

**БЕРЛИТИОН® 600
(BERLITHION® 600)**

ТНЮСТИС АСІД

зарегистрировано BERLIN-CHEMIE/MENARINI PHARMA GmbH (Германия)

произведено HAMELN PHARMACEUTICALS GmbH (Германия)

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА, СОСТАВ И УПАКОВКА**Концентрат для приготовления раствора для инфузий** зеленовато-желтого цвета, прозрачный.

	1 мл	1 амп.
тиоктовая кислота	25 мг	600 мг

Вспомогательные вещества: этилендиамин – 0.155 мг, вода д/и – до 24 мг.

24 мл – ампулы темного стекла объемом 25 мл (5) с белой меткой-указателем линии надлома и тремя полосками (зеленая-желтая-зеленая) – поддоны пластиковые (1) – пачки картонные.

Номер и дата регистрации: ЛП-001615 от 28.03.12**Код АТХ:** А16АХ01**Клинико-фармакологическая группа:**

Препарат с антиоксидантным действием, регулирующий углеводный и липидный обмен

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Тиоктовая (альфа-липовая) кислота – эндогенный антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого действия. Является коферментом реакций 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 полинейропатии в виде парестезии, ощущения жжения, боли и онемения конечностей. Таким образом, тиоктовая кислота оказывает антиоксидантное, нейротрофическое действие, улучшает метаболизм липидов.

Применение тиоктовой кислоты в виде этилендиаминовой соли позволяет уменьшить выраженность возможных побочных эффектов.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

При в/в введении тиоктовой кислоты C_{\max} в плазме крови через 30 мин составляет около 20 мкг/мл, АUC – около 5 мкг/ч/мл. Обладает эффектом «первого прохождения» через печень. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования. V_d – около 450 мл/кг. Общий плазменный клиренс – 10-15 мл/мин/кг. Выводится почками (80-90%), преимущественно в виде метаболитов. $T_{1/2}$ – около 25 мин.

ПОКАЗАНИЯ

- диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

РЕЖИМ ДОЗИРОВАНИЯ

Препарат предназначен для инфузионного введения.

В начале лечения препарат Берлитион 600 назначают в/в капельно в суточной дозе 600 мг (1 ампула).

Перед применением содержимое 1 ампулы (24 мл) разводят в 250 мл 0.9% раствора натрия хлорида и вводят в/в капельно, медленно, в течение не менее 30 мин. Из-за светочувствительности действующего вещества, раствор для инфузий готовят непосредственно перед применением. Приготовленный раствор необходимо защищать от воздействия света, например, с помощью алюминиевой фольги.

Курс лечения препаратом Берлитион 600 составляет 2-4 недели. В качестве последующей поддерживающей терапии применяют тиоктовую кислоту в пероральной форме в суточной дозе 300-600 мг. Продолжительность курса лечения и необходимость его повторения определяется врачом.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Возможные побочные эффекты при применении препарата Берлитион 600 приведены ниже по нисходящей частоте возникновения: часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$),

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

Со стороны нервной системы: очень редко – изменение или нарушение вкусовых ощущений, диплопия, судороги.

Со стороны системы кровотока: очень редко – тромбоцитопатия, геморрагическая сыпь (пурпура), тромбофлебит.

Со стороны обмена веществ: очень редко – снижение концентрации глюкозы в плазме крови (из-за улучшения усвоения глюкозы). Сообщалось о жалобах, свидетельствующих о гипогликемическом состоянии (головокружение, потливость, головная боль и нарушение зрения).

Со стороны иммунной системы: очень редко – аллергические реакции, такие как кожная сыпь, крапивница, зуд; в единичных случаях – анафилактический шок.

Местные реакции: очень редко – чувство жжения в месте введения.

Прочие: при быстром в/в введении наблюдались самопроизвольно проходящие повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове) и затруднение дыхания.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- гиперчувствительность к тиоктовой кислоте или другим компонентам препарата в анамнезе;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения препарата не установлены);
- беременность, период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата).

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ

Ввиду отсутствия достаточного клинического опыта применения препарата Берлитион 600 при беременности и в период грудного вскармливания, его применение у соответствующей категории пациенток не рекомендуется.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в плазме крови, особенно на начальной стадии терапии препаратом Берлитион 600. В некоторых случаях может возникнуть необходимость уменьшения дозы инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь во избежание развития гипогликемии. Прием алкоголя снижает эффективность лечения препаратом Берлитион 600, поэтому пациентам в период терапии препаратом Берлитион 600 следует воздержаться от употребления алкоголя в течение всего курса лечения, а также, по возможности, в перерывах между курсами.

При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности. При появлении симптомов гиперчувствительности (зуд, недомогание) введение препарата следует немедленно прекратить.

Растворителем для препарата Берлитион 600 может служить только 0.9% раствор натрия хлорида. Свежеприготовленный раствор для инфузий необходимо защищать от воздействия света, например, с помощью алюминиевой фольги.

Защищенный от света раствор может храниться примерно в течение 6 ч.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работу с механизмами

Влияние препарата Берлитион 600 на быстроту психомоторных реакций и способность к восприятию или оценке ситуации специально не изучалось, поэтому в период лечения препаратом Берлитион 600 следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: тошнота, рвота, головная боль.

В тяжелых случаях: психомоторное возбуждение или помутнение сознания, генерализованные судороги, выраженные нарушения кислотно-щелочного равновесия, лактоацидоз, гипогликемия (вплоть до развития комы), острый некроз скелетных мышц, ДВС-синдром, гемолиз, подавление деятельности костного мозга, полиорганная недостаточность.

Лечение: При подозрении на интоксикацию тиоктовой кислотой (например, введение более 80 мг тиоктовой кислоты на 1 кг массы тела) рекомендуется экстренная госпитализация и немедленное применение мер в соответствии с общими принципами, принятыми при случайном отравлении. Терапия симптоматическая. Лечение генерализованных судорог, лактоацидоза и других угрожающих жизни последствий интоксикации должно проводиться в соответствии с принципами современной интенсивной терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ, гемоперфузия или методы фильтрации с принудительным выведением тиоктовой кислоты не эффективны.

ЛЕКАРСТВЕННОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

В связи с тем, что тиоктовая кислота способна образовывать хелатные комплексы с металлами, следует избегать одновременного назначения с препаратами железа. Одновременное применение препарата Берлитион 600 с цисплатином снижает эффективность последнего.

С молекулами сахаров тиоктовая кислота образует плохо растворимые комплексные соединения. Препарат Берлитион 600 несовместим с растворами глюкозы, фруктозы и декстрозы, раствором Рингера, а также с растворами, реагирующими с дисульфидными и SH-группами.

Препарат Берлитион 600 усиливает гипогликемическое действие инсулина и гипогликемических средств для приема внутрь при одновременном применении.

Этанол значительно снижает терапевтическую эффективность тиоктовой кислоты.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОКИ ГОДНОСТИ

Препарат хранить в недоступном для детей и защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Не замораживать.

Срок годности – 3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Препарат отпускается по рецепту.