

# ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

## ТІОКТАЦИД® 600 HR (ТНІОСТАЦИД® 600 HR)

### **Склад:**

*діюча речовина:* thioctic acid (тіоктова ( $\alpha$ -ліпоєва) кислота);

1 таблетка, вкрита оболонкою, містить 600 мг тіоктової ( $\alpha$ -ліпоєвої) кислоти;

*допоміжні речовини:* гідроксипропілцелюлоза низькозаміщена, гідроксипропілцелюлоза, магнію стеарат, гіпромелоза, макрогол 6000, титану діоксид (E 171), тальк, хіноліновий жовтий (E 104), індигокармін (E 132).

**Лікарська форма.** Таблетки, вкриті оболонкою.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби, що впливають на травну систему і метаболічні процеси. Кислота тіоктова. Код АТСА16А Х01.

### **Клінічні характеристики.**

**Показання.** Лікування симптомів периферичної (сенсомоторної) діабетичної полінейропатії.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до тіоктової кислоти та до інших компонентів препарату.

**Спосіб застосування та дози.** Дорослим призначають по 1 таблетці Тіоктациду® 600 HR (що еквівалентно 600 мг  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти) один раз на добу приблизно за півгодини до першого прийому їжі. Препарат приймають натще, не розжовуючи і запиваючи достатньою кількістю води. Прийом препарату під час їжі може знизити всмоктування  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти, тому рекомендується приймати всю денну дозу за півгодини до сніданку.

Термін лікування визначає лікар індивідуально.

### **Побічні реакції.**

*З боку травного тракту:* часто – нудота; у поодиноких випадках – шлунково-кишкові розлади, включаючи блювання, біль у животі та гастроінтестинальний біль, діарею.

*Алергічні реакції:* у поодиноких випадках – алергічні реакції, включаючи шкірні висипання кропив'янку (уртикарні висипання), свербіж та екзему.

*З боку центральної нервової системи:* часто – запаморочення; дуже рідко – зміна або порушення смакових відчуттів.

*Метаболічні порушення:* у поодиноких випадках – зниження рівня цукру в крові. Були повідомлення про скарги, які свідчать про гіпоглікемічні стани, а саме – запаморочення, підвищене потовиділення, головний біль та порушення зору.

*Інші:* утруднене дихання.

### **Передозування.**

При передозуванні можуть виникати нудота, блювання та головний біль. Після випадкового прийому або при спробі самогубства із пероральним застосуванням тіоктової кислоти у дозах від 10 г до 40 г у комбінації з алкоголем спостерігалися значні інтоксикації, у деяких випадках з летальним наслідком. На початковому етапі клінічна картина інтоксикації може проявлятися у психомоторному збудженні або у затьмаренні свідомості. У подальшому виникають генералізовані судоми та лактацидоз. Крім цього, при інтоксикації високими дозами тіоктової кислоти були описані гіпоглікемія, шок, гострий некроз скелетних м'язів, гемоліз, синдром дисемінованого внутрішньосудинного згортання крові, пригнічення діяльності кісткового мозку та поліорганна недостатність.

**Лікування.** При підозрі на сильну інтоксикацію препаратом рекомендується негайна госпіталізація та вжиття заходів відповідно до загальних принципів при випадковому отруєнні (наприклад викликати блювання, промити шлунок, застосувати активоване вугілля тощо). Лікування генералізованих судом, лактацидозу та інших наслідків інтоксикації, що загрожують життю, слід виконувати відповідно до принципів сучасної інтенсивної терапії; таке лікування повинно бути симптоматичним. До цього часу не підтверджена

користь від проведення гемодіалізу, гемоперфузії або застосування методів фільтрації з примусовим виведенням тіоктової кислоти.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Застосування тіоктової кислоти у період вагітності не рекомендується через відсутність відповідних клінічних даних.

Даних про проникнення тіоктової кислоти у грудне молоко немає, тому застосовувати її у період годування груддю не рекомендується.

**Діти.** Оскільки даних щодо безпеки та ефективності застосування дітям тіоктової кислоти немає, препарат не рекомендується призначати цій віковій категорії пацієнтів.

**Особливості застосування.** При застосуванні препарату може спостерігатися незвичний запах сечі, що не має клінічного значення.

На початку лікування полінейропатії через регенераційні процеси можливе короточасне посилення парестезій з відчуттям «повзання мурашок».

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.** Під час лікування необхідно дотримуватися обережності (через можливість появи таких побічних реакцій, як запаморочення та порушення зору) при керуванні автотранспортом і занятті іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.** Ефективність цисплатину знижується при одночасному застосуванні з препаратом.

*Тіоктова кислота є хелатором металу, тому її не можна застосовувати разом зі сполуками металів (препаратами заліза, магнію, з молочними продуктами, оскільки вони містять кальцій). Якщо добову дозу препарату застосовують за 30 хвилин до сніданку, то препарати, що містять залізо або магній, слід застосовувати в обід або ввечері.  $\alpha$ -ліпоєва кислота утворює важкорозчинні комплекси з молекулами цукру (наприклад розчином лавулози).*

При застосуванні Тіоктациду® 600 HR у хворих на цукровий діабет можливе підсилення цукрознижувальної дії інсуліну та пероральних протидіабетичних засобів, тому, особливо на початковій стадії лікування, рекомендується ретельний контроль рівня цукру в крові. Для уникнення симптомів гіпоглікемії в окремих випадках може знадобитися зниження дози інсуліну або пероральних протидіабетичних засобів.

#### Увага

Регулярне вживання алкоголю є суттєвим фактором ризику розвитку і прогресування клінічної картини нейропатії і може, таким чином, негативно впливати на процес лікування Тіоктацидом® 600 HR. Тому пацієнтам з діабетичною полінейропатією зазвичай рекомендується у разі можливості утриматися від вживання алкоголю. Обмеження вживання алкоголю стосується також перерв між курсами лікування.

#### **Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.**  $\alpha$ -ліпоєва кислота відіграє роль коензиму в окиснювальному декарбоксілюванні  $\alpha$ -кетокислот.

Гіперглікемія, спричинена цукровим діабетом, призводить до накопичення глюкози на матричних білках кровоносних судин і формування так званих «кінцевих продуктів надлишкового глікозилювання». Цей процес призводить до зниження ендоневрального кровотоку та ендоневральної гіпоксії/ішемії, що поєднується з підвищеною продукцією вільних радикалів кисню, які призводять до ушкодження периферичного нерва.

Дослідження на щурах показали, що  $\alpha$ -ліпоєва кислота впливає на біохімічні процеси, спричинені стрептозотоциніндукованим діабетом, що призводить до поліпшення ендоневрального кровотоку і підвищення рівня фізіологічного антиоксиданту глутатіону, а також як антиоксидант знижує кількість вільних радикалів кисню в діабетичнозміненому нерві.

Ефекти, що спостерігалися в ході експерименту, вказують на те, що функціонування периферичних нервів може бути поліпшене за допомогою  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти. Це має відношення до сенсорних порушень при діабетичній поліневропатії, що може проявитися в таких формах парестезії, як печіння, біль, оніміння і формікація.

**Фармакокінетика.** При пероральному застосуванні Тіоктациду® 600 HR (швидке вивільнення) відбувається швидке всмоктування  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти. Завдяки значному ефекту «першого проходження» абсолютна біодоступність  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти (яка визначається як материнська субстанція) при прийомі таблеток Тіоктациду® 600 HR становить приблизно 20 % порівняно з такою при внутрішньовенному введенні. Завдяки швидкому розподілу у тканинах період напіввиведення  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти становить приблизно 25 хвилин. Подібно розчину для перорального прийому, що є стандартом як лікарська форма з максимальним всмоктуванням, у таблеток Тіоктациду® 600 HR профіль абсорбції зі швидким припливом активної речовини, що супроводжується зниженням міжіндивідуальної варіабельності. Відносна біодоступність Тіоктациду® 600 HR (порівняно з розчином для перорального прийому) становить > 60 %. Максимальна концентрація в плазмі на рівні 4 мкг/мл була відзначена приблизно через 0,5 години після прийому внутрішньо 600 мг  $\alpha$ -ліпоєвої кислоти. Експерименти на тваринах (щури, собаки) із використанням радіоактивних міток показали виведення препарату переважно нирками на 80-90 %, переважно у формі метаболітів. У людини лише незначна частина незмінної речовини залишається в сечі. Біотрансформація відбувається переважно за рахунок окисного скорочення бічних ланцюжків ( $\beta$ -окиснення) і/або за допомогою S-метилування відповідних тіолів.

### **Фармацевтичні характеристики.**

**Основні фізико-хімічні властивості:** жовто-зелені з матовим блиском двоопуклі продовгуваті таблетки, вкриті оболонкою.

**Термін придатності.** 5 років.

**Умови зберігання.** Зберігати при температурі не вище 25 °C. Зберігати у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.** По 30 та 100 таблеток, вкритих оболонкою, у флаконі.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

### **Виробник.**

МЕДА Меньюфакчеринг ГмбХ /MEDA Manufacturing GmbH.

МЕДА Фарма ГмбХ енд Ко. КГ /MEDA Pharma GmbH & Co. KG.

### **Місцезнаходження.**

Нойратер Рінг 1, 51063 Кельн, Німеччина /Neurather Ring 1, 51063 Cologne, Germany

Бенцштрассе 1, 61352 Бад Хомбург, Німеччина /Benzstrasse 1, 61352 Bad Homburg, Germany