

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЕСПА-ЛІПОН® 600 (ESPA-LIPON® 600)

Склад:

діюча речовина: thioctic acid (тіоктова кислота);

1 таблетка містить тіоктової кислоти 600 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, повідон целюлоза мікрокристалічна, целюлоза порошкоподібна, кремнію діоксид високодисперсний, кремнію діоксид осаджений, натрію крохмальгліколят (тип А), магнію стеарат, гіпромелоза, макрогол 6000, тальк, титану діоксид (Е 171), хіноліновий жовтий (Е 104).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки, вкриті оболонкою, довгастої форми, жовтого кольору з насічкою для розлому.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, що впливають на травну систему і метаболічні процеси. Кислота тіоктова.

Код АТХ А16А Х01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тіоктова кислота – це речовина, яка утворюється в організмі і виконує функцію кофермента при окислювальному декарбоксілюванні α -кетокислот. Спричинена цукровим діабетом гіперглікемія призводить до відкладання глюкози на матричних протеїнах кровоносних судин та утворення кінцевих продуктів прогресуючого глікозилювання. Цей процес призводить до зменшення ендоневрального кровотоку та ендоневральної гіпоксії/ішемії, пов'язаного з підвищеним утворенням вільних кисневих радикалів, які пошкоджують нерв, а також до збіднення у периферичних нервах такого антиоксиданту як глутатіон. У 1995 році було проведено багатоцентрове плацебоконтрольоване дослідження, направлене на вивчення ефективності застосування тіоктової кислоти для симптоматичного лікування діабетичної полінейропатії, в якому були отримані дані про сприятливі ефекти тіоктової кислоти на такі досліджувані симптоми, як парестезії, відчуття печіння, оніміння та біль.

Фармакокінетика.

Тіоктова кислота має високий ефект першого проходження у печінці. Існують суттєві міжособові відмінності в системній доступності тіоктової кислоти. Біотрансформація тіоктової кислоти відбувається шляхом окиснення бічних ланок та злиття. Виведення здійснюється переважно нирками.

У людей період напіввиведення у плазмі крові становить близько 25 хвилин, сумарний кліренс для плазми становить 10–15 мл/хв.кг. На момент завершення 30-хвилинної інфузії 600 мг визначений рівень у плазмі становить близько 20 мкг/мл. Шляхом радіоактивного маркування в ході досліджень на тваринах (щурі, собаки) було виявлено переважне виділення 80–90 % препарату у вигляді метаболітів. Також у людей спостерігається тільки невелика кількість незміненої речовини, що виводиться із сечею. Біотрансформація відбувається головним чином шляхом окиснювального скорочення бічних ланок (бета-оксидация) та/або S-метилування тіолових груп.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування діабетичної полінейропатії.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до тіоктової кислоти або до одного з інших компонентів препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Ефективність цисплатину знижується при одночасному застосуванні з препаратом. 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 препарату 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 хворим на цукровий діабет можливе посилення 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 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. Препарат містить лактозу, тому його не слід застосовувати хворим із такими рідкісними спадковими захворюваннями як непереносимість галактози, недостатність лактази або синдром недостатності всмоктування глюкози-галактози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування тіоктової кислоти у період вагітності та у період годування груддю через відсутність відповідних клінічних даних може бути рекомендоване тільки після ретельної оцінки користі та ризику.

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

Під час лікування необхідно дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом і заняття іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим застосовують внутрішньо по 1 таблетці препарату Еспа-ліпон[®] 600 (відповідає 600 мг тіоктової кислоти) 1 раз на добу.

Таблетки не розжовувати та запивати достатньою кількістю рідини, наприклад, склянкою води. Одночасне вживання їжі може вплинути на всмоктування лікарського засобу, тому важливо таблетки приймати натщесерце (за 30 хвилин до сніданку). Тривалість лікування визначає лікар в залежності від перебігу захворювання. Оскільки діабетична полінейропатія – хронічне захворювання, терапія може бути тривалою.

Діти.

Оскільки дані щодо безпеки та ефективності застосування дітям тіоктової кислоти відсутні, препарат не рекомендується призначати цій віковій категорії пацієнтів.

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 0 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 лактацидоз. 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. При підозрі на сильну інтоксикацію препаратом рекомендується негайна госпіталізація та

вживання заходів відповідно до загальних принципів при випадковому отруєнні (наприклад, викликання блювання, промивання шлунка, прийом активованого вугілля). Лікування генералізованих судом, лактацидозу та інших наслідків інтоксикації, що загрожують життю, слід виконувати відповідно до принципів сучасної інтенсивної терапії та воно має бути симптоматичним. До цього часу не підтверджена користь від застосування гемодіалізу, гемоперфузії або методів фільтрації з примусовим виведенням тіоктової кислоти.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: дуже рідко – зміна або порушення смакових відчуттів.

З боку травного тракту: дуже рідко – нудота, блювання, біль у животі та гастроінтестинальний біль, діарея.

Метаболічні порушення: 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, такі як шкірні висипання, кропив'янка (уртикарні висипання) та свербіж.

Інші: утруднене дихання, екзема, нездужання.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

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

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток, вкритих оболонкою, у блістері, по 3 блістери в картонній упаковці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Фарма Вернігероде ГмбХ.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Дорнбергсвег 35, 38855 Вернігероде, Німеччина.

Заявник.

Еспарма ГмбХ, Німеччина.

Місцезнаходження заявника.

Білефельдер Штрассе 1, 39171 Зюльцеталь, Німеччина.