Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота Япония

<u>Клинико-фармакологическая группа:</u> Препарат с антиоксидантным действием, регулирующий углеводный и липидный обмен

Фармако-терапевтическая группа: Метаболическое средство

Фармакологическое действие: Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота - эндогенный антиоксидант прямого свободные радикалы) и непрямого действия. Является коферментом (связывает декарбоксилирования альфа-кетокислот. Способствует снижению концентрации глюкозы в плазме крови и увеличению концентрации гликогена в печени, также снижает инсулинорезистентность, участвует в регулировании углеводного и липидного обменов, стимулирует обмен холестерина. Благодаря своим антиоксидантным свойствам, тиоктовая кислота защищает клетки от повреждения их продуктами распада, уменьшает образование конечных продуктов прогрессирующего гликозилирования белков в нервных клетках при сахарном диабете, улучшает микроциркуляцию и эндоневральный кровоток, повышает физиологическое содержание антиоксиданта глутатиона. Способствуя снижению концентрации глюкозы в плазме крови, воздействует на альтернативный метаболизм глюкозы при сахарном диабете, снижает накопление патологических метаболитов в виде полиолов, и, тем самым, уменьшает отек нервной ткани. Благодаря участию в метаболизме жиров, тиоктовая кислота увеличивает биосинтез фосфолипидов, в частности, фосфоинозитидов, благодаря чему улучшает поврежденную структуру 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 полиневропатии в виде парестезии, ощущения жжения, боли и онемения конечностей. Таким образом, тиоктовая кислота оказывает антиоксидантное, нейротрофическое действие, улучшает метаболизм липидов.

Тиоктовая (α -липоевая) кислота содержится в человеческом организме, где она выполняет функцию кофермента в реакциях окислительного фосфорилирования пировиноградной кислоты и альфа-кетокислот. Тиоктовая кислота является эндогенным антиоксидантом, по биохимическому механизму действия она близка к витаминам группы \mathbf{B} .

Тиоктовая кислота способствует защите клетки от токсического действия свободных радикалов, возникающих в процессах обмена веществ; она также обезвреживает экзогенные токсичные соединения, проникшие в организм. Тиоктовая кислота повышает концентрацию эндогенного антиоксиданта глутатиона, что приводит к уменьшению выраженности симптомов полиневропатии. Препарат оказывает гепатопротекторное, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое, гипогликемическое действие; улучшает трофику нейронов. Результатом синергического действия тиоктовой кислоты и инсулина является повышение утилизации глюкозы. Применение тиоктовой кислоты в виде этилендиаминовой соли позволяет уменьшить выраженность возможных побочных эффектов.

Фармакокинетика

При в/в введении тиоктовой кислоты Стах в плазме крови через 30 мин составляет около 20 мкг/мл, АUС - около 5 мкг/ч/мл. Обладает эффектом "первого прохождения" через печень. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования. Vd - около 450 мл/кг. Общий плазменный клиренс - 10-15 мл/мин/кг. Выводится почками (80-90%), преимущественно в виде метаболитов. Т1/2 - около 25 мин.

Показания активных веществ препарата:

диабетическая полиневропатия; алкогольная полиневропатия

Режим дозирования

Препарат применяют в/в. Рекомендуемая доза при *тяжелой полиневропатии* составляет 600 мг (1 амп.) 1 раз/сут в течение 2-4 недель.

В дальнейшем пациента переводят на лечение в дозе 600 мг (1 таб.)/сут.



В/в введение препарата следует проводить медленно (не быстрее 2 мл/мин). Возможно также в/в введение неразбавленного раствора с помощью шприца для инъекций и перфузора. В этом случае время введения должно составлять не менее 12 мин.

Из-за чувствительности активного вещества к свету, ампулы следует извлекать из картонной упаковки непосредственно перед применением.

Правила приготовления инфузионного раствора

Препарат может применяться в виде инфузий в 0.9% растворе хлорида натрия (объем инфузий - 100-250 мл) в течение 30 мин. Инфузионный раствор следует защищать от света (например, обернув сосуд алюминиевой фольгой). Раствор для в/в введения, защищенный от света, годен в течение 6 ч.

Побочное действие

Аллергические реакции: очень редко - кожная сыпь, крапивница, зуд, экзема, покраснение кожи, системные аллергические реакции вплоть до анафилактического шока.

Со стороны нервной системы и органов чувств: очень редко - судороги, диплопия.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - пурпура, точечные кровоизлияния и склонность к кровотечению (из-за нарушения функций тромбоцитов), тромбоцитопатия, тромбофлебит.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - нарушение вкусовых ощущений (металлический привкус); редко - тошнота и рвота.

Со стороны организма в целом: часто - при быстром в/в введении может наблюдаться повышение внутричерепного давления и затруднение дыхания, которые самостоятельно проходят; редко - аллергические реакции в месте инфузий; очень редко - из-за улучшения утилизации глюкозы может снизиться уровень глюкозы в крови и появиться симптомы гипогликемии (спутанность сознания, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения).

Противопоказания к применению

- повышенная чувствительность к тиоктовой (α-липоевой) кислоте и другим компонентам препарата;
- беременность (отсутствует достаточный опыт применения препарата);
- период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата);
- детский и подростковый возраст (отсутствуют клинические данные о применении препарата у детей и подростков).

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказано назначение препарата при беременности и в период лактации, т.к. отсутствует достаточный опыт применения препарата в эти периоды.

Применение у детей

Противопоказание: детский и подростковый возраст (отсутствуют клинические данные о применении препарата у детей и подростков).

Особые указания

Употребление алкоголя является фактором риска развития полиневропатии и может снизить эффективность препарата, поэтому пациентам следует воздерживаться от приема алкогольных напитков как во время лечения препаратом, так и в периоды вне лечения.

Лечение диабетической полиневропатии должно проводиться на фоне поддержания оптимальной концентрации глюкозы в крови.

Передозировка

Случаев передозировки препаратом тиоктовой кислоты в форме раствора для в/в введения не отмечено.

Лечение (в случае передозировки): симптоматическое, при необходимости - противосудорожная терапия, меры по поддержанию функций жизненно важных органов.

Лекарственное взаимодействие

https://glutatione.farm/

При одновременном назначении тиоктовой кислоты и цисплатина отмечается снижение эффективности цисплатина.

При одновременном применении тиоктовой кислоты и инсулина или пероральных гипогликемических препаратов их действие может усиливаться, поэтому рекомендуется регулярный контроль уровня глюкозы в крови, особенно в начале терапии тиоктовой кислотой. В отдельных случаях допустимо уменьшение дозы гипогликемических препаратов во избежание развития симптомов гипогликемии.

Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

Фармацевтическое взаимодействие

Инфузионный раствор тиоктовой кислоты несовместим с раствором декстрозы, раствором Рингера и с растворами, реагирующими с дисульфидными и SH-группами, этанолом.

Условия хранения препарата

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

