

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тиолепта®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тиолепта®

Международное непатентованное наименование: тиоктовая кислота.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: тиоктовая кислота (альфа-липоевая кислота) 300,0 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный 13,7 мг, кремния диоксид коллоидный 13,8 мг, кроскармеллоза натрия 24,8 мг, лактозы моногидрат 116,0 мг, кальция стеарат 15,5 мг, повидон К-30 32,6 мг, целлюлоза микрокристаллическая 83,6 мг;

состав пленочной оболочки: Опадрай 20A220053 желтый 20,000 мг, в том числе: [гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза) 6,000 мг, гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 5,800 мг, краситель железа оксид желтый 0,826 мг, краситель солнечный закат желтый 0,004 мг, тальк 2,000 мг, титана диоксид 5,370 мг].

Описание

Таблетки круглые двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой коричневатого-желтого цвета. На поперечном разрезе – светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: метаболическое средство.

Код АТХ: A16AX01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тиоктовая (альфа-липоевая) 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 отёк 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, гипогликемическое действие, улучшает метаболизм липидов.

Фармакокинетика

Абсорбция и распределение

При приеме внутрь быстро и полно всасывается в желудочно-кишечном тракте, прием одновременно с пищей снижает абсорбцию. Время достижения максимальной концентрации – 40-60 минут. Обладает эффектом "первого прохождения" через печень. Биодоступность – 30%. Объем распределения – около 450 мл/кг. Общий плазменный клиренс – 10-15 мл/мин.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени путем окисления боковой цепи и конъюгирования.

Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками (80-90%). Период полувыведения - 25 мин.

Показания к применению

- диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к тиоктовой кислоте и любому из вспомогательных веществ препарата;
- беременность, период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата);
- детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения не установлены).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение тиоктовой кислоты во время беременности противопоказано в связи с отсутствием достаточного опыта применения.

Исследования репродуктивной токсичности не выявили рисков отношении влияния на развитие плода и каких-либо эмбриотоксических свойств препарата.

Неизвестно, проникает ли тиоктовая кислота в материнское молоко. При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь натощак, приблизительно за 30 минут до первого приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды по 600 мг (2 таблетки) 1 раз в день. Максимальная суточная доза – 600 мг.

Максимальный курс приема препарата – 3 месяца. В некоторых случаях прием препарата предполагает более длительное применение, сроки которого определяются лечащим врачом.

Побочное действие

Частота возникновения побочных эффектов приведена в соответствии с классификацией ВОЗ:

очень часто	-	$\geq 1/10$;
часто	-	от $\geq 1/100$ до $< 1/10$;
нечасто	-	от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$;
редко	-	от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$;
очень редко	-	$< 1/10000$.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

часто - тошнота;

очень редко - изжога, рвота, диарея, боль в животе.

Со стороны иммунной системы:

очень редко - аллергические реакции - крапивница, кожная сыпь, зуд; системные аллергические реакции (вплоть до развития анафилактического шока);

частота неизвестна - аутоиммунный инсулиновый синдром у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

частота неизвестна - экзема.

Со стороны нервной системы:

часто - головокружение;

очень редко - изменение вкусовых ощущений.

Со стороны обмена веществ и питания:

очень редко – развитие гипогликемии (в связи с улучшением утилизации глюкозы), симптомы которой включают головокружение, повышенное потоотделение, головную боль, расстройства зрения.

Передозировка

Симптомы: головная боль, тошнота, рвота.

В случае острой передозировки (при применении 10-40 г) могут отмечаться серьезные признаки интоксикации (генерализованные судорожные припадки; выраженные нарушения кислотно-щелочного баланса, ведущие к лактоацидозу; гипогликемическая кома; тяжелые нарушения свертываемости крови, приводящие иногда к фатальному исходу).

При подозрении на существенную передозировку препарата (дозы, равнозначные более 10 таблеткам для взрослого или более 50 мг/кг массы тела для ребенка) необходима немедленная госпитализация.

Лечение: симптоматическое (включая промывание желудка, прием активированного угля), при необходимости - противосудорожная терапия, меры по поддержанию жизненно важных функций. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

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), а также молочными продуктами (из-за содержания в них кальция); интервал между приемом таких препаратов и тиоктовой кислотой должен составлять не менее 2 ч.

При одновременном применении тиоктовой кислоты и инсулина или пероральных гипогликемических препаратов их действие может усиливаться.

Тиоктовая кислота усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидов. Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

Особые указания

Прием алкоголя снижает эффективность лечения препаратом, поэтому пациентам в период терапии препаратом Тиолепта® следует воздержаться от употребления алкоголя в течение всего курса лечения, а также, по возможности, в перерывах между курсами. Употребление алкоголя во время лечения тиоктовой кислотой также является фактором риска развития и прогрессирования нейропатии.

У пациентов с сахарным диабетом необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в крови, особенно на начальной стадии терапии. В некоторых случаях необходимо уменьшить дозу инсулина или перорального гипогликемического препарата, чтобы избежать развития гипогликемии.

Одновременный прием пищи может препятствовать всасыванию тиоктовой кислоты.

При приеме препарата употребление молочных продуктов не рекомендуется (из-за содержания в них кальция). Интервал между приемом тиоктовой кислоты и употреблением молочных продуктов должен составлять не менее 2ч.

Описано несколько случаев развития аутоиммунного инсулинового синдрома у пациентов с сахарным диабетом на фоне лечения тиоктовой кислотой, который характеризовался частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину. Возможность развития аутоиммунного инсулинового синдрома определяется наличием у пациентов гаплотипов HLA-DRB1*0406 и HLA-DRB1*0403.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами специально не изучалось. Необходимо соблюдать осторожность при вождении транспортных средств и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 300 мг.

По 10 или 15 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или пленки ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 3, 5, 6, 9, 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или по 2, 4, 6, 8 контурных ячейковых упаковок по 15 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С в упаковке производителя.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускается по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия.

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

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

Информация об организациях, в которые могут быть направлены претензии по качеству лекарственного препарата

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия.

141100, Московская область, 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».

Производитель

ЗАО «Канонфарма продакшн»

Россия, 141100, Московская область г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

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

www.canonpharma.ru

Зам. генерального директора
ЗАО «Канонфарма продакшн»



В.М. Кокеладзе

