

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Октолипен®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Октолипен®

Международное непатентованное или группировочное наименование: тиоктовая кислота

Лекарственная форма: концентрат для приготовления раствора для инфузий

Состав на одну ампулу:

Действующее вещество: тиоктовая кислота (α -липоевая кислота) - 300 мг;

Вспомогательные вещества: этилендиамин - 87,4 мг; динатрия эдетат (динатриевая соль этилендиамина тетрауксусной кислоты) - 1 мг; вода для инъекций - до 10 мл.

Описание: прозрачная зеленовато - желтая жидкость.

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

Код АТХ: A16AX01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тиоктовая кислота (альфа-липоевая кислота) - эндогенный антиоксидант прямого (связывает свободные радикалы) и непрямого (способствует восстановлению внутриклеточного уровня глутатиона и повышению активности супероксиддисмутазы) действия. В качестве кофермента митохондриальных мультиферментных комплексов участвует в окислительном декарбоксилировании пировиноградной кислоты и альфа-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. Участвует в регулировании липидного и углеводного обмена, стимулирует обмен холестерина. 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, ощущения жжения, боли и онемения конечностей.

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

Фармакокинетика

Абсорбция

При внутривенном введении тиоктовой кислоты в дозе 600 мг максимальная концентрации в плазме крови через 30 минут составляет 20 мкг/мл. Площадь под кривой «концентрация-время» составляет около 5 мкг /ч/мл. Биодоступность 30%.

Распределение

Объем распределения – около 450 мл/кг.

Биотрансформация

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

Элиминация

Тиоктовая кислота и ее метаболиты выводятся почками преимущественно в виде метаболитов (80 – 90 %), в небольшом количестве – в неизменном виде. Период полувыведения составляет около 25 мин. Общий плазменный клиренс – 10 – 15 мл/мин/кг.

Показания к применению

- Диабетическая полинейропатия;
- алкогольная полинейропатия.

Противопоказания

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

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

Период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

Внутривенно капельно.

Тяжелые формы диабетической или алкогольной полинейропатии

Один раз в сутки в виде внутривенных капельных инфузий 20 мл раствора в 250 мл изотонического раствора хлорида натрия (что соответствует 600 мг альфа-липоевой кислоты в сутки). Препарат рекомендуется применять в течение 2 – 4 недель. Растворы для инфузий следует вводить в течение 50 минут.

Приготовленные растворы необходимо хранить в защищенном от света месте и использовать максимально в течение 6 часов после приготовления.

Далее следует перейти на поддерживающую терапию в форме таблеток в дозе 600 мг в сутки. Минимальный срок лечения таблетками – 3 месяца.

В некоторых случаях прием препарата предполагает более длительное применение, сроки которого определяются лечащим врачом.

Побочное действие

Нежелательные реакции классифицированы согласно классификации ВОЗ (Всемирной организации здравоохранения): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$) и частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных). Корреляции частоты возникновения нежелательных реакций с пожилым возрастом пациентов не наблюдается.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

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

Нарушения со стороны иммунной системы:

очень редко: аллергические реакции (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 метаболизма и питания:

очень редко: гипогликемия (из-за улучшения усвоения глюкозы), симптомы которой включают головокружение, повышенное потоотделение, головную боль 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: при быстром введении препарата возможны боль в области сердца, тахикардия.

Нарушения со стороны сосудов:

очень редко: тромбоз, флебит.

Желудочно-кишечные нарушения:

часто: тошнота, рвота;

очень редко: боль в животе, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

очень редко: повышение активности «печеночных» ферментов.

Общие нарушения и реакции 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 наблюдались самостоятельно проходящие повышение внутричерепного давления (чувство тяжести в голове) и затруднение дыхания, слабость.

Передозировка

Симптомы: головная боль, тошнота, рвота.

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

Лечение: при подозрении на передозировку тиоктовой кислотой (например, введение более 80 мг 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 передозировки должно приводиться 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

Тиоктовая кислота связывает металлы, поэтому ее не следует назначать одновременно с препаратами, содержащими металлы.

При одновременном применении с инсулином и пероральными гипогликемическими средствами наблюдается усиление гипогликемического эффекта.

Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота образует с молекулами сахара (например, раствор левулозы) трудно растворимые комплексные соединения, следовательно, несовместима с раствором глюкозы, фруктозы и декстрозы, раствором Рингера, а также с соединениями, взаимодействующими с дисульфидными и SH-группами.

Тиоктовая (альфа-липоевая) кислота (в виде раствора для инфузий) приводит к снижению эффективности цисплатина.

Особые указания

У пациентов с сахарным диабетом, особенно в начале лечения, необходим постоянный контроль концентрации глюкозы в плазме крови. В отдельных случаях требуется снижение дозы гипогликемических средств. При развитии гипогликемии и при ее симптомах (головокружение, повышенное потоотделение, головная боль, расстройство зрения, тошнота) следует немедленно прекратить введение препарата.

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

Во время лечения необходимо строго воздерживаться от употребления алкоголя, так как терапевтический эффект тиоктовой (альфа-липоевой) кислоты ослабляется при воздействии алкоголя, а также является фактором риска развития и прогрессирования нейропатии.

При появлении симптомов повышенной чувствительности следует немедленно прекратить введение препарата.

Препарат является светочувствительным, поэтому ампулы следует доставать из упаковки только непосредственно перед использованием.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами специально не изучалось. Рекомендуется соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и другими механизмами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Концентрат для приготовления раствора для инфузий, 30 мг/мл.

По 10 мл в ампулы из светозащитного стекла I гидролитического класса.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ОАО «Фармстандарт-УфаВИТА», Россия, 450077, Республика Башкортостан,
г. Уфа, ул. Худайбердина, д. 28, тел./факс: (347) 272 92 85

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

ОАО «Фармстандарт-УфаВИТА», Россия
Республика Башкортостан, г. Уфа, ул. Худайбердина, д. 28,
тел./факс: (347) 272 92 85,
www.pharmstd.ru