ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

АЛЬФА-ЛІПОН

(Alfa-lipon)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить альфа-ліпоєвої (тіоктової) кислоти 300 мг або 600 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; целюлоза мікрокристалічна; натрію кроскармелоза; крохмаль кукурудзяний; натрію лаурилсульфат; кремнію діоксид колоїдний безводний; магнію стеарат; *оболонка:* суміш для плівкового покриття Opadry II Yellow (лактоза, моногідрат; гіпромелоза (гідроксипропілметилцелюлоза); поліетиленгліколь (макрогол); індиготин (Е 132); жовтий захід FCF (Е 110); хіноліновий жовтий (Е 104); титану діоксид (Е 171); триацетин)).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

300 мг: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею, вкриті плівковою оболонкою жовтого кольору;

600 мг: таблетки довгастої форми з двоопуклою поверхнею, з рисками з двох сторін, вкриті плівковою оболонкою жовтого кольору.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тіоктова кислота є ендогенною вітаміноподібною речовиною, що виконує функцію коферменту та бере участь в окислювальному декарбоксилюванні α-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 окислювального скорочення бокового ланцюга (β-окислення) 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.

Парестезії при діабетичній полінейропатії.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до тіоктової кислоти або до будь-якого з компонентів лікарського засобу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Ефективність цисплатину зменшується при одночасному застосуванні з лікарським засобом Альфа-ліпон. Тіоктова кислота є комплексоутворювачем металів і тому, за 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 лікарського засобу застосовувати за 30 хвилин до сніданку, то харчові добавки, що містять залізо та магній, слід застосовувати у середині доби або ввечері. З молекулами цукру (наприклад з розчином фруктози) тіоктова (α-ліпоєва) кислота утворює важкорозчинні комплексні сполуки.

При застосуванні тіоктової кислоти пацієнтам із цукровим діабетом 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 знадобитися зниження дози інсуліну або пероральних протидіабетичних засобів.

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.

Особливості застосування.

На початку лікування полінейропатії через регенераційні процеси можливе короткочасне посилення парестезій з відчуттям «повзання мурашок». При застосуванні тіоктової кислоти у пацієнтів із цукровим діабетом необхідний частий контроль рівня глюкози у крові. В окремих випадках необхідно зменшити дози протидіабетичних лікарських засобів, щоб запобігти розвитку гіпоглікемії.

Зафіксовано випадки розвитку аутоімунного інсулінового синдрому (АІС) під час лікування тіоктовою кислотою. Пацієнти із певним генотипом відносно HLA (система людських лейкоцитарних антигенів), наприклад алелями HLA-DRB1*04:06 та HLA-DRB1*04:03, більш схильні до розвитку АІС при лікуванні тіоктовою кислотою. Алель HLA-DRB1*04:03 (співвідношення відносно можливої схильності до АІС – 1,6) переважно поширений серед представників європеоїдної раси, крім того, розповсюдженість у Південній Європі більша, ніж у Північній. Алель HLA-DRB1*04:06 (співвідношення відносно можливої схильності до АІС – 56,6) переважно поширений серед пацієнтів Японії та Кореї. Слід брати до уваги можливість розвитку АІС у пацієнтів, які застосовують тіоктову кислоту, при диференційованому діагнозі спонтанної гіпоглікемії (див. розділ «Побічні реакції»).

Лікарський засіб Альфа-ліпон містить лактозу, тому його не слід застосовувати пацієнтам із такими рідкісними спадковими захворюваннями, як непереносимість галактози, недостатність лактази або синдром недостатності всмоктування глюкози-галактози.

Барвник Е 110, що входить до складу оболонки таблетки, може спричиняти алергічні реакції.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

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

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

Фертильність. Дослідження щодо токсичного впливу на репродуктивну функцію не виявило ніяких доказів впливу на фертильність.

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.

Добова доза становить 600 мг тіоктової кислоти (2 таблетки по 300 мг або 1 таблетка по 600 мг), які слід застосовувати у вигляді одноразової дози за 30 хвилин до першого прийому їжі. Одночасне вживання їжі ускладнює всмоктування, тому пацієнтам, для яких характерне тривале спорожнення шлунка, особливо важливо ліки застосовувати до вживання їжі. Таблетки не розжовувати та запивати достатньою кількістю рідини, наприклад 1 склянкою води.

При інтенсивних парестезіях можна розпочинати лікування із парентерального введення тіоктової кислоти, застосовуючи відповідні лікарські форми.

Діти.

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

Передозування.

Симптоми. При передозуванні можуть виникати нудота, блювання та головний біль. Після випадкового застосування 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 затьмаренні свідомості. У подальшому виникають генералізовані судоми та лактоацидоз. Крім цього, при інтоксикації високими дозами тіоктової кислоти були описані гіпоглікемія, шок, рабдоміоліз, гострий некроз скелетних м’язів, гемоліз, синдром дисемінованого внутрішньосудинного згортання крові, пригнічення діяльності кісткового мозку та поліорганна недостатність.

Лікування. Навіть при підозрі на сильну інтоксикацію лікарським засобом Альфа-ліпон (наприклад, застосування понад 20 таблеток по 300 мг для дорослих або доза понад 50 мг/кг маси тіла у дітей) рекомендується негайна госпіталізація та вживання заходів при випадковому отруєнні (наприклад, викликання блювання, промивання шлунка, застосування активованого вугілля). Лікування генералізованих судом, лактоацидозу та інших наслідків інтоксикації, що загрожують життю, має бути симптоматичним та його слід здійснювати відповідно до принципів сучасної інтенсивної терапії. До цього часу не

підтверджена користь від застосування гемодіалізу, гемоперфузії або методів фільтрації з примусовим виведенням тіоктової кислоти.

Побічні реакції.

Для оцінки частоти виникнення побічних реакцій використовують таку класифікацію: дуже часто: ≥1/10; часто: ≥1/100 і <1/10; іноді: ≥1/1000 і <1/100; рідко: ≥1/10000 і <1/1000; дуже рідко: < 1/10000, частота невідома (неможливо оцінити на основі наявних даних).

З боку нервової системи: часто – запаморочення; дуже рідко – дисгевзія, головний біль, гіпергідроз, зміна або порушення смакових відчуттів.

З боку органів зору: дуже рідко – порушення зору.

З боку шлунково-кишкового тракту: часто – нудота; дуже рідко – блювання, біль у животі та гастроінтестинальний біль, діарея.

З боку метаболізму: дуже рідко – гіпоглікемія.

З боку імунної системи: дуже рідко – алергічні реакції, у тому числі шкірні висипи, кропив'янка (уртикарні висипи), свербіж, утруднене дихання; частота невідома – аутоімунний інсуліновий синдром (див. розділ «Особливості застосування»), екзема.

Загальні розлади: дуже рідко – зниження рівня глюкози в крові, що пов'язане із покращенням засвоєння глюкози. Симптоми, подібні до гіпоглікемічних: запаморочення, пітливість, головний біль та порушення зору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в пачці.

По 10 таблеток у блістері; по 6 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. АТ «КИЇВСЬКИЙ ВІТАМІННИЙ ЗАВОД».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

04073, Україна, м. Київ, вул. Копилівська, 38.