

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**

Метаболическое средство

**Код АТХ:** A16AX01

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Тиоктовая кислота ( $\alpha$ -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  $\alpha$ -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**

- повышенная чувствительность 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 20 мл препарата разводят в 250 мл 0,9 % раствора натрия хлорида и 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 развития нежелательных явлений представлена в соответствии с классификацией, рекомендованной Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$  и  $< 1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$  и  $< 1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$  и  $< 1/1000$ ), очень редко

(< 1/10000), включая отдельные сообщения, частота неизвестна (частота не может быть определена на основе имеющихся данных).

Корреляции частоты возникновения побочных эффектов с полом или возрастом пациентов не наблюдается.

<b>Системно-органный класс, заболевания</b>	<b>Частота развития</b>	<b>Нежелательные явления</b>
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы</i>	Очень редко	Точечные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу; тромбоцитопатия, геморрагическая сыпь (пурпура), гипокоагуляция
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>	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
<i>Нарушения со стороны обмена веществ и питания</i>	Очень редко	Гипогликемия (в связи с улучшением утилизации глюкозы), симптомы которой включают головокружение, головную боль, повышенное потоотделение и нарушение зрения)
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	Очень редко	Изменение или нарушение вкусовых ощущений, «приливы», судороги
<i>Нарушения со стороны органа зрения</i>	Очень редко	Диплопия, нечеткость зрения
<i>Нарушения со стороны сердца</i>	Частота неизвестна	Боль в области сердца, тахикардия при быстром введении препарата
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>	Очень редко	Тромбофлебит
	Часто	Тошнота, рвота
<i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта</i>	Очень редко	Боль в животе, диарея
<i>Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей</i>	Очень редко	Повышение активности «печеночных» ферментов
<i>Общие расстройства и нарушения в месте введения</i>	Очень редко	Чувство жжения в месте введения
	Частота неизвестна	Аллергические реакции в месте введения – раздражение, гиперемия или припухлость
<i>Прочие</i>	Очень редко	При быстром внутривенном введении наблюдалось самопроизвольно проходящее повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове), затруднение дыхания и слабость

## **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**

Поскольку тиоктовая кислота способна образовывать хелатные комплексы с металлами, следует избегать совместного назначения с препаратами, содержащими металлы (например, препаратами железа, магния, кальция).

Одновременное применение тиоктовой кислоты с цисплатином снижает эффективность цисплатина.

При одновременном применении с инсулином или пероральными гипогликемическими препаратами наблюдается усиление гипогликемического эффекта.

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.

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

Усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидов.

Этанол и его метаболиты снижают терапевтическую эффективность тиоктовой кислоты.

## **Особые указания**

У пациентов с сахарным диабетом, особенно в начале лечения, необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в крови. В отдельных случаях требуется снижение дозы

инсулина или перорального гипогликемического препарата, чтобы избежать развития гипогликемии. При развитии симптомов гипогликемии (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройство зрения, тошнота) следует немедленно прекратить введение препарата.

При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности. При появлении таких симптомов как зуд, недомогание, лечение препаратом следует немедленно прекратить.

Прием алкоголя снижает эффективность применения тиоктовой кислоты, поэтому пациентам следует воздерживаться от употребления алкоголя в течение всего курса терапии препаратом, 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, механизмами**

Влияние применения тиоктовой кислоты на способность управлять транспортными средствами и механизмами не изучалось. Учитывая возможные нежелательные реакции (головокружение 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.

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 и ножом ампульным или скарификатором ампульным помещают в пачку или коробку из картона.

При использовании ампул с цветной точкой излома и насечкой или цветным кольцом излома нож ампульный или скарификатор ампульный не вкладывают.

**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.

**Владелец регистрационного удостоверения / Организация, принимающая претензии потребителей:**

ЗАО «Бинергия»

Россия, 143910, Московская область, г. Балашиха, ул. Крупешина, д. 1.

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.

Медицинский директор  
ЗАО «Бинергия»



Ханина Н.Ю.

МИНЗДРАВ РОССИИ  
ЛП - 006873-250321  
СОГЛАСОВАНО



), Прошито, пронумеровано и скреплен  
печатью \_\_\_\_\_ листа(ов)

«08» \_\_\_\_\_ 2021 года  
/Ханина Н.Ю.

02