**AILEEN**

**ACIDO TIOCTICO**

FORMULA:

AILEEN 300

Cada comprimido recubierto contiene:

Ácido Tióctico .....................................................................................300 mg

Excipientes.............................................................................................c.s.p.

AILEEN 600

Cada comprimido recubierto contiene:

Ácido Tióctico .....................................................................................600 mg

Excipientes.............................................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Antioxidante, Antineurítico.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

Propiedades farmacológicas.

El ácido tióctico es un co-factor esencial en los complejos multienzimáticos mitocondriales que catalizan la descarboxilación oxidativa de a-cetoácidos tales como piruvato, a-cetoglutarato y a-cetoácidos de cadena ramificada.

El ácido tióctico y su forma reducida, el ácido dihidrolipoico (DHLA), conforman principalmente un par redox ácido que actúa como un poderoso antioxidante lipofílico y barredor de los radicales libres que participan en el daño celular y tisular de los órganos comprometidos.

En la diabetes mellitus, la actividad de las enzimas piruvato deshidrogenasa y a-cetoglutarato deshidrogenasa que regulan la oxidación de la glucosa, se encuentra reducida. La administración de ácido tióctico mejora la actividad de dichas enzimas, estimulando la oxidación de la glucosa. Además, modifica el flujo capilar del músculo esquelético al mejorar la función endotelial por medio de la regeneración de la vitamina E y por si mismo, aumentando la liberación de sustrato al músculo.

El ácido tióctico redujo los niveles de glucemia durante la prueba de tolerancia oral a la glucosa. Estudios controlados muestran que es un fármaco efectivo para el tratamiento de la polineuropatia diabética, especialmente del dolor y de las parestesias, incrementando la microcirculación sanguínea endoneural y reduciendo el estrés oxidativo.

Propiedades farmacocinéticas

El acido tióctico consiste en una mezcla racémica de sus 2 enantíomeros R (+) y S(-)-a-LA. Esta mezcla es absorbida rápidamente cuando es administrada por vía oral. Su biodisponibilidad por esta vía es aproximadamente del 30%. Presenta un efecto inactivador de primer paso hepático. La presencia de alimentos disminuye su biodisponibilidad.

Su concentración plasmática pico se produce a los 40 minutos de su administración por vía oral. Su volumen aparente de distribución es aproximadamente de 400mL/kg. El área bajo la curva (ABC) es de aproximadamente 0,40 mcg/hora/mL. Su vida media de eliminación es de aproximadamente 40 minutos. Se elimina por biotransformación hepática. Su excreción es renal, siendo un pequeño porcentaje excretado sin modificar. Su principal metabolito es el S-metil-dihidro-bisnor-LA. Su eliminación depende del flujo plasmático hepático. No se acumula durante su administración por periodos prolongados. No induce ni inhibe a las enzimas hepáticas. El vaciado gástrico prolongado en la diabetes mellitus no afecta en forma sustancial la velocidad y la extensión de la absorción del ácido tióctico. La neuropatía autónoma gastrointestinal concomitante no requiere ajustes de la dosis. El ácido tióctico no deteriora las funciones hepáticas y renal. Por el contrario las mismas pueden mejorar cuando se hallan alteradas por estrés oxidativo. En caso de disfunción importante, la posología deberá adecuarse al cuadro clínico.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Trastornos de la sensibilidad nerviosa debido a polineuropatía diabética.

POSOLOGIA Y MODO DE USO:

La dosis depende del cuadro clínico y criterio del médico.

AILEEN 300: se recomienda administrar 300 mg a 600 mg media hora antes de cualquier ingesta, en una o en 2 tomas, sin masticar y con un poco de líquido,

AILEEN 600: Dosis usual: Ingerir sin masticar, 600 mg/día (1 comprimido recubierto) en una sola toma diaria, realizada lejos de las comidas (preferentemente por la mañana y en ayunas).

Dosis máxima: 1800 mg/día.

No tomar con leche ni otros derivados lácteos, tampoco con suplementos de hierro o antiácidos con sales de magnesio o aluminio (el ácido tióctico inhibe la acción de sustancias que contengan metales).

Duración del tratamiento: debido a que la neuropatía diabética es una enfermedad crónica, podría ser necesario el tratamiento a largo plazo. El médico tratante decidirá la duración del tratamiento para cada paciente en forma individual.

CONTRAINDICACIONES:

Este medicamento está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida a alguno de los componentes de la formulación.

No deberá ser utilizado en niños y adolescentes dado que no hay suficiente información clínica disponible para su administración en estos grupos etáreos.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Las bebidas alcohólicas o los medicamentos que contengan alcohol pueden disminuir el efecto terapéutico del ácido tióctico y por lo tanto no deben ingerirse durante el tratamiento.

Controlar la glucemia antes y durante el tratamiento, pues podría eventualmente ocurrir un descenso de la misma.

Advertencia sobre excipientes:

-Como estos medicamentos contienen lactosa, los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa de Lapp (insuficiencia observada en ciertas poblaciones de Laponia) o mala absorción de glucosa o galactosa no deben tomar estos medicamentos.

-Estos medicamentos contienen Almidón parcialmente Pregelatinizado proveniente del Maíz.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Puede disminuir la glucemia durante la administración de ácido tióctico como consecuencia del mejoramiento en la utilización de glucosa. Se han descripto síntomas de hipoglucemia incluyendo mareo, diaforesis, cefalea y alteraciones visuales.

En casos muy raros: (<0,01%), síntomas gastrointestinales, por ejemplo, náuseas, vómitos, dolor abdominal y diarrea.

De igual forma, se pueden observar reacciones de hipersensibilidad, incluyendo erupciones de la piel, urticaria y prurito. En casos muy raros, después de la administración oral, se ha reportado pérdida temporal del sentido del gusto.

Notificación de sospechas de reacciones adversas:

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a través del Sistema de Farmacovigilancia: farmacovigilancia@quimfa.com.py

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS Y ALIMENTOS:

Dadas las propiedades quelantes y reductoras, no se recomienda su administración conjunta con otros medicamentos.

La administración conjunta con cisplatino ocasiona la pérdida de la acción terapéutica de este último.

El alcohol reduce el efecto terapéutico del ácido tióctico. El consumo regular de alcohol puede interferir con el tratamiento, y representa tanto para la ocurrencia como la progresión de los cuadros clínicos de neuropatía, un factor de riesgo significativo. Por lo tanto, en los pacientes con polineuropatia diabética, se recomienda la abstención del consumo de alcohol, tanto como sea posible. Dichas recomendaciones son aplicables a los periodos intertratamiento.

La administración de ácido tióctico en pacientes diabéticos tratados con insulina o antidiabéticos orales, puede eventualmente originar hipoglucemia, circunstancia que requiere el control de la misma, pudiendo ser necesaria la disminución de la insulina o de los antidiabéticos orales.

El ácido tióctico es un quelante de metales por lo que no deberá ser administrado concomitantemente con compuestos metálicos (como por ejemplo, productos que contengan hierro, magnesio o productos lácteos, debido al contenido de calcio). Se deberá evitar la ingesta de estos productos durante las 2 horas previas y las 4 horas posteriores a la ingesta del ácido tióctico.

SOBREDOSIFICACION:

Después de la administración de dosis orales (premeditada o accidental) entre 10 y 40 g de ácido tióctico junto con alcohol, se han observado signos de intoxicación serios que pueden manifestarse como agitación psicomotriz o pérdida de la conciencia.

Convulsiones generalizadas y acidosis láctica, acompañan típicamente el curso de la intoxicación. De igual forma, entre las consecuencias de la intoxicación con altas dosis de ácido tióctico, se han descripto: hipoglucemia, rabdomiólisis, hemólisis, coagulación intravascular diseminada (CID), depresión de médula ósea, falla multiorgánica y estado de shock. No se conocen antídotos específicos.

Tratamiento orientativo inicial de la sobredosis: luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valorización del tiempo transcurrido desde la ingesta o administración, de la cantidad de tóxicos ingeridos y descartando la contraindicación de ciertos procedimientos, si existe sospecha de intoxicación con ácido tióctico (por ejemplo,>10 comprimidos recubiertos de 600 mg en adultos y > 50mg/Kg por peso corporal en niños), se requiere la hospitalización inmediata y el tratamiento general de rescate para los casos de intoxicación (por ejemplo, inducción de vómito, lavado gástrico, uso de carbón activado, etc)

El tratamiento de las convulsiones generalizadas, acidosis láctica y otras consecuencias de la intoxicación que amenacen la vida deberán orientarse según los principios de la terapia intensiva moderna y podrán ser sintomáticos.

Hasta el presente, no han sido confirmados los beneficios de la hemodiálisis, hemoperfusión o hemofiltración, a fin de acelerar la eliminación del ácido tióctico.

En caso de sobredosis o ingesta accidental, consultar al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

RESTRICCIONES DE USO:

Embarazo y Reproducción.

No existe aun suficiente experiencia clínica en mujeres embarazadas. En estos casos deberá evaluarse la relación riesgo-beneficio.

Lactancia

Por no ser conocido aun si el ácido tióctico pasa a la leche materna, no se recomienda su administración durante la lactancia.

Empleo en pediatría.

No se dispone de información sobre la administración de ácido tióctico en los niños.

No se dispone de información fehaciente respecto a la utilización de la forma farmacéutica comprimidos con 600 mg.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30 °C.

PRESENTACIONES:

AILEEN 300

Caja conteniendo 10 comprimidos recubiertos.

Caja conteniendo 20 comprimidos recubiertos.

Caja conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

Paquete de 100 cajas conteniendo 30 comprimidos recubiertos

(Presentación Hospitalaria).

AILEEN 600

Caja conteniendo 10 comprimidos recubiertos.

Caja conteniendo 20 comprimidos recubiertos.

Caja conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

Estos medicamentos deben ser utilizados únicamente por prescripción médica y no podrán repetirse sin nueva indicación del facultativo. En caso de uso de estos medicamentos sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quién lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma estos productos sin consultar a su médico.

Director Técnico: Q. F. Laura Ramírez

Reg. Prof. Nº 4.142

Autorizado por D.N.V.S.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS