

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 25 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 30 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: тиоктовая кислота.

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 25 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

Каждый мл концентрата для приготовления раствора для инфузий содержит 25 мг тиоктовой кислоты в виде трометамоловой соли тиоктовой кислоты – 39,7 мг.

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 30 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

Каждый мл концентрата для приготовления раствора для инфузий содержит 30 мг тиоктовой кислоты в виде трометамоловой соли тиоктовой кислоты – 47,6 мг.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Прозрачный или слегка опалесцирующий раствор желтого или зеленовато-желтого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА показан к применению у взрослых для лечения:

- диабетической полинейропатии;
- алкогольной полинейропатии.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

В начале лечения препарат назначают в суточной дозе 600 мг.

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.

Дети

Безопасность и эффективность препарата ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Курс лечения составляет 2–4 недели.

Препарат предназначен для внутривенного капельного введения.

Инструкцию по приготовлению лекарственного препарата перед применением см. в разделе 6.6.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к тиоктовой кислоте или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1
- Беременность, период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата)
- Детский возраст до 18 лет (см. раздел 4.2 «Режим дозирования и способ применения»)

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в плазме крови, особенно на начальной стадии терапии препаратом. 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 следует немедленно прекратить.

Прием алкоголя снижает эффективность лечения препаратом, поэтому пациентам в период терапии 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.

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.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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 усиливает гипогликемическое действие инсулина и гипогликемических препаратов для перорального применения при одновременном применении.

Тиоктовая кислота усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидов. Этанол и его метаболиты снижают терапевтическую эффективность тиоктовой кислоты.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

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

Лактация

Данные о проникновении тиоктовой кислоты в грудное молоко человека отсутствуют. Применение тиоктовой кислоты в период грудного вскармливания противопоказано.

Фертильность

Исследования на животных не показали влияния препарата на фертильность. Данные касательно влияния тиоктовой кислоты на фертильность у человека отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследований по изучению влияния тиоктовой кислоты на способность управлять транспортными средствами или работать с механизмами не проводилось. Следует принимать во внимание потенциальную возможность развития таких нежелательных реакций (НР), как головокружение и симптомы гипогликемии. Учитывая возможность развития НР, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами, а также при занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Нежелательные реакции классифицированы согласно классификации Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\,000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1\,000$), очень редко ($< 1/10\,000$) и частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных). Корреляции частоты возникновения нежелательных реакций с полом или пожилым возрастом пациентов не наблюдается.

Табличное резюме нежелательных реакций

Очень часто	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы</i>					
				петехиальные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу	
				геморрагическая сыпь (пурпура)	
				тромбоцитопатия	
				гипокоагуляция	
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>					
				аллергические реакции (кожная сыпь, экзема, крапивница, кожный зуд)	анафилактический шок

Очень часто	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота
					неизвестна
					аутоиммунный инсулиновый синдром у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину
<i>Нарушения метаболизма и питания</i>					
				гипогликемия (из-за улучшения усвоения глюкозы), симптомы которой включают головокружение, повышенное потоотделение, головную боль и нарушение зрения	
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>					
				изменение или нарушение вкусовых ощущений	
				«приливы»	
				судороги	
<i>Нарушения со стороны органа зрения</i>					
				диплопия	
				нечеткость зрения	
<i>Нарушения со стороны сердца</i>					
					боль в области сердца
					тахикардия при быстром

Очень часто	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота
					неизвестна
					введении препарата
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>					
				тромбофлебит	
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>					
	тошно- та			боль в животе	
	рвота			диарея	
<i>Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей</i>					
				повышение активности «печеночных» ферментов	
<i>Общие нарушения и реакции в месте введения</i>					
				чувство жжения в месте введения	аллергические реакции в месте введения (раздражение, гиперемия или припухлость)

Описание отдельных нежелательных реакций

Очень редко – при быстром внутривенном введении наблюдались самостоятельно проходящие повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове) и затруднение дыхания, слабость.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга отношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщений о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза:

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (РОСЗДРАВНАДЗОР)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1

Телефон: +7 (499) 578-02-63

Многоканальный телефон: +7 (499) 578-06-70

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Адрес в интернете: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. 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, синдром диссеминированного внутрисосудистого свертывания (ДВС-синдром), гемолиз, супрессия 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 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний желудочно-кишечного тракта и нарушений обмена веществ

Код АТХ: A16AX01

Механизм действия

Тиоктовая (альфа-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 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.

Фармакодинамические эффекты

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 метаболизм липидов.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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 %.

Распределение

Объем распределения – около 450 мл/кг.

Биотрансформация

Тиоктовая кислота обладает эффектом «первого прохождения» через печень. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования.

Элиминация

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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Трометамол

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Тиоктовая кислота несовместима с растворами декстрозы (глюкозы), фруктозы, Рингера, а также с растворами, реагирующими с дисульфидными или SH-группами.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

Приготовленный раствор

После разведения концентрата раствор хранить при температуре ниже 25 °С в течение 6 часов в защищенном от света месте.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре ниже 25 °С.

Хранить в оригинальной упаковке (пачке).

Не замораживать.

Условия хранения после приготовления раствора лекарственного препарата см. в разделе 6.3.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 25 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

По 12 мл препарата в ампулы темного стекла 1-го гидролитического класса.

По 12 мл, 24 мл препарата во флаконы темного стекла 1-го гидролитического класса, герметично укупоренные резиновыми пробками, обжатые колпачками алюминиевыми или комбинированными.

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

По 1, 2, 4 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

По 5, 10 флаконов вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА, 30 мг/мл, концентрат для приготовления раствора для инфузий

По 10 мл, 20 мл препарата в ампулы темного стекла 1-го гидролитического класса или во флаконы темного стекла 1-го гидролитического класса, герметично укупоренные резиновыми пробками, обжатые колпачками алюминиевыми или комбинированными.

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

По 1, 2 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

По 5, 10 флаконов вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Инструкция по приготовлению лекарственного препарата перед применением

Растворителем для препарата может быть только 0,9 % раствор натрия хлорида.

Перед применением содержимое 1–2 ампул/флаконов (10–24 мл препарата) разводят в 250 мл 0,9 % раствора натрия хлорида и вводят внутривенно капельно, медленно, со скоростью не более 2 мл/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. После разведения концентрата раствор хранить при температуре ниже 25 °С в течение 6 часов в защищенном от света месте.

Утилизация

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Российская Федерация

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Тел.: +7 (495) 640-25-28

E-mail: reception@promo-med.ru

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Тел.: +7(495) 640-25-28

E-mail: reception@promo-med.ru

Круглосуточный телефон горячей линии фармаконадзора:

8-800-777-86-04 (бесплатно)

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата ТИОКТОВАЯ КИСЛОТА доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» [http ://eec.eaeunion.org/](http://eec.eaeunion.org/)