

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тиолепта®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тиолепта®

Международное непатентованное наименование: тиоктовая кислота

Лекарственная форма: раствор для инфузий.

Состав:

1 мл раствора для инфузий содержит:

Действующее вещество: тиоктовая кислота (альфа-липоевая кислота) 12,00 мг;

Вспомогательные вещества: меглюмин (N-метил-D-глюкамин) 15,00 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 400) 30,00 мг, повидон К-17 (Коллидон® 17 PF или Пласдон С-15) 10,00 мг, вода для инъекций до 1 мл.

Примечание: 1) активным веществом является меглюминовая соль тиоктовой кислоты, получаемая из тиоктовой кислоты и меглюмина.

2) теоретическая осмолярность 269 мОсм/л.

Описание: прозрачный раствор светло-желтого или светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний желудочно-кишечного тракта и нарушений обмена веществ.

Код АТХ: A16AX01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота – эндогенный антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого действия (восстанавливает физиологическую концентрацию глутатиона, повышает активность супероксиддисмутазы).

В качестве кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов участвует в реакциях окислительного фосфорилирования пировиноградной кислоты (ПВК) и альфа-кетокислот.

По биохимическому механизму действия близка к витаминам группы В.

Тиоктовая кислота оказывает антиоксидантное, нейротрофическое, гипогликемическое действие, улучшает метаболизм липидов:

- связываясь с избыточным количеством свободных кислородных радикалов, защищает клетки от повреждения продуктами распада; при сахарном диабете уменьшает образование конечных продуктов прогрессирующего гликирования белков в нервных клетках, уменьшает эндоневральную гипоксию и ишемию, повышает концентрацию антиоксиданта глутатиона, тем самым, ослабляя проявления полинейропатии в виде парестезии, ощущения жжения, боли и онемения конечностей;
- участвует в регулировании углеводного обмена (способствует снижению концентрации глюкозы в плазме крови и увеличению концентрации гликогена в печени, снижает инсулинорезистентность тканей);
- стимулирует метаболизм холестерина, снижая его концентрацию в плазме крови; участвуя в метаболизме жиров, тиоктовая кислота увеличивает биосинтез фосфолипидов, в частности фосфоинозитидов, благодаря чему восстанавливается поврежденная структура клеточных мембран; нормализуется энергетический обмен и проведение нервных импульсов.

Альфа-липоевая кислота улучшает нервный кровоток, снижает антиоксидантный стресс, а также улучшает нервную проводимость и плотность внутриэпидермальных нервных волокон при экспериментальной полинейропатии.

Фармакокинетика

При внутривенном введении время достижения максимальной концентрации – 10 - 11 мин, максимальная концентрация составляет около 20 мкг/мл.

Общий плазменный клиренс – 10 – 15 мл/мин.

Обладает эффектом «первого прохождения» через печень. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования.

Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками (80 - 90 %), в небольшом количестве – в неизменном виде. Период полувыведения составляет 25 мин.

Показания к применению

Диабетическая и алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к тиоктовой кислоте или к какому-либо другому

компоненту препарата;

- Детский возраст до 18 лет;
- Беременность;
- Период грудного вскармливания.

С осторожностью

- Одновременное применение: с цисплатином; препаратами, содержащими железо, магний, кальций; с гипогликемическими препаратами; препаратами инсулина;
- Пациенты с сахарным диабетом;
- Нарушение функции печени и почек.

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 (альфа-липоевая кислота) в материнское молоко. При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

При тяжелых формах диабетической и алкогольной полинейропатии препарат вводят внутривенно капельно, 600 мг (50 мл раствора 12 мг/мл) 1 раз в день. В начале курса препарат вводят внутривенно в течение 2-4 недель. Затем возможен переход на пероральную форму препарата (таблетки) в дозе 300-600 мг в сутки. Препарат следует вводить медленно, не более 50 мг тиоктовой кислоты за 1 минуту. Внутривенное введение возможно с помощью перфузора (длительность введения – не менее 12 минут). При применении препарата флаконы раствора для инфузий помещают в прилагаемые подвесные светозащитные футляры, изготовленные из полиэтилена черного цвета.

Побочное действие

Частота проявления неблагоприятных побочных реакций приведена в соответствии с классификацией ВОЗ:

- | | | |
|-------------|---|---|
| Очень часто | - | $\geq 1/10$ назначений; |
| Часто | - | $\geq 1/100$ до $\leq 1/10$ назначений; |
| Нечасто | - | $\geq 1/1000$ до $\leq 1/100$ назначений; |
| Редко | - | $\geq 1/10000$ до $\leq 1/1000$ назначений; |

Очень редко - $\leq 1/10000$ назначений;

Частота неизвестна - невозможно установить из имеющихся данных.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: точечные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу, тромбоцитопения, геморрагическая сыпь (пурпура), тромбозы.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: системные аллергические реакции (вплоть до развития анафилактического шока); аутоиммунный инсулиновый синдром (АИС) у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину.

Нарушения со стороны нервной системы

Очень редко: изменение или нарушение вкусовых ощущений; судороги.

Нарушения со стороны органа зрения

Очень редко: диплопия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: аллергические реакции – крапивница, кожный зуд, экзема, кожная сыпь.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Частота неизвестна: в связи с улучшением усвоения глюкозы возможно снижение концентрации глюкозы в крови. При этом могут возникнуть симптомы гипогликемии: головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения;

Очень редко: аллергические реакции в месте введения – раздражение, гиперемия или припухлость; в случае быстрого введения препарата возможно повышение внутричерепного давления (возникает чувство тяжести в голове), затруднение дыхания. Данные реакции проходят самостоятельно.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы: до настоящего времени неизвестны.

Лечение: симптоматическое. Специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении тиоктовой кислоты и цисплатина отмечается снижение эффективности цисплатина. Тиоктовая кислота связывает металлы, поэтому ее не следует применять одновременно с препаратами, содержащими металлы (например, препаратами железа, магния, кальция). При одновременном применении тиоктовой кислоты и инсулина или пероральных гипогликемических препаратов их действие может усиливаться, поэтому рекомендуется регулярный контроль концентрации глюкозы в крови, особенно в начале терапии тиоктовой кислотой. В отдельных случаях допустимо уменьшение дозы гипогликемических препаратов во избежание развития симптомов гипогликемии. Инфузионный раствор тиоктовой кислоты несовместим с раствором декстрозы, раствором Рингера и с растворами, реагирующими с дисульфидными и SH-группами, этанолом. Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

Особые указания

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы крови, особенно на начальной стадии терапии. В некоторых случаях необходимо уменьшить дозу инсулина или перорального гипогликемического препарата, чтобы избежать развития гипогликемии. При возникновении симптомов гипогликемии (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройства зрения, тошнота) следует немедленно прекратить терапию. При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности вплоть до развития анафилактического шока. В единичных случаях при применении препарата Тиолепта® у пациентов с отсутствием гликемического контроля и в тяжелом общем состоянии могут развиваться серьезные анафилактические реакции.

Во время лечения тиоктовой кислотой были зарегистрированы случаи Аутоиммунного инсулинового синдрома (АИС). Пациенты с человеческим лейкоцитарным антигеном, таким как HLA-DRB1*04:06 и HLA-DRB1*04:03 аллели, более предрасположены к развитию АИС при лечении тиоктовой кислотой. Аллель HLA-DRB1*04:03 (отношение шансов восприимчивости к АИС : 1,6) особенно часто встречается у европеоидов, причём в южной Европе он распространён больше, чем в северной, а аллель HLA-DRB1*04:06 (отношение шансов восприимчивости к АИС : 56,6) особенно часто встречается у японских и корейских пациентов.

АИС следует рассматривать в дифференциальной диагностике спонтанной гипогликемии у пациентов, принимающих альфа-липоевую кислоту (см. раздел «Побочное действие»).

Употребление алкоголя в период терапии препаратом Тиолепта® снижает эффективность препарата и является фактором риска, способствующим развитию и прогрессированию нейропатии. Пациентам, принимающим препарат, следует воздержаться от употребления алкоголя.

У пациентов с нарушением функции печени необходимо принимать с осторожностью.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Влияние препарата на способность к вождению транспортных средств и управлению механизмами специально не изучалось, поэтому во время лечения препаратом Тиолепта® рекомендуется соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций.

Форма выпуска

Раствор для инфузий 12 мг/мл.

По 25 мл или 50 мл во флаконы из стекла 1-го гидролитического класса коричневого цвета, герметично укупоренные пробками резиновыми, обжатые алюминиевыми или комбинированными колпачками.

По 1, 3, 5 или 10 флаконов вместе с подвесными светозащитными футлярами по количеству флаконов, изготовленными из пленки ПВД (полиэтилен высокого давления) черного цвета, перегородками из картона и инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С во вторичной упаковке (пачке картонной).

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Общество с ограниченной ответственностью Фирма «ФЕРМЕНТ» (ООО Фирма «ФЕРМЕНТ»), Россия.

Адрес места производства:

Производство готовой лекарственной формы:

Московская обл., г.о. Красногорск, п. Мечниково, влд. 11, стр. 1

Первичная упаковка:

Московская обл., г.о. Красногорск, п. Мечниково, влд. 11, стр. 1

Вторичная (потребительская) упаковка:

Московская обл., г.о. Красногорск, п. Мечниково, влд. 11, стр. 1

Выпускающий контроль качества:

Московская обл., г.о. Красногорск, п. Мечниково, влд. 11, стр. 1

Тел./факс: (495) 635-00-28.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия

141100, Московская обл., г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

Электронный адрес:

safety@canonpharma.ru

Получить дополнительные данные о препарате, направить претензию на его качество, безопасность, сообщить о нежелательных лекарственных реакциях можно по телефону: 8 (800) 700-59-99 (бесплатная линия 24 часа) или на сайте www.canonpharma.ru в разделе «Политика в области качества» - «Безопасность препаратов».