

Состав

действующее вещество: thioctic acid (тиоктовая кислота) 1 ампула препарата инъекций. 600 (24 мл) содержит 755 мг этилендиаминового соли кислоты тиоктовой (эквивалентно 600 мг кислоты тиоктовой)

вспомогательные вещества: вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная раствор зеленовато-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, влияющие на пищеварительную систему и метаболические процессы.
Кислота тиоктовой.

Код АТХ А16А Х01.

Фармакодинамика

Тиоктовая кислота - это вещество, которое образуется в организме и выполняет функцию кофермента при окислительном декарбоксилировании α-кетокислот. Вызванная сахарным диабетом гипергликемия приводит к отложению глюкозы на матричных протеинах кровеносных сосудов и образованию конечных продуктов прогрессирующего гликозилирования. Этот процесс приводит к уменьшению эндоневрального кровотока и эндоневральной гипоксии / ишемии, связанного с повышенным образованием свободных кислородных радикалов, которые повреждают нерв, а также к обеднению в периферических нервах такого антиоксиданта как глутатион. В 1995 году было проведено многоцентровое плацебоконтролируемое исследование, направленное на изучение эффективности применения тиоктовой кислоты для симптоматического лечения диабетической полинейропатии, в котором были получены данные о благоприятных эффектах тиоктовой кислоты на такие испытываемые симптомы, как парестезии, жжение, онемение и боль.

Фармакокинетика

Тиоктовая кислота имеет высокий эффект первого прохождения в печени. Существуют существенные межличностные различия в системной доступности тиоктовой кислоты. Метаболизм тиоктовой кислоты происходит путем окисления боковых звеньев и слияния. Вывод осуществляется преимущественно почками.

У людей период полувыведения в плазме крови составляет около 25 минут, суммарный клиренс для плазмы составляет 10-15 мл / хв.кг. На момент завершения 30-минутной инфузии 600 мг определенный уровень в плазме составляет около 20 мкг / мл. Путем радиоактивной маркировки в ходе исследований на животных (крысы, собаки) было выявлено преимущественное выделение 80-90% препарата в виде метаболитов. Также у людей наблюдается только небольшое количество неизмененного вещества, что выводится с мочой. Метаболизм происходит главным образом путем окислительного сокращения боковых звеньев (бета-оксидация) и / или S-метилирования тиоловых групп.

Показания

Лечение диабетической полинейропатии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к тиоктовой кислоте или к одному из других компонентов препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Тиоктовая кислота реагирует с ионными комплексами металлов (например, цисплатином), поэтому препарат может снижать эффект цисплатина.

С молекулами сахара (например, раствором левулозы) тиоктовая кислота образует труднорастворимые комплексные соединения.

Тиоктовая кислота является хелатор металла, поэтому ее нельзя применять вместе с металлами (например, препараты железа, магния).

Тиоктовая кислота может усиливать сахароснижающую действие инсулина и пероральных противодиабетических средств, повышая чувствительность периферических тканей к этим препаратам, в связи с чем может возникнуть необходимость коррекции дозы инсулина или пероральных противодиабетических средств. По этой причине необходимо проводить тщательный контроль сахара в крови, в частности на начальном этапе терапии.

Примечание

Регулярное употребление алкоголя является существенным фактором риска для развития и прогрессирования невропатических синдромов и, таким образом, может влиять на успех лечения с применением Эспа-липона®. Поэтому, как правило, пациентам с диабетической полинейропатии рекомендуется избегать употребления алкоголя. Это касается также интервалов, когда терапия не проводится.

Особенности применения

Основным принципом терапии диабетической полинейропатии является оптимальный контроль диабета. При лечении больных сахарным диабетом необходим частый контроль гликемии. В некоторых случаях необходимо скорректировать дозы гипогликемических средств для предотвращения гипогликемии.

Во время лечения полинейропатии, благодаря регенерационные процессы, возможно кратковременное усиление чувствительности, сопровождается парестезии с ощущением «ползания мурашек».

Постоянное употребление алкоголя является фактором риска полинейропатии и может уменьшить эффективность препарата. Поэтому рекомендуется воздержаться от употребления алкоголя во время лечения. Не следует назначать препарат одновременно с препаратами, содержащими металлы (препараты железа, магния, кальция), а также с молочными продуктами, содержащими кальций.

Препарат светочувствительным, поэтому флаконы следует доставать из упаковки только непосредственно перед применением.

Приготовленный для инфузий раствор необходимо защищать от солнечного света, прикрывая его светозащитными пакетами. В этих условиях он остается пригодным максимум 6 часов.

Определенными ограничениями введения препаратов тиоктовой кислоты является пожилой возраст (более 75 лет).

В связи с парентеральным применением Эспа-липона® наблюдались реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактический шок (см. Раздел «Побочные реакции»). Необходима соответствующая проверка пациентов. В случае возникновения ранних симптомов (например, зуда, тошноты, дискомфорта и др.) Терапию срочно прекращают; возможно возникновение

необходимости дополнительных терапевтических мероприятий.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Во время лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Применение в период беременности или кормления грудью

Применение тиоктовой кислоты в период беременности не рекомендуется из-за отсутствия соответствующих клинических данных.

Данных о проникновении тиоктовой кислоты в грудное молоко нет, поэтому применять ее в период кормления грудью не рекомендуется.

Способ применения и дозы

Взрослым применяют 1 раз в сутки 12-24 мл в 250 мл 0,9% раствора натрия хлорида (эквивалентно 300 мг или 600 мг тиоктовой кислоты в сутки).

Раствор вводить в виде инфузии; применяют в течение 2-4 недель в начальной стадии лечения.

Как дальнейшее продолжение терапии можно применять Эспа-липон® 600 (в форме таблеток).

Правила проведения инфузии

Для приготовления инфузионного раствора следует применять только 0,9% раствор натрия хлорида. Препарат вводить внутривенно капельно в течение не менее 30 минут, перед этим ампулу препарата Эспа-липон® разводят в 250 мл 0,9% раствора натрия хлорида. Препарат является чувствительным к действию солнечного света, поэтому готовить раствор следует непосредственно перед началом ввода и защищать приготовленный флакон светозащитным колпачком. Защищенный от света раствор для инфузий может храниться в течение около 6 часов.

Дети

Поскольку данные о безопасности и эффективности применения детям тиоктовой кислоты отсутствуют, препарат не рекомендуется назначать этой возрастной категории пациентов.

Передозировка

При передозировке возможны тошнота, рвота, головная боль. При передозировке или подозрении на развитие побочных эффектов необходимо немедленно прекратить инъекцию и, не вынимая инъекционной иглы, медленно ввести 0,9% раствора натрия хлорида.

Лечение. При остром отравлении тиоктовой кислоты показана немедленная госпитализация с проведением общетерапевтических мероприятий детоксикации организма (искусственное дыхание, рвота, промывание желудка, активированный уголь и т.п.). Для лечения генерализованных судорог, лактат-ацидоза и других последствий интоксикации необходимо руководствоваться средствами современной интенсивной терапии и симптоматического подхода для ускорения выведения кислоты тиоктовой. **ОСОБЫЕ.**

Побочные реакции

Со стороны пищеварительного тракта: в отдельных случаях при быстрой внутривенной инъекции наблюдаются тошнота, рвота, которые проходят самостоятельно.

Со стороны нервной системы: изменение или нарушение вкусовых ощущений; при быстрой внутривенной инъекции возможны ощущения тяжести в голове, повышение внутричерепного давления, приливы, повышенная потливость, затрудненное дыхание. В некоторых случаях после введения наблюдались головная боль, головокружение, судороги, диплопия, нарушения зрения. В большинстве случаев все указанные проявления проходят самостоятельно.

Со стороны крови: в некоторых случаях после введения наблюдались петехиальные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу, тромбоцитопатия, нарушение функции тромбоцитов, гипокоагуляция, геморрагические высыпания (пурпура), тромбозы.

Метаболические нарушения: возможна гипогликемия (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения) вследствие улучшения утилизации глюкозы.

Со стороны иммунной системы: недомогание; в месте инъекции возможно возникновение аллергических реакций (крапивница, экзема, петехиальные

высыпания, зуд, дерматиты, сыпь) вплоть до развития анафилактического шока.

Местные реакции: у пациентов с повышенной чувствительностью к тиоктовой кислоты в месте инъекции возможно возникновение ощущение жгучей боли, которое проходит само собой или при снижении скорости введения препарата.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: боль в области сердца, тахикардия.

После введения в отдельных случаях точечные кровоизлияния в слизистые оболочки и кожу, тромбопатии. В результате улучшения усвоения глюкозы в отдельных случаях может снижаться уровень сахара в крови.

После быстрого введения часто имеют место чувство стеснения в груди.

Срок годности

3 года.

Срок годности после растворения в физиологическом солевом растворе в условиях защиты от света составляет 6:00.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° C в оригинальной упаковке для защиты от света.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость

Тиоктовая кислота *in vitro* реагирует с комплексами ионов металлов (например, с цисплатином).

Тиоктовая кислота образует комплексные соединения с молекулами сахаров (например, раствор левулозы), которые плохо растворяются.

Инъекционный раствор тиоктовой кислоты несовместим с раствором глюкозы, раствором Рингера, а также с растворами, о которых известно, что они вступают в реакцию с группами SH или дисульфидными мостиками.

Как раствор-носитель для применения инфузий Эспа-липон® должен применяться только 0,9% раствор натрия хлорида.

Упаковка

По 24 мл в ампуле из коричневого стекла; по 5 ампул в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Еспарма ГмбХ, Германия.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Валленродер штр. 8-14, 13435 Берлин, Германия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).