

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тиолепта®

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер: ЛП-004656

Торговое наименование: Тиолепта®

Группировочное наименование: тиоктовая кислота

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий

Состав

1 мл концентрата содержит:

действующее вещество: меглюмина тиоктат* 58,40 мг, в пересчете на тиоктовую кислоту 30,00 мг;

вспомогательные вещества: макрогол-400 200 мг, меглюмин до pH 8,2-8,5 от 1,1 мг до 2,9 мг, вода для инъекций до 1 мл.

Примечание. * образуется в результате взаимодействия тиоктовой кислоты 30,00 мг и меглюмина 28,40 мг.

Описание

Прозрачный желтый или зеленовато-желтый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: метаболическое средство.

Код АТХ: A16AX01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тиоктовая кислота (α -липоевая кислота) - содержащийся в человеческом организме антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого действия. В качестве кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов участвует в окислительном декарбоксилировании пировиноградной кислоты и α -кетокислот. Способствует снижению концентрации глюкозы в плазме крови и увеличению концентрации гликогена в печени, а также преодолению инсулинорезистентности. По характеру биохимического действия близка к витаминам группы В. Оказывает гепатопротекторное, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое, гипогликемическое действие. Улучшает трофику нейронов.

При сахарном диабете тиоктовая кислота уменьшает образование конечных продуктов гликирования, улучшает эндоневральный кровоток, повышает содержание глутатиона до физиологического значения, что в результате приводит к улучшению функционального состояния периферических нервных волокон при диабетической полинейропатии.

Благодаря участию в метаболизме жиров, тиоктовая кислота увеличивает биосинтез фосфолипидов, в частности фосфоинозитидов, восстанавливая повреждения 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, онемения конечностей.

Таким образом, тиоктовая кислота оказывает антиоксидантное, нейротрофическое действие, улучшает метаболизм липидов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение. При внутривенном введении тиоктовой кислоты максимальная концентрация в плазме крови через 30 минут составляет около 20 мкг/мл, площадь под кривой концентрация-время (AUC) около 5 мкг/ч/мл. Объем распределения - около 450 мл/кг. Тиоктовая кислота обладает эффектом «первого прохождения» через печень.

Метаболизм и выведение. Образование метаболитов происходит в результате окисления боковой цепи и конъюгирования. Тиоктовая кислота и её метаболиты выводятся почками преимущественно в виде метаболитов (80-90%), в небольшом количестве - в неизменном виде. Период полувыведения ($T_{1/2}$) около 25 минут. Общий плазменный клиренс 10-15 мл/мин/кг.

Показания к применению

- диабетическая полинейропатия;

- алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

-Повышенная чувствительность к тиоктовой кислоте или другим компонентам препарата.

-Беременность, период грудного вскармливания (отсутствует достаточный опыт применения препарата).

-Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения не установлены).

С осторожностью

Внутривенное введение препарата следует проводить с осторожностью у пациентов пожилого возраста (старше 75 лет).

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

Способ применения и дозы

Препарат предназначен для приготовления раствора для внутривенной инфузии после предварительного разведения в 0,9% растворе хлорида натрия.

1 ампула препарата объемом 10 мл содержит 300 мг тиоктовой кислоты.

В начале лечения препарат назначают внутривенно капельно в суточной дозе 600 мг (2 ампулы объемом 10 мл).

Перед применением содержимое двух ампул объемом 10 мл разводят в 250 мл 0,9% раствора натрия хлорида и вводят внутривенно капельно, медленно, в течение не менее 30 мин.

Препарат обладает светочувствительностью, поэтому ампулы следует извлекать из упаковки непосредственно перед использованием. Во время проведения инфузий, флакон с раствором защищают от света. Приготовленный раствор следует хранить в защищенном от света месте и использовать в течение 6 часов после приготовления.

Курс лечения в виде раствора для инфузий составляет 2-4 недели. Затем можно продолжить прием тиоктовой кислоты в пероральной форме в суточной дозе 300-600 мг. Продолжительность курса лечения и необходимость его повторения определяется врачом.

Побочное действие

Возможные побочные эффекты представлены ниже в соответствии с частотой 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.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: точечные кровоизлияния в слизистые оболочки, кожу; тромбоцитопатия, геморрагическая сыпь (пурпура), гипокоагуляция.

Нарушения со стороны иммунной системы

Очень редко: аллергические реакции, такие как кожная сыпь, экзема, крапивница, кожный зуд.

Частота неизвестна: анафилактический шок, аутоиммунный инсулиновый синдром у пациентов с сахарным диабетом, который характеризуется частыми гипогликемиями в условиях наличия аутоантител к инсулину.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

Очень редко: гипогликемия (в связи с улучшением утилизации глюкозы, симптомы которой включают головокружение, головную боль, повышенное потоотделение и нарушение зрения).

Нарушения со стороны нервной системы

Очень редко: изменение или нарушение вкусовых ощущений, «приливы», судороги.

Нарушения со стороны органа зрения

Очень редко: диплопия, нечеткость зрения.

Нарушения со стороны сердца

Частота неизвестна: боль в области сердца, тахикардия при быстром введении препарата.

Нарушения со стороны сосудов

Очень редко: тромбофлебит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, рвота;

Очень редко: боль в животе, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Очень редко: повышение активности «печеночных» ферментов.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Очень редко: чувство жжения в месте введения;

Частота неизвестна: аллергические реакции в месте введения - раздражение, гиперемия или припухлость.

Прочие

Очень редко: при быстром внутривенном введении наблюдалось самопроизвольно проходящее повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове), затруднение дыхания и слабость.

Передозировка

Симптомы: головная боль, тошнота, рвота.

В тяжелых случаях (при применении тиоктовой кислоты в дозе 10-40 г): психомоторное возбуждение или помутнение сознания, генерализованные судороги, выраженное нарушение кислотно-щелочного состояния с лактоацидозом, гипогликемия (выплоть до развития комы), острый некроз скелетных мышц, синдром диссеминированного внутрисосудистого свертывания (ДВС-синдром), гемолиз, подавление деятельности костного мозга, полиорганная недостаточность.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

В связи с тем, что тиоктовая кислота способна образовывать хелатные комплексы с металлами, следует избегать совместного назначения с препаратами, содержащими металлы (например, препаратами железа, магния, кальция).

При одновременном применении тиоктовой кислоты и цисплатина отмечается снижение эффективности цисплатина. При одновременном применении с инсулином или пероральными гипогликемическими препаратами наблюдается усиление гипогликемического эффекта.

Тиоктовая кислота образует с молекулами сахара (например, раствор левулозы) трудно растворимые комплексные соединения, следовательно, препарат несовместим с раствором глюкозы (декстрозы), раствором Рингера, а также с соединениями (в т.ч. их растворами), реагирующими с дисульфидными и SH-группами. Растворителем для препарата может служить только 0,9% раствор натрия хлорида.

Усиливает противовоспалительное действие глюкокортикостероидов.

Этанол и его метаболиты ослабляют действие тиоктовой кислоты.

Особые указания

У пациентов с сахарным диабетом, особенно в начале лечения, необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в крови. В отдельных случаях требуется снижение дозы инсулина или перорального гипогликемического препарата, чтобы избежать развития гипогликемии.

При развитии симптомов гипогликемии (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройство зрения, тошнота) следует немедленно прекратить введение препарата. При парентеральном применении возможно возникновение реакций гиперчувствительности. При появлении симптомов, таких как зуд, недомогание, лечение препаратом Тиолепта® следует немедленно прекратить.

Прием алкоголя снижает эффективность применения тиоктовой кислоты, поэтому пациентам следует воздерживаться от употребления алкоголя в течение всего курса терапии препаратом Тиолепта®, а также, по возможности, в перерывах между курсами. Употребление алкоголя во время лечения тиоктовой кислотой также является фактором риска развития и прогрессирования нейропатии. Приготовленный раствор препарата следует защищать от воздействия света.

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, 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

Концентрат для приготовления раствора для инфузий 30 мг/мл.

По 10 мл в ампулы для лекарственных средств, изготовленные из темного медицинского стекла.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

По 1 или 2 контурных ячейковых упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Допускается в пачку вкладывать скарификатор.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/

Организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия

141100, Московская обл., Щелковский район,
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

ООО «Гротекс», Россия.

195279 г. Санкт-Петербург, Индустриальный пр.,
дом 71, корпус 2, литера А.