

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); індигодин (E 132); жовтий захід CF (E 110); хіноліновий жовтий (E 104); титану діоксид (E 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 ендogenous вітаміноподібною речовиною, що виконує функцію коферменту та бере участь в окислювальному декарбоксілюванні α -кетокислот. Унаслідок гіперглікемії, що виникає при цукровому діабеті, відбувається приєднання глюкози до матричних білків кровоносних судин та утворення так званих «кінцевих продуктів прискороного 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 глутатіон, 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-метильованням 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. 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.

Особливості застосування.

На початку лікування полінейропатії через регенераційні процеси можливе короточасне 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.

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.

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.

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.

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 для 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, 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.

З боку нервової системи: зміна або порушення смакових відчуттів.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, блювання, біль у животі та гастроінтестинальний біль, діарея.

З боку метаболізму: 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: алергічні реакції, у тому числі шкірні висипання, кропив'янка (уртикарні висипання), свербіж, утруднене дихання.

Інші: екзема (оцінка частоти виникнення не може бути проведена за наявними даними).

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

Для дози 300 мг. По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в пачці.

Для дози 600 мг. По 6 таблеток у блістері; по 5 блістерів у пачці.

По 10 таблеток у блістері; по 3 або 6 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПАТ «Київський вітамінний завод».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

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

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

АЛЬФА-ЛИПОН (ALFA-LIPON)

Состав:

действующее вещество: 1 таблетка содержит альфалипоевой (тиоктовой) кислоты 300 мг или 600 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат; целлюлоза микрокристаллическая; натрия кроскармеллоза; крахмал кукурузный; натрия лаурилсульфат; кремния диоксид коллоидный безводный; магния стеарат; *оболочка:* смесь для пленочного покрытия Opadry II Yellow (лактоза, моногидрат; гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза); полиэтиленгликоль (макрогол); индиготин (E 132); желтый закат FCF (E 110); хинолиновый желтый (E 104); титана диоксид (E 171); триацетин).

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства:

300 мг: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета;

600 мг: таблетки продолговатой формы с двояковыпуклой поверхностью, с рисками с двух сторон, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, влияющие на систему пищеварения и метаболические процессы. Код АТХ А16А Х01.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Тиоктовая кислота является эндогенным витаминоподобным веществом, которое выполняет функцию кофермента и принимает участие в окислительном декарбоксилировании α -кетокислот.

Вследствие гипергликемии, возникающей при сахарном диабете, происходит присоединение глюкозы к матричным белкам кровеносных сосудов и образование так называемых «конечных продуктов ускоренного гликолизирования». Этот процесс приводит к снижению эндоневрального кровотока и эндоневральной гипоксии/ишемии, что, в свою очередь, приводит к усиленному образованию кислородсодержащих свободных радикалов, повреждающих периферические нервы. Также было отмечено снижение уровня антиоксидантов, таких как глутатион, в периферических нервах.

Фармакокинетика.

После перорального применения тиоктовая кислота быстро абсорбируется. В результате значительного пресистемного метаболизма абсолютная биодоступность тиоктовой кислоты составляет приблизительно 20 %. Вследствие быстрого распределения в тканях период полураспада тиоктовой кислоты в плазме крови составляет приблизительно 25 минут. Относительная биодоступность тиоктовой кислоты при пероральном применении твердых лекарственных форм составляет свыше 60 % пропорционально питьевому раствору. Максимальная концентрация в плазме крови около 4 мкг/мл была измерена приблизительно через 30 минут после перорального применения 600 мг тиоктовой кислоты. В моче определяется лишь незначительное количество вещества в неизмененном состоянии. Биотрансформация осуществляется за счет окислительного сокращения боковой цепи (β-окисления) и/или S-метилированием соответствующих тиолов. Тиоктовая кислота *in vitro* реагирует с комплексами ионов металлов, например, с цисплатином, и образует умеренно растворимые комплексы с молекулами сахаров.

Клинические характеристики.

Показания.

Парестезии при диабетической полинейропатии.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к тиоктовой кислоте или к любому из компонентов лекарственного средства.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Эффективность цисплатина уменьшается при одновременном применении с лекарственным средством Альфа-липон. Тиоктовая кислота является комплексообразователем металлов и поэтому, по основным принципам фармакотерапии, ее не следует применять одновременно с соединениями металлов (например, с пищевыми добавками, содержащими железо или магний, с молочными продуктами, поскольку они содержат кальций). Если общую суточную дозу лекарственного средства применять за 30 минут до завтрака, то пищевые добавки, содержащие железо и магний, следует применять в середине суток или вечером. При применении тиоктовой кислоты пациентам с сахарным диабетом возможно усиление сахароснижающего действия инсулина и пероральных противодиабетических средств, поэтому, особенно на начальной стадии лечения, рекомендуется тщательный контроль уровня сахара в крови. Для избежания симптомов гипогликемии в отдельных случаях может потребоваться снижение дозы инсулина или пероральных противодиабетических средств.

Особенности применения.

В начале лечения полинейропатии из-за регенерационных процессов возможно кратковременное усиление парестезий с ощущением «ползания мурашек». При применении тиоктовой кислоты у пациентов с сахарным диабетом необходим частый контроль уровня глюкозы в крови. В отдельных случаях необходимо уменьшить дозы противодиабетических лекарственных средств, чтобы предотвратить развитие гипогликемии.

Регулярное употребление алкогольных напитков является значительным фактором риска развития и прогрессирования полинейропатии и может препятствовать успеху в лечении, поэтому во время лечения и в периоды между курсами лечения следует избегать употребления алкоголя.

Лекарственное средство Альфа-липон содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациентам с такими редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или синдром недостаточности всасывания глюкозы-галактозы. Краситель Е 110, входящий в состав оболочки таблетки, может вызывать аллергические реакции.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Применение тиоктовой кислоты в период беременности не рекомендуется из-за отсутствия соответствующих клинических данных. Данных о проникновении тиоктовой кислоты в грудное молоко нет, поэтому применять ее в период кормления грудью не рекомендуется.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Во время лечения необходимо соблюдать осторожность, управляя автотранспортом, другими механизмами или занимаясь другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и скорости психомоторных реакций, из-за возможности возникновения таких побочных реакций как гипогликемия (головокружение и нарушение зрения).

Способ применения и дозы.

Суточная доза составляет 600 мг тиоктовой кислоты (2 таблетки по 300 мг или 1 таблетка по 600 мг), которые следует принимать в виде однократной дозы за 30 минут до первого приема пищи. Одновременный прием пищи усложняет всасывание, поэтому пациентам, для которых характерно длительное опорожнение желудка, особенно важно лекарства применять до употребления пищи. Таблетки не разжевывать и запивать достаточным количеством жидкости, например, 1 стаканом воды. При интенсивных парестезиях можно начинать лечение с парентерального введения тиоктовой кислоты, применяя соответствующие лекарственные формы.

Дети.

Альфа-липон не следует назначать детям, поскольку для этой возрастной категории отсутствует достаточный опыт клинического применения.

Передозировка.

Симптомы. При передозировке могут возникать тошнота, рвота и головная боль. После случайного применения или при попытке самоубийства с пероральным приемом тиоктовой кислоты в дозах от 10 г до 40 г в комбинации с алкоголем наблюдались значительные интоксикации, в некоторых случаях – с летальным исходом.

На начальном этапе клиническая картина интоксикации может проявляться в психомоторном возбуждении или в помрачении сознания. В дальнейшем возникают генерализованные судороги и лактоацидоз. Кроме этого, при интоксикации высокими дозами тиоктовой кислоты были описаны гипогликемия, шок, острый некроз скелетных мышц, гемолиз, синдром диссеминированного внутрисосудистого свертывания крови, угнетение деятельности костного мозга и полиорганная недостаточность.

Лечение. Даже при подозрении на сильную интоксикацию лекарственным средством Альфа-липон (например, применение свыше 20 таблеток по 300 мг для взрослых или доза свыше 50 мг/кг массы тела у детей) рекомендуется немедленная госпитализация и принятие мер при случайном отравлении (например, вызывание рвоты, промывание желудка, применение активированного угля). Лечение генерализованных судорог, лактоацидоза и других последствий интоксикации, угрожающих жизни, должно быть симптоматическим и его следует осуществлять в соответствии с принципами современной интенсивной терапии. До настоящего времени не подтверждена польза от применения гемодиализа, гемоперфузии или методов фильтрации с принудительным выведением тиоктовой кислоты.

Побочные реакции.

Со стороны нервной системы: изменение или нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, боль в животе и гастроинтестинальная боль, диарея.

Со стороны метаболизма: снижение уровня сахара в крови. Были сообщения о жалобах, свидетельствующих о гипогликемических состояниях, а именно – головокружение, повышенное потоотделение, головная боль и нарушение зрения.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, в том числе кожная сыпь, крапивница (уртикарная сыпь), зуд, затрудненное дыхание.

Другие: экзема (оценка частоты возникновения не может быть проведена по имеющимся данным).

Срок годности. 2 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

Для дозы 300 мг. По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в пачке.

Для дозы 600 мг. По 6 таблеток в блистере; по 5 блистеров в пачке.

По 10 таблеток в блистере; по 3 или 6 блистеров в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Киевский витаминный завод».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.