ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ДІАЛІПОН®

(DIALIPON®)

Склад:

діюча речовина: thioctic acid;

1 капсула містить альфа-ліпоєвої кислоти 300 мг (0,3 г);

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, гіпромелоза (Е15), кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат.

Лікарська форма. Капсули.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули № 0. Корпус і кришечка капсули кольору слонової кістки (ivory). Вміст капсули – порошкоподібна гранульована суміш жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що впливають на систему травлення та метаболічні процеси. Код АТХ А16А Х01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тіоктова кислота – це ендогенна речовина, що за дією подібна до вітамінів, виконує функцію коферменту та бере участь в окиснювальному декарбоксилюванні а-кетокислот. Унаслідок гіперглікемії, що виникає при цукровому діабеті, відбувається приєднання глюкози до матричних білків кровоносних судин та утворення так званих «кінцевих продуктів прискореного гліколізування». Цей процес призводить до зниження ендоневрального кровотоку та ендоневральної гіпоксії/ішемії, що, у свою чергу, призводить до посиленого утворення кисневмісних вільних радикалів, які пошкоджують периферичні нерви. Також було відзначено зниження рівня антиоксидантів, таких як глютатіон, у периферичних нервах.

Фармакокінетика.

Після перорального застосування тіоктова кислота швидко абсорбується. У результаті значного пресистемного метаболізму абсолютна біодоступність тіоктової кислоти становить приблизно

20 %. Унаслідок швидкого розподілу у тканинах період напіврозпаду тіоктової кислоти у плазмі крові становить приблизно 25 хвилин. Відносна біодоступність тіоктової кислоти при пероральному застосуванні твердих лікарських форм становить понад 60 % пропорційно до питного розчину. Максимальна концентрація у плазмі крові приблизно 4 мкг/мл була виміряна приблизно через 30 хвилин після перорального застосування 600 мг тіоктової кислоти. У сечі виявляється лише незначна кількість речовини у незміненому стані. Біотрансформація здійснюється за рахунок окиснювального скорочення бокового ланцюга (β-окиснення) та/або S-метилюванням відповідних тіолів. Тіоктова кислота *in vitro* реагує з комплексами іонів металів, наприклад з цисплатином, та утворює помірно розчинні комплекси з молекулами цукрів.

Клінічні характеристики.

Показання.

Профілактика і лікування діабетичної полінейропатії.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до тіоктової кислоти або до будь-якого іншого компонента лікарського засобу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Ефективність цисплатину знижується при одночасному застосуванні з препаратом Діаліпон®. Тіоктова кислота є комплексоутворювачем металів, і тому, згідно з основними принципами фармакотерапії, її не слід застосовувати одночасно зі сполуками металів (наприклад, з харчовими добавками, що містять залізо або магній, з молочними продуктами, оскільки вони містять кальцій). Якщо загальну добову дозу препарату застосовувати за 30 хвилин до сніданку, то харчові добавки, що містять залізо та магній, слід застосовувати вдень або увечері.

При застосуванні тіоктової кислоти хворим на цукровий діабет можливе підсилення цукрознижувальної дії інсуліну та пероральних протидіабетичних засобів, тому, особливо на початковій стадії лікування, рекомендується ретельний контроль рівня цукру в крові. Для уникнення симптомів гіпоглікемії в окремих випадках може потребуватися зниження дози інсуліну або пероральних протидіабетичних засобів.

Етанол зменшує терапевтичну ефективність тіоктової кислоти.

Особливості застосування.

Головний чинник ефективного лікування діабетичної полінейропатії – оптимальна корекція рівня цукру у крові хворого. На початку лікування полінейропатії через регенераційні процеси можливе короткочасне посилення парестезій з відчуттям «повзання мурашок».

При застосуванні тіоктової кислоти хворим на цукровий діабет необхідний частий контроль

рівня глюкози у крові. В окремих випадках необхідно зменшити дози протидіабетичних препаратів, щоб запобігти розвитку гіпоглікемії.

Регулярне вживання алкогольних напоїв є значним фактором ризику розвитку та прогресування полінейропатії і може перешкоджати успіху в лікуванні, тому під час лікування і в періоди між курсами лікування слід уникати вживання алкоголю.

Діаліпон® містить лактозу, тому при встановленій непереносимості деяких цукрів необхідно проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Повідомлялося про випадки розвитку аутоімунного інсулінового синдрому (АІС) під час лікування тіоктовою кислотою. Пацієнти з генотипом людського лейкоцитарного антигену (алелі HLA-DRB1*04:06 і HLA-DRB1*04:03) більш схильні до розвитку АІС при лікуванні тіоктовою кислотою. Алелі HLA-DRB1*04:03 (коефіцієнт сприйнятливості до розвитку АІС – 1,6) особливо поширені у представників європеоїдної раси (в Південній Європі більше, ніж в Північній), а алелі HLA-DRB1*04:06 (коефіцієнт сприйнятливості до розвитку АІС – 56,6) особливо поширені у японських і корейських пацієнтів. АІС слід враховувати при диференціальній діагностиці спонтанної гіпоглікемії у пацієнтів, які застосовують тіоктову кислоту.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування тіоктової кислоти у період вагітності не рекомендується через відсутність відповідних клінічних даних.

Даних про проникнення тіоктової кислоти у грудне молоко немає, тому застосовувати її у період годування груддю не рекомендується.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Під час лікування необхідно дотримуватися обережності, керуючи автотранспортом, іншими механізмами або займаючись іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що вимагають підвищеної уваги і швидкості психомоторних реакцій, через можливість виникнення таких побічних реакцій, як гіпоглікемія (запаморочення та порушення зору).

Спосіб застосування та дози.

Дорослі. Добова доза становить 600 мг тіоктової кислоти (2 капсули препарату Діаліпон® 300 мг), яку слід приймати одноразово за 30 хвилин до першого вживання їжі. Капсули не розжовують і запивають достатньою кількістю рідини.

При інтенсивних парестезіях бажано розпочинати лікування з парентерального введення препарату Діаліпон®, розчину для ін’єкцій, протягом 2–4 тижнів. Надалі слід продовжити лікування з пероральним застосуванням препарату у дозі 600 мг 1 раз на добу.

Тривалість лікування визначає лікар залежно від характеру та перебігу захворювання.

Діти.

Препарат не слід призначати дітям, оскільки щодо цієї вікової категорії відсутній достатній досвід клінічного застосування.

Передозування.

При передозуванні можуть виникати нудота, блювання та головний біль. Після випадкового прийому або при спробі самогубства із пероральним застосуванням тіоктової кислоти у дозах від 10 г до 40 г у комбінації з алкоголем спостерігалися значні інтоксикації, у деяких випадках з летальним наслідком. На початковому етапі клінічна картина інтоксикації може проявлятися у психомоторному збудженні або у порушенні свідомості. Далі виникають генералізовані судоми та лактоацидоз. Крім цього, при інтоксикації великими дозами тіоктової кислоти були описані гіпоглікемія, шок, гострий некроз скелетних м'язів, гемоліз, синдром дисемінованого внутрішньосудинного згортання крові, пригнічення функції кісткового мозку та поліорганна недостатність.

Лікування. Навіть при підозрі на сильну інтоксикацію препаратом Діаліпон® (наприклад прийом понад 20 капсул по 300 мг для дорослих або доза понад 50 мг/кг маси тіла для дітей) рекомендується негайна госпіталізація та вживання заходів відповідно до загальних принципів при випадковому отруєнні (наприклад викликати блювання, промити шлунок, застосувати активоване вугілля). Симптоматичне лікування генералізованих судом, лактоацидозу та інших наслідків інтоксикації, що загрожують життю, слід проводити відповідно до принципів сучасної інтенсивної терапії. На цей час не підтверджена користь від застосування гемодіалізу, гемоперфузії або методів фільтрації з примусовим виведенням тіоктової кислоти.

Побічні реакції.

Класифікація частоти виникнення побічних реакцій:

дуже часто: ≥ 1/10;

часто: ≥ 1/100 – <1/10;

нечасто: ≥ 1/1000 – < 1/100;

рідко: ≥ 1/10000 – < 1/1000;

дуже рідко: <1/10000;

невідомо: на основі наявних даних визначити частоту неможливо.

З боку нервової системи.

Дуже рідко: зміна або порушення смакових відчуттів.

З боку травного тракту.

Часто: нудота.

Дуже рідко: блювання, біль у животі та гастроінтестинальний біль, діарея.

З боку метаболізму.

Дуже рідко: зниження рівня цукру в крові. Були повідомлення про скарги, які свідчать про гіпоглікемічні стани, а саме: запаморочення, підвищене потовиділення, головний біль та порушення зору.

З боку імунної системи.

Дуже рідко: алергічні реакції, у тому числі шкірні висипи, кропив'янка (уртикарні висипи), свербіж, утруднене дихання.

Невідомо: аутоімунний інсуліновий синдром.

Інші.

Невідомо: екзема.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 капсул у блістері. По 3 або 6 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. АТ «Фармак».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 04080, м. Київ, вул. Кирилівська, 74.