестезии, ощущения жжения, боли и онемения конечностей.

Таким образом, тиоктовая кислота оказывает антиоксидантное, нейротрофическое действие, улучшает метаболизм липидов.

Фармакокинетика

Распределение

При внутривенном введении тиоктовой кислоты в дозе 600 мг максимальная концентрация в плазме крови через 30 мин составляет около 20 мкг/мл. Площадь под кривой «концентрация-время» составляет около 5 мкг/ч/мл. Биодоступность – 30%.

Тиоктовая кислота обладает эффектом «первого прохождения» через печень. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования. Объем распределения – около 450 мл/кг.

Метаболизм и выведение

Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками преимущественно в виде метаболитов (80-90%), в небольшом количестве – в неизмененном виде. Период полувыведения составляет 25 мин. Общий плазменный клиренс -10-15 мл/мин/кг.

Показания к применению

- диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к тиоктовой (альфа-липоевой) кислоте или к другим компонентам препарата;

- беременность, период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата);
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения препарата не установлены).

С осторожностью: внутривенное введение препарата следует проводить с осторожностью у пациентов пожилого возраста (старше 75 лет).

Применение в период беременности и грудного вскармливания

Применение тиоктовой кислоты во время беременности противопоказано в связи с отсутствием достаточного опыта применения.

Неизвестно, проникает ли тиоктовая кислота (α -липоевая кислота) в материнское молоко.

При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Для внутривенного введения.

В начале лечения препарат назначают внутривенно капельно в суточной дозе 600 мг (2 ампулы).

Перед применением содержимое 2-х ампул (20 мл) разводят в 250 мл 0,9% раствора натрия хлорида и вводят внутривенно капельно медленно, в течение не менее 30 мин.

Поскольку действующее вещество чувствительно к свету, раствор для инфузии готовят непосредственно перед применением. Приготовленный раствор необходимо защищать от воздействия света, например, с помощью алюминиевой фольги. Защищенный от света раствор может храниться примерно в течение 6 часов.

Курс лечения составляет 2-4 недели. Затем переходят на поддерживающую терапию пероральной формой препарата тиоктовой кислоты в дозе 600 мг в сутки.

Продолжительность курса лечения и необходимость его повторения определяется врачом.

Побочное действие

Возможные побочные эффекты при применении препарата приведены ниже по нисходящей частоте возникновения: *часто* ($\geq 1/100$ до $<1/10$); *нечасто* ($\geq 1/1000$ до $<1/100$); *редко* ($\geq 1/10000$ до $<1/1000$); *очень редко* ($<1/10000$), включая отдельные сообщения. Корреляции частоты возникновения побочных эффектов с полом или возрастом пациентов не наблюдается.

Нарушения со стороны системы кроветворения и лимфатической системы: очень редко – петехиальные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу; геморрагическая сыпь (пурпура), тромбоцитопатия, гипокоагуляция.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко - аллергические реакции (кожная сыпь, экзема, крапивница, кожный зуд); *частота неизвестна* - анафилактический шок; аутоиммунный инсулиновый синдром у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: очень редко – гипогликемия (из-за ухудшения усвоения глюкозы), симптомы которой включают головокружение, повышенное потоотделение, головную боль и нарушение зрения.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко - изменение или нарушение вкусовых ощущений, «приливы», судороги.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота, рвота; *очень редко* – боль в животе, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко – повышение активности «печеночных» ферментов.

Нарушения со стороны сердца: частота неизвестна – боль в области сердца, тахикардия при быстром введении препарата.

Нарушения со стороны сосудов: очень редко – тромбофлебит.

Нарушения со стороны органа зрения: очень редко – диплопия, нечеткость зрения.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: очень редко - чувство жжения в месте введения, *частота неизвестна* – аллергические реакции в месте введения – раздражение, гиперемия или припухлость.

Прочие: очень редко - при быстром внутривенном введении наблюдались самостоятельно проходящие повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове) и затруднение дыхания, слабость.

Передозировка

Симптомы: головная боль, тошнота, рвота.

В тяжелых случаях (при применении тиоктовой кислоты в дозе 10-40 г): психомоторное возбуждение или нарушение сознания, генерализованные судороги, выраженное нарушение кислотно-щелочного равновесия с лактоацидозом, гипогликемия (вплоть до развития комы), острый некроз скелетных мышц, ДВС-синдром, гемолиз, супрессия костного мозга, полиорганная недостаточность.

Лечение: при подозрении на передозировку тиоктовой кислотой рекомендуется экстренная госпитализация. Терапия симптоматическая. Лечение генерализованных судорог, лактоацидоза и других угрожающих жизни последствий передозировки должно проводиться в соответствии с принципами современной интенсивной терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ, гемоперфузия или методы фильтрации с принудительным выведением тиоктовой кислоты не эффективны.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

В связи с тем, что тиоктовая кислота способна образовывать хелатные комплексы с металлами, следует избегать совместного назначения с препаратами железа, магния, кальция

Одновременное применение тиоктовой кислоты с цисплатином снижает эффективность последнего.

С молекулами сахаров тиоктовая кислота образует плохо растворимые комплексные соединения. Тиоктовая кислота несовместима с растворами декстрозы (глюкозы), фруктозы, Рингера, а также с растворами, реагирующими с дисульфидными или SH-группами.

Тиоктовая кислота усиливает гипогликемическое действие инсулина и гипогликемических препаратов для перорального применения при совместном применении.

Тиоктовая кислота усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидов.

Этанол и его метаболиты снижает терапевтическую эффективность тиоктовой кислоты.

Особые указания

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в плазме крови, особенно на начальной стадии терапии препаратом Тиоктовая кислота. В некоторых случаях может возникнуть необходимость уменьшения дозы инсулина или гипогликемических препаратов для перорального применения во избежание развития гипогликемии. При возникновении симптомов гипогликемии (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройство зрения, тошнота) следует немедленно прекратить введение препарата. При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности. При появлении симптомов, таких как зуд, недомогание, лечение препаратом Тиоктовая кислота следует немедленно прекратить.

Прием алкоголя снижает эффективность лечения препаратом, поэтому пациентам в период терапии препаратом Тиоктовая кислота следует воздержаться от употребления

алкоголя в течение всего курса лечения, а также, по возможности, в перерывах между курсами. Употребление алкоголя во время лечения тиоктовой кислотой также является фактором риска развития и прогрессирования нейропатии.

Приготовленный раствор препарата следует защищать от воздействия света.

Описано несколько случаев развития аутоиммунного инсулинового синдрома у пациентов с сахарным диабетом на фоне лечения тиоктовой кислотой, который характеризовался частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину. Возможность развития аутоиммунного инсулинового синдрома определяется наличием у пациентов гаплотипов HLA-DRB1*0406 и HLA-DRB1*0403.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Влияние препарата на способность к вождению транспортных средств и управлению механизмами специально не изучалось, поэтому в период лечения препаратом Тиоктовая кислота следует соблюдать осторожность при вождении транспортных средств и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Концентрат для приготовления раствора для инфузий 30 мг/мл.

По 10 мл препарата в ампулы светозащитного нейтрального стекла тип I с цветной точкой и насечкой или с цветным кольцом излома.

На ампулы дополнительно может наноситься одно цветное кольцо.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения: ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Производитель: ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru