

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тиоктовая кислота-Бинергия

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тиоктовая кислота-Бинергия

Международное непатентованное или группировочное наименование: Тиоктовая кислота

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий

Состав

1 мл концентрата содержит:

действующее вещество:

меглюмина тиоктат* – 58,4 мг

(в пересчете на тиоктовую кислоту) – 30,0 мг

вспомогательные вещества:

макрогол-400 – 200,0 мг

меглюмин – от 1,1 до 2,9 мг (до pH 8,2–8,5)

вода для инъекций – до 1 мл

Примечание

* Меглюмина тиоктат образуется в результате взаимодействия 30,0 мг тиоктовой кислоты (альфа-липоевой кислоты) и 28,40 мг меглюмина.

Описание

Прозрачный раствор желтого или зеленовато-желтого цвета

Фармакотерапевтическая группа

Другие средства для лечения заболеваний желудочно-кишечного тракта и нарушения обмена веществ.

Код АТХ: A16AX01

Фармакологические свойства**Фармакодинамика**

Тиоктовая кислота (α-липоевая кислота) – эндогенный антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого (способствует восстановлению внутриклеточного уровня глутатиона и повышению активности супероксиддисмутазы) действия. В качестве

кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов участвует в окислительном декарбоксилировании пировиноградной кислоты и α -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. Оказывает гепатопротекторное, гиполипидемическое, 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 липидный и углеводный обмен.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

При внутривенном введении тиоктовой кислоты в дозе 600 мг максимальная концентрация в плазме крови через 30 минут составляет около 20 мкг/мл, площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) около 5 мкг/ч/мл.

Объем распределения – около 450 мл/кг. Биодоступность – 30 %. Тиоктовая кислота обладает эффектом «первого прохождения» через печень.

Метаболизм и выведение

Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования. Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками преимущественно в виде метаболитов (80–90 %), в небольшом количестве – в неизменном виде. Период полувыведения ($T_{1/2}$) около 25 минут. Общий плазменный клиренс составляет 10–15 мл/мин/кг.

Показания к применению

- диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

- гиперчувствительность к тиоктовой кислоте или 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 при беременности и в период грудного вскармливания

Применение при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано в связи с отсутствием достаточного опыта применения.

Неизвестно, проникает ли тиоктовая кислота в материнское молоко. При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутривенно капельно.

В начале лечения препарат назначают в суточной дозе 600 мг.

1 ампула препарата объемом 10 (20) мл содержит 300 (600) мг тиоктовой кислоты.

Перед применением препарат разводят в 0,9 % растворе натрия хлорида: 10 мл препарата разводят в 125 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 20 мл препарата разводят в 250 мл 0,9 % раствора натрия хлорида.

Вводят внутривенно капельно, медленно, со скоростью не более 2 мл/мин.

Препарат обладает светочувствительностью, в связи с чем раствор для инфузий готовят непосредственно перед применением.

Во время проведения инфузии флакон с раствором защищают от света. Приготовленный раствор следует хранить в защищенном от света месте и использовать в течение 6 часов после приготовления.

Курс терапии составляет 2–4 недели. Далее следует перейти на поддерживающую терапию – прием тиоктовой кислоты в форме таблеток в суточной дозе 600 мг. Продолжительность курса лечения и необходимость его повторения определяется специалистом.

Побочное действие

Частота нежелательных реакций была определена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нежелательные реакции представлены в соответствии с системно-органной классификацией в порядке уменьшения значимости.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: точечные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу, тромбоцитопения, геморрагическая сыпь (пурпура), тромбозы.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: системные аллергические реакции (вплоть до развития анафилактического шока); аутоиммунный инсулиновый синдром (АИС) у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину.

Нарушения со стороны нервной системы

Очень редко: изменение или нарушение вкусовых ощущений, судороги.

Нарушения со стороны органа зрения

Очень редко: диплопия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: аллергические реакции – крапивница, зуд, экзема, сыпь.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Очень редко: аллергические реакции в месте введения – раздражение, гиперемия или припухлость; в случае быстрого введения препарата возможно повышение внутричерепного давления (возникает чувство тяжести в голове), затруднение дыхания.

Данные реакции проходят самостоятельно.

Частота неизвестна: в связи с улучшением усвоения глюкозы возможно снижение концентрации глюкозы в крови. При этом могут возникнуть симптомы гипогликемии – головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения.

Передозировка

Симптомы

Головная боль, тошнота, рвота.

В тяжелых случаях (при применении тиоктовой кислоты в дозе 10–40 г): психомоторное возбуждение или помутнение сознания, генерализованные судороги, выраженное нарушение кислотно-щелочного состояния с лактоацидозом, гипогликемия (вплоть до развития комы), острый некроз скелетных мышц, синдром диссеминированного внутрисосудистого

свертывания (ДВС-синдром), гемолиз, подавление деятельности костного мозга, полиорганная недостаточность.

Лечение

При подозрении на передозировку тиоктовой кислотой (например, введение более 80 мг на 1 кг массы тела) рекомендуется экстренная госпитализация и немедленное принятие мер в соответствии с общими принципами, принятыми при случайном отравлении. Терапия симптоматическая. Лечение генерализованных судорог, лактоацидоза и других угрожающих жизни последствий 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

Тиоктовая кислота снижает эффективность цисплатина при одновременном применении, а также вступает в реакцию с металлсодержащими препаратами, такими как препараты железа, магния.

Тиоктовая кислота вступает в реакцию с молекулами сахаров, образуя труднорастворимые комплексы, например, с раствором левулозы (фруктозы).

Усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидных средств.

Инфузионный раствор тиоктовой кислоты несовместим с раствором декстрозы, раствором Рингера и с растворами, реагирующими с дисульфидными и SH- группами. Одновременное применение цисплатина с тиоктовой кислотой приводит к снижению эффективности цисплатина.

При одновременном применении тиоктовой кислоты и инсулина или пероральных гипогликемических препаратов их действие может усиливаться.

Во время проведения терапии тиоктовой кислотой, особенно на начальном этапе, необходимо тщательно следить за уровнем сахара в крови. В отдельных случаях во избежание гипогликемии необходимо снизить дозу инсулина или дозу пероральных гипогликемических препаратов.

Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

Особые указания

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в крови, особенно на начальной стадии терапии. В некоторых случаях необходимо уменьшить дозу инсулина или перорального гипогликемического препарата, чтобы избежать развития гипогликемии. При возникновении симптомов гипогликемии (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения,

тошнота) следует немедленно прекратить терапию. При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности вплоть до развития анафилактического шока. В единичных случаях при применении препарата Тиоктовая кислота-Бинергия у пациентов с отсутствием гликемического контроля и в тяжелом общем состоянии могут развиваться серьезные анафилактические реакции.

Во время лечения тиоктовой кислотой были зарегистрированы случаи аутоиммунного инсулинового синдрома (АИС). Пациенты с человеческим лейкоцитарным антигеном, таким как HLA-DRB1*04:06 и HLA-DRB1*04:03 аллели, более предрасположены к развитию аутоиммунного инсулинового синдрома (АИС) при лечении тиоктовой кислотой.

Аллель HLA-DRB1*04:03 (отношение шансов восприимчивости к аутоиммунному инсулиновому синдрому (АИС): 1,6) особенно часто встречается у европеоидов, причем в южной Европе он распространен больше, чем в северной, а аллель HLA-DRB1*04:06 (отношение шансов восприимчивости к аутоиммунному инсулиновому синдрому (АИС): 56,6) особенно часто встречается у японских и корейских пациентов.

Аутоиммунный инсулиновый синдром (АИС) следует рассматривать в дифференциальной диагностике спонтанной гипогликемии у пациентов, принимающих альфа-липоевую кислоту (см. раздел «Побочное действие»).

Употребление алкоголя в период терапии препаратом Тиоктовая кислота-Бинергия снижает эффективность препарата и является фактором риска, способствующим развитию и прогрессированию нейропатии. Пациентам, применяющим препарат Тиоктовая кислота-Бинергия, следует воздержаться от употребления алкоголя.

У пациентов с нарушением функции печени необходимо применять препарат Тиоктовая кислота-Бинергия с осторожностью.

Вспомогательные вещества

Препарат Тиоктовая кислота-Бинергия содержит пропиленгликоль, который может вызывать симптомы, схожие с приемом алкоголя.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Влияние применения тиоктовой кислоты на способность управлять транспортными средствами и механизмами не изучалось. Учитывая возможные нежелательные реакции (головкружение и развитие симптомов гипогликемии), необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами, а также занятии 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 или 20 мл препарата в ампулы из светозащитного стекла 1-го гидролитического класса с цветной точкой излома и насечкой или цветным кольцом излома.

По 5 ампул помещают в контурную пластиковую упаковку (поддон) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 или 2 контурные пластиковые упаковки (поддона) с ампулами вместе с инструкцией по применению помещают в пачку или коробку из картона.

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 / Организация, принимающая претензии потребителей:

АО «Бинергия»

Россия, 143930, Московская область, г.о. Балашиха, г. Балашиха, мкр. Салтыковка,
ш. Разинское, д. 69, эт. /помещ. 1/41, офис 106А.

Тел.: 8-495-580-55-02

Факс: 8-495-580-55-03

Производитель и адрес места производства:

ФКП «Армавирская биофабрика»

352212, Краснодарский край, Новокубанский район, п. Прогресс, ул. Мечникова, д. 11.