

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Тиолепта, 300 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: тиоктовая кислота.

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 300 мг тиоктовой кислоты (в виде альфа-липоевой кислоты).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат, краситель солнечный закат желтый (см. раздел 4.3, 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

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

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

- диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования*Взрослые*

По 2 таблетки (300 мг) - 1 раз в сутки.

Продолжительность курса лечения и необходимость его повторения определяются врачом.

Особые группы пациентов*Пациенты пожилого возраста*

Для пациентов пожилого возраста рекомендуется обычный режим дозирования.

Пациенты с нарушением функции почек

Для пациентов с нарушением функции почек рекомендуется обычный режим дозирования.

Пациенты с нарушением функции печени

Для пациентов с умеренным нарушением функций печени рекомендуется обычный режим дозирования. Данные клинических исследований и клинический опыт применения у пациентов с тяжелым нарушением функций печени недоступны. Безопасность и эффективность у пациентов с тяжелым нарушением функций печени не была установлена.

Дети

Безопасность и эффективность тиоктовой кислоты у детей и подростков в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь. Препарат принимают натощак, за 30 минут до завтрака, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к тиоктовой кислоте или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в подразделе 6.1.
- Детский возраст до 18 лет (см. раздел 4.2).
- Непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (см. раздел 4.4)
- Беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6)

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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 2 ч.

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.

Вспомогательные вещества:

Лактоза

Поскольку таблетки препарата Тиолепта содержат лактозу, пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот лекарственный препарат.

Краситель солнечный закат желтый

Препарат Тиолепта содержит краситель солнечный закат желтый, который может вызывать аллергические реакции.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

Тиоктовая кислота связывает металлы, поэтому ее не следует назначать 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 часов.

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

Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Клиническое исследование у беременных женщин не проводилось.

Применение препарата Тиолепта в период беременности противопоказано.

Лактация

Клинические исследования у кормящих женщин не проводились.

Применение препарата Тиолепта в период лактации противопоказано.

Фертильность

В доклинических исследованиях у крыс тиоктовая кислота при пероральном применении не оказывала никакого влияния на фертильность. Клинические данные о влиянии тиоктовой кислоты на фертильность отсутствуют. Сообщалось о положительном влиянии на спермограмму у бесплодных мужчин с астеноотератоспермией. Каких-либо негативных эффектов в отношении фертильности для препарата Тиолепта не ожидается.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Влияние приема тиоктовой кислоты на способность управлять транспортными средствами и механизмами не изучалось. Учитывая возможные нежелательные реакции (головокружение и развитие симптомов гипогликемии), необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами, а также при

занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота нежелательных реакций, перечисленных ниже, определялась следующим образом: *очень часто* ($>1/10$), *часто* ($>1/100$ и $<1/10$), *нечасто* ($>1/1000$ и $<1/100$), *редко* ($>1/10\ 000$ и $<1/1\ 000$), *очень редко* ($<1/10\ 000$, включая отдельные случаи), *частота неизвестна* (невозможно оценить по имеющимся данным).

Нарушения со стороны иммунной системы:

Очень редко: аллергические реакции (вплоть до развития анафилактического шока), кожная сыпь, крапивница, зуд; аутоиммунный инсулиновый синдром (АИС), клиническими проявлениями АИС могут быть: головокружение, потливость, мышечная дрожь, учащение сердцебиения, тошнота, головная боль, спутанность сознания, нарушение зрительного восприятия, потеря сознания, кома.

Нарушения метаболизма и питания:

Очень редко: 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.

Нарушения со стороны нервной системы:

Очень редко: изменение или нарушение вкусовых ощущений.

Желудочно-кишечные нарушения:

Часто - тошнота;

Очень редко: тошнота, рвота, диарея, боль в животе.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Частота неизвестна: экзема.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза - риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (РОСЗДРАВНАДЗОР)

109074, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1

Телефон: 8 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdraynadzor.goy.ru

Адрес в интернете: www.roszdraynadzor.goy.ru

4.9. 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: A16AX01

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Тиоктовая (α-липоевая) кислота образуется в человеческом организме при окислительном декарбоксилировании α-кетокислот. В качестве кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов она участвует в реакциях окислительного декарбоксилирования пировиноградной кислоты и α-кетокислот. Тиоктовая кислота является эндогенным антиоксидантом (связывает свободные радикалы), по биохимическому механизму действия она близка к витаминам группы В.

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 полинейропатии. Препарат оказывает гепатопротекторное, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое, гипогликемическое действие; улучшает трофику нейронов. Результатом синергического действия тиоктовой кислоты и инсулина является повышение утилизации глюкозы.

Препарат Тиолепта представляет собой оптимизированную лекарственную форму для перорального применения, которая позволяет избежать высокой вариабельности концентрации тиоктовой кислоты в плазме крови.

Таким образом, тиоктовая кислота оказывает гепатопротекторное, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое, гипогликемическое действие, улучшает трофику нейронов. Результатом синергического действия тиоктовой кислоты и инсулина является повышение утилизации глюкозы.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Абсорбция

При приеме препарата внутрь тиоктовая кислота быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием препарата Тиолепта одновременно с приемом пищи может снизить всасывание тиоктовой кислоты. Прием препарата согласно рекомендациям, за 30 минут до еды позволяет избежать нежелательного взаимодействия с пищей, т.к. всасывание тиоктовой кислоты на момент приема пищи уже завершено.

Биодоступность составляет 30-60 % вследствие эффекта «первого прохождения» через печень. Максимальная концентрация тиоктовой кислоты в плазме крови достигается через 30 мин после приема препарата и составляет 4 мкг/мл.

Абсолютная биодоступность тиоктовой кислоты составляет 20 %.

Распределение

Объем распределения - 450 мг/кг. Общий плазменный клиренс - 10-15 мл/мин.

Биотрансформация

Тиоктовая кислота метаболизируется в печени путем окисления боковой цепи и конъюгирования.

Элиминация

Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками (80-90 %).

Период полувыведения составляет 25 мин.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Ядро таблетки:

- крахмал картофельный
- кремния диоксид коллоидный;
- кроскармеллоза натрия
- лактозы моногидрат
- кальция стеарат

- повидон К-30.
- целлюлоза микрокристаллическая (тип 101)

Состав пленочной оболочки:

- опадрай 20A220053 желтый, в том числе:
- гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза)
- гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза)
- краситель железа оксид желтый
- краситель солнечный закат желтый
- тальк
- титана диоксид

6.2. Несовместимость

Неприменимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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 30 таблеток в банку полимерную для лекарственных средств и полиэтилена низкого давления или полиэтилентерефталата. Крышка из полиэтилена (25 % ПЭНД + 75 % ПЭВД), полиэтилена высокой плотности или полипропилена.

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, или по 1 банке полимерной для лекарственных средств вместе с инструкцией по применению в пачку из картона

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ЗАО «Канонфарма продакшн»,

141100, Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: +7 (495) 797-99-54, факс: +7 (495) 797-96-63.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ЗАО «Канонфарма продакшн»,

141100, Московская обл., г.о. Щёлково, г. Щёлково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: +7 (495) 797-99-54, факс: +7 (495) 797-96-63.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(003045)-(РГ-RU)

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ

Дата первичной регистрации: 22 августа 2023

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Тиолепта доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>.