

1. ДӘРІЛІК ПРЕПАРАТТЫҢ АТАУЫ

ИНСУЛИПОН, үлбірлі қабықпен қапталған таблеткалар, 300 мг және 600 мг

2. САПАЛЫҚ ЖӘНЕ САНДЫҚ ҚҰРАМЫ

2.1 Жалпы сипаттамасы

Тиокт (альфа-липой) қышқылы

2.2 Сапалық және сандық құрамы

Бір таблетканың құрамында

белсенді зат – 300.00 мг және 600.00 мг тиокт (альфа-липой) қышқылы

дәрілік препараттың құрамында бар екендігін ескеру керек қосымша заттар: 17.395 мг және 34.79 мг лактоза моногидраты, 15.000 мг және 30.000 мг натрий кроскармеллозасы, Opady® 200F210038 жасыл (2.95 % хинолинді сары, 0.27 % индигокармин, 0.12 % натрий гидрокарбонаты).

Қосымша заттардың толық тізімін 6.1. тармағынан қараңыз.

3. ДӘРІЛІК ТҮРІ

Үлбірлі қабықпен қапталған таблеткалар

Ұзынша пішінді, екі беті дөңес, сары-жасыл түсті үлбірлі қабықпен қапталған таблеткалар.

4. КЛИНИКАЛЫҚ ДЕРЕКТЕРІ

4.1 Қолданылуы

Ересектердегі шеткері (сенсомоторлық) диабеттік полинейропатия симптомдарын емдеу үшін.

4.2 Дозалану режимі және қолдану тәсілі

Дозалану режимі

Ұсынылатын дозасы: тәулігіне 600 мг тиокт қышқылы. Бүкіл тәуліктік дозасын ең алғашқы ас ішуге дейін 30 минут бұрын (аш қарынға) қабылдау керек, әсіресе, бұл асқазанының босау жылдамдығы төмен пациенттерге қатысты. Инсулипонды тамақтану кезінде қабылдау тиокт қышқылының сіңуін төмендетуі мүмкін. Таблеткаларды тұтастай, шайнамай, жеткілікті мөлшердегі сұйықтықпен ішіп жұту керек.

Диабеттік полинейропатия созылмалы ауру болып табылатындықтан, Инсулипонмен ұзағырақ емдеу қажет болуы мүмкін. Диабеттік полинейропатия еміне қант диабетінің сәйкесінше емі негіз болып табылады.

Аурудың ауыр симптомдары бар пациенттерге бастапқыда тиокт қышқылымен инфузиялық емді ұсынуға болады.

Пациенттердің ерекше топтары

Балалар

Инсулипонды балалар мен 18 жасқа дейінгі жасөспірімдерде қолдануға болмайды.

4.3 Қолдануға болмайтын жағдайлар

- тиокт қышқылына немесе 6.1 бөлімінде атап келтірілген қосымша заттардың кез келгеніне аса жоғары сезімталдық
- балалар мен 18 жасқа дейінгі жасөспірімдерге
- жүктілік және лактация кезеңі

4.4 Айрықша нұсқаулар және қолдану кезіндегі сақтандыру шаралары

Тиокт қышқылын қабылдап жүрген пациенттердегі аутоиммундық инсулиндік синдром (АИС) жағдайлары туралы хабарланған. HLA белгілі бір генотипі (адамның лейкоциттік антигендері жүйесі) бар, мысалы, HLA-DRB1*04:06 және HLA-DRB1*04:03 сияқты

аллельдері бар пациенттер, тиокт қышқылымен емдеген кезде АИС дамуына бейім келеді. HLA-DRB1*04:03 аллелі (АИС-ке бейімділік, мүмкіндіктерінің арақатынасы 1,6 кұрайды) еуропалық ақ нәсіл өкілдерінде жиі кездеседі, Солтүстік Еуропадағыға қарағанда, Оңтүстік Еуропада таралуы анағұрлым жоғарырақ; HLA-DRB1*04:06 аллелі (АИС-ке бейімділік, мүмкіндіктерінің арақатынасы 56,6 кұрайды) көбінесе жапондықтар мен корейлықтарда кездеседі.

Тиокт қышқылын қабылдап жүрген пациенттерде тосыннан болған гипогликемияның дифференциалдық диагностикасы кезінде АИС ескеру керек (4.8 бөлімін қараңыз).

Инсулипонды қабылдағаннан кейін несептің иісі өзгеруі мүмкін, мұның клиникалық тұрғыдан маңызы жоқ.

Қосымша заттар

Инсулипонның құрамында лактоза бар, сондықтан, фруктозаның, галактозаның және т.б. жақпаушылығымен сипаталатын сирек тұқым қуалайтын аурулары, мысалы, лактаза жеткіліксіздігі немесе глюкоза-галактоза мальабсорбциясы бар пациенттер бұл дәрілік препаратты қабылдамауы керек.

Инсулипонның құрамында бір таблеткасында 1 ммольден аз натрий (23 мг) бар, яғни, іс жүзінде «натрийсіз».

Инсулипонның құрамында Хинолинді сары және Индигокармин бояғыштары бар, сондықтан, балаларда қолдану ұсынылмайды.

4.5 Басқа дәрілік заттармен өзара әрекеттесуі және өзара әрекеттесудің басқа түрлері

Тиокт қышқылын пайдаланғанда действия инсулиннің және қантты төмендетін пероральді дәрілердің гипогликемиялық әсері күшеюі мүмкін, сондықтан, әсіресе, Инсулипонмен емдеудің бастапқы сатыларында, қан плазмасындағы глюкоза деңгейін мұқият бақылау ұсынылады. Гипогликемия дамуын болдырмау үшін, жекелеген жағдайларда инсулиннің және қантты төмендетін дәрілердің дозаларын азайту қажет болуы мүмкін.

Тиокт қышқылы металдардың иондарын байланыстырады, сондықтан оны металдар қосылыстарымен (құрамында темір, магний бар препараттармен; сүт өнімдерімен, өйткені олардың құрамында кальций бар) бір мезгілде қабылдамау керек. Егер Инсулипонның тәуліктік дозасы таңғы асқа дейін 30 минут бұрын қабылданса, онда құрамында темір немесе магний бар препараттарды түсте немесе кешкілік қабылдау керек.

Тиокт қышқылымен бір мезгілде қолданылғанда цисплатиннің тиімділігі төмендейді. Жүйелі түрде алкоголь тұтыну нейропатияның клиникалық симптомдарының дамуы мен үдеуіндегі елеулі қауіп факторы болып табылады және тиокт қышқылымен емдеудің тиімділігіне теріс ықпал етуі мүмкін. Сондықтан, диабеттік полинейропатиясы бар пациенттерге Инсулипонмен емделу кезінде де, емдеу курстары арасындағы кезеңдерде де алкогольді пайдаланбау ұсынылады.

4.6 Фертильділік, жүктілік және лактация.

Жүктілік немесе бала емізу

Жануарларға жүргізілген зерттеулерден, тиокт қышқылы репродуктивтік функция тікелей, не болмаса жанама теріс ықпалын тигізбейтіндігі анықталды (5.3 бөлімін қараңыз). Инсулипонды жүктілік кезінде қолдану ұсынылмайды.

Тиокт қышқылының/оның метаболиттерінің емшек сүтімен бөлініп шығатындығы туралы деректер жоқ. Инсулипонды бала емізу кезінде қолдану ұсынылмайды.

Фертильділік

Репродуктивтік уыттылығын зерттеулерден тиокт қышқылының фертильділікке қандайда бір әсерлері анықталған жоқ.

4.7 Көлік құралдарын және қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсері
Инсулипон автокөлік жүргізу және механизмдерді басқару қабілетіне теріс әсерін тигізуі мүмкін. Ешгер дәрілік препаратты пайдаланудың нәтижесінде бас айналуы және орталық жүйке жүйесі тарапынан басқа жағымсыз реакциялар туындаса, автокөлік пен механизмдерді басқарудан тартыну керек.

4.8 Жағымсыз реакциялар

Жағымсыз реакциялар жиілігінің сандық критерийлері және жағымсыз реакциялардың жүйе-ағза жіктемесі мен туындау жиіліктеріне сәйкес жіктелуі (*Жағымсыз құбылыстардың жиілігін анықтау келесі критерийлерге сәйкес жүргізіледі: өте жиі ($\geq 1/10$), жиі ($\geq 1/100 - < 1/10$ дейін), жиі емес ($\geq 1/1000 - < 1/100$ дейін), сирек ($\geq 1/10000 - < 1/1000$), өте сирек ($< 1/10000$), белгісіз (қолда бар деректердің негізінде бағалау мүмкін емес)*

Иммундық жүйе тарапынан: өте сирек – бөртпе, есекжем және қышыну сияқты аллергиялық реакциялар; жиілігі белгісіз – АИС (4.4 бөлімін қараңыз).

Зат алмасу мен тамақтану тарапынан: өте сирек – гипогликемия*.

Жүйке жүйесі тарапынан: жиі – бас айналуы*; өте сирек – дисгевзия, бас ауыруы*, гипергидроз*.

Көру мүшесі тарапынан: өте сирек – көру анықтығының бұзылуы*.

Асқазан-ішек жолы тарапынан: жиі – жүрек айнуы; өте сирек – құсу, асқазан мен ішектің ауыруы, диарея.

* Бас айналуы, тершеңдік, бас ауыруы және көру анықтығының бұзылуы сияқты симптомдар туралы хабарланды, оларға глюкоза утилизациясының жеделдеуі салдарынан басталған гипогликемия түрткі болған.

Күдікті жағымсыз реакциялар туралы хабарлама

ДП «пайда-қауіп» арақатынасының үздіксіз мониторингін қамтамасыз ету мақсатында ДП тіркелгеннен кейін күдікті жағымсыз реакциялар туралы хабарлау маңызды. Медицина қызметкерлеріне ҚР жағымсыз реакциялары туралы ұлттық хабарлау жүйесі арқылы ДП кез келген күдікті жағымсыз реакциялары туралы хабарлау ұсынылады.

«Дәрілік заттар мен медициналық бұйымдарды сараптау ұлттық орталығы» ШЖҚ РМК

<http://www.ndda.kz>

Сондай-ақ, «РИН Фарм» ЖШС, Алматы, Сүйінбай д-лы 222-б

Ұялы тел +7 701 786 33 98.

e-mail: pypharma@worldmedicine.kz

4.9 Артық дозалануы

Симптомдары

Тиокт қышқылы артық дозаланған кезде жүрек айнуы, құсу және бас ауыруы дамиды. 10 г-ден 40 г дейінгі дозалардағы тиокт қышқылын байқаусызда немесе қасақана (суицид мақсатында), әсіресе, алкогольмен бірге қабылдау, айқын, кейде өлімге соқтыратын уыттануды туғызады. Уыттанудың клиникалық көрінісі бастапқыда психомоторлық қозу мен сананың шатасуы түрінде көрініс беруі мүмкін, кейіннен олар, әдетте, жайылған құрысу ұстамалары мен лактоацидоздың дамуымен қатар жүреді. Тиокт қышқылының жоғары дозаларымен уыттанудың салдарынан туындаған гипогликемия, шок, рабдомиолиз, гемолиз, диссеминацияланған тамырішілік қан ұюы синдромы, сүйек кемігінің депрессиясы және көпағзалық жеткіліксіздік сияқты симптомдар туралы хабарламалар бар.

Емі

Артық дозаланғандығына күдік туындаған жағдайда, мысалы, ересектерде дәрілік препараттың 600 мг-ден 10 таблеткасынан артық қабылданғанда немесе тиокт қышқылы балаларда кг дене салмағына 50 мг-ден артық дозаларда қабылданғанда, дереу

ауруханағажатқызып, артынша улануларды емдеудің жалпы қағидаларына (жасанды жолмен құстыру, асқазанды шаю, белсендірілген көмірді қабылдау және т.б.) сәйкес уытсыздандыру шараларын жүргізу қажет. Қажеттілігіне қарай, заманауи қарқынды емдеу қағидаларына сәйкес, жайылған құрысулардың, лактоацидоздың және уыттанудың өмірге қауіп төндіретін басқа салдарының симптоматикалық емі жүргізіледі. Тиокт қышқылының организмнен шығарылуын жеделдету үшін гемодиализді, гемоперфузияны немесе гемофилтрацияны пайдаланудың тиімділігі расталмаған.

5. ФАРМАКОЛОГИЯЛЫҚ ҚАСИЕТТЕРІ

5.1. Фармакодинамикалық қасиеттері

Фармакотерапиялық тобы: Ас қорыту жолы және зат алмасу. Ас қорыту жолының ауруларын және зат алмасу бұзылуларын емдеуге арналған басқа препараттар. Тиокт қышқылы.

АТХ коды: А16АХ01.

Тиокт қышқылы – альфа-кетоқышқылдардың тотығумен жүретін декарбоксилденуі үдерісіне қатысатын, кофермент функциялары бар дәрумен тәрізді эндогендік субстрат. Стрептозоцинді енгізу арқылы қант диабеті туындатылған (бұл жағдайдағы биохимиялық өзгерістер адамдағы осындайлармен ұқсас) егеуқұйрықтарға жүргізілген зерттеулерден, тиокт қышқылы қан жүретін тамырлардың матрицалық ақуыздарының гликозилденуінің ақырғы өнімдерінің түзілуін азайтатындығы, эндоневральді қан ағымын жақсартатындығы және нейрондардағы табиғи антиоксидант глутатионның мөлшерін арттырудың есебінен бос радикалдар мөлшерінің жоғарылауы және олардың жүйке жасушаларын зақымдайтын әсері түрткі болған эндоневральді гипоксияны/ишемияны басатындығы анықталды.

Жоғарыда көрсетілген деректер, тиокт қышқылы шеткері жүйкелердің функционалдық жай-күйінің жақсаруына ықпал етеді деген болжам жасауға мүмкіндік береді. Бұл диабеттік полинейропатия кезіндегі дизестезия және парестезия сияқты сенсорлық бұзылыстарға қатысты; оның көріністері ашыту, шаншу сезімі, ауыру және ұю болуы мүмкін.

Тиокт қышқылын диабеттік полинейропатиясы бар пациенттерде симптоматикалық ем ретінде пайдаланғанда, оның ашыту сезімі, және ауыру сияқты парестезия симптомдарына оң ықпал еткені анықталды.

5.2 Фармакокинетикалық қасиеттері

Сіңірілуі

Ішке қабылдағанда тиокт қышқылы асқазан-ішек жолында жылдам сіңеді. Тиокт қышқылы елеулі жүйеалдылық элиминацияға ұшырайтындығына байланысты, оның абсолюттік биожетімділігі 20%ға жуықты құрайды (вена ішіне енгізілуімен салыстырғанда).

Таралуы

Тиокт қышқылының қатты пероральді дәрілік түрлерінің салыстырмалы биожетімділігі 60%-дан астамды құрайды (сұйық пероральді түрлерімен салыстырғанда). Ол организм тіндеріне жылдам таралады, оның жартылай шығарылу кезеңі шамамен 25 минут. Қан плазмасындағы ең жоғарғы концентрациясы 4 мкг/мл құрайды және оған құрамында 600 мг тиокт қышқылы бар 1 таблеткасын қабылдағаннан кейін шамамен 30 минуттан соң жетеді.

Биотрансформациясы

Метаболизмінің негізгі жолдары бүйірлік тізбегінің тотығуы (бета-тотығу) және/немесе тиолдық топтардың S-метилденуі болып табылады.

Элиминациясы

Тиокт қышқылы бүйрек арқылы, көбінесе метаболиттері түрінде (80-90%), болар-болмас мөлшері – өзгеріссіз күйінде шығарылады.

5.3 Клиникаға дейінгі қауіпсіздік деректері

Жедел және созылмалы уыттылығы

Жануарларда жүргізілген зерттеулерден, тиокт қышқылы вегетативтік және орталық жүйке жүйесіне уытты әсер беретіндігі анықталды. Бірнеше рет енгізгеннен кейін негізінен, бауыр мен бүйрек тарапынан уытты әсерлері байқалды.

Мутагенділігі мен канцерогенділігі

Тиокт қышқылының мутагенділік ықтималдылығын зерттеуде гендік және хромосомалық мутацияларының белгілері анықталмады.

Егеуқұйрықтардағы канцерогенділік ықтималдылығын зерттеулерден тиокт қышқылын пероральді енгізгенде канцерогенділік белгілері анықталмады, канцероген N-нитрозодиметиламинмен салыстыру зерттеуінде теріс нәтижелер алынды.

Репродуктивтік уыттылығы

Тиокт қышқылы егеуқұйрықтарда фертильділікке және эмбриондарының бастапқы дамуына әсер етпейді (ішке енгізуге арналған ең жоғарғы дозасы 68,1 мг/кг құраған).

Үй қояндарына жүргізілген зерттеулерде тиокт қышқылын ұрғашылары үшін уыттысынан төмен дозаларда вена ішіне енгізгенде, шараналарында ешқандай даму ақаулары анықталған жоқ.

6. ФАРМАЦЕВТИКАЛЫҚ ҚАСИЕТТЕРІ

6.1. Қосымша заттардың тізбесі

Лактоза моногидраты

Сусыз коллоидты кремнийдің қостотығы

Симетикон 100 %

Натрий кроскармеллозасы

Микрокристалды целлюлоза

Гипромеллоза

Магний стеараты

Тазартылған су

Қабығының құрамы: Opadry® 200F210038 жасыл (поливинил спирті, тальк, титанның қостотығы (E171), макрогол, метакрил қышқылы сополимері, хиолинді сары (E104), индигокармин (E132), натрий гидрокарбонаты).

6.2. Үйлесімсіздігі

Тиокт қышқылы ионсыздандырылған металдар кешендерімен (мысалы, цисплатинмен) *in vitro* өзара әреттеседі, сондай-ақ, ол көмірсулармен (мысалы, фруктозамен) нашар еритін кешендер түзеді.

6.3 Жарамдылық мерзімі

3 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

6.4 Сақтау кезіндегі айрықша сақтандыру шаралары

Түпнұсқалық қаптамасында 25° С-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

6.5 Шығарылу түрі және қаптамасы

Поливинилхлорид/поливинилдихлорид (ПВХ/ПВДХ) үлбір мен баспалы алюминий фольдан жасалған пішінді ұяшықты қаптамаға 10 таблеткадан салынған.

Пішінді ұяшықты 3 қаптама медициналық қолдану жөніндегі қазақ және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынады

6.6 Пайдаланылған дәрілік препаратты немесе дәрілік препаратты қолданудан немесе онымен жұмыс істеуден кейін алынған қалдықтарды жою кезіндегі айрықша сақтандыру шаралары.

Пайдаланылмаған кез келген өнім немесе қалдықтарын жергілікті талаптарға сәйкес утилизациялау керек.

6.7 Дәріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы.

7. ТІРКЕУ КУӘЛІГІНІҢ ҰСТАУШЫСЫ

«Уорлд Медицин Лтд»,

Бербути к-сі, 10 / Алмасиани к-сі, 19-21, 26 кеңсе (II корп.), Тбилиси, Грузия

Тел: + 995 32 2 21 28 12, факс: + 995 32 2 21 28 13,

worldmedicine.llc.geo@gmail.com

7.1. ТІРКЕУ КУӘЛІГІН ҰСТАУШЫСЫНЫҢ ӨКІЛІ

Тұтынушылардың шағымдарын мына мекенжайға жолдау керек:

«РИН Фарм» ЖШС, Алматы қ., Сүйінбай д-ы, 222 б

Тел/факс: 8 (7272) 529090

rin_pharma@mail.ru

8. ТІРКЕУ КУӘЛІГІНІҢ НӨМІРІ

ҚР-ДЗ-5№

9. БАСТАПҚЫ ТІРКЕЛГЕН (ТІРКЕУДІ, ҚАЙТА ТІРКЕУДІ РАСТАУ) КҮНІ

10. МӘТІНІ ҚАЙТА ҚАРАЛҒАН КҮН

Дәрілік препараттың жалпы сипаттамасы <http://www.ndda.kz> ресми сайтында қолжетімді