

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Внимательно прочитайте эту инструкцию перед тем, как начать применение этого препарата, так как она содержит важную для Вас информацию.

Сохраняйте инструкцию, она может понадобиться вновь.

Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу.

Лекарственное средство, которым Вы лечитесь, предназначено лично для Вас, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии таких же симптомов, что и у Вас.

ЛОПЕРАМИД

Регистрационный номер: ЛП-005264

Торговое наименование: Лоперамид

Международное непатентованное наименование (МНН): лоперамид

Лекарственная форма: капсулы

Состав:

Одна капсула содержит:

Действующее вещество: лоперамида гидрохлорид – 2,0 мг.
Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) – 127,0 мг; крахмал кукурузный – 40,0 мг; тальк – 9,0 мг; магния стеарат – 2,0 мг.

Состав корпуса капсулы: краситель железа оксид красный – 0,0071 %; краситель железа оксид желтый – 0,1227 %; титана диоксид – 2,0000 %; желатин – до 100 %.

Состав крышечки капсулы: краситель хинолиновый желтый – 0,7500 %; краситель солнечный закат желтый – 0,0059 %; титана диоксид – 2,0000% ; желатин – до 100 %.

Описание: капсулы твердые желатиновые № 2. Корпус желто-бежевого цвета, крышечка желтого цвета, непрозрачные. Содержимое капсул - смесь порошка и гранул белого или белого с желтоватым оттенком цвета. Допускается уплотнение содержимого капсул в комки, по форме капсулы, легко разрушаемые при надавливании.

Фармакотерапевтическая группа: противодиарейное средство.

Код АТХ: А07DA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лоперамид, связываясь с опиоидными рецепторами в стенке кишечника, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, замедляя таким образом перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику. Повышает тонус анального сфинктера, уменьшая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

Фармакокинетика

Большая часть лоперамида всасывается в кишечнике, но вследствие активного пресистемного метаболизма системная биодоступность составляет примерно 0,3 %. Данные доклинических исследований свидетельствуют о том, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Связывание лоперамида с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) составляет 95 %.

Лоперамид преимущественно метаболизируется в печени, конъюгируется и выделяется с желчью. Окислительное N-деметилирование является основным путем метаболизма лоперамида и осуществляется преимущественно при участии изоферментов CYP3A4 и CYP2C8. Вследствие активного пресистемного метаболизма концентрация неизмененного лоперамида в плазме крови ничтожно мала.

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 часов, варьируя от 9 до 14 часов. Неизмененный лоперамид и его метаболиты выводятся преимущественно с калом.

Фармакокинетические исследования у детей не проводились. Ожидается, что фармакокинетика лоперамида и его взаимодействие с другими лекарственными препаратами будут аналогичны таковым у взрослых.

Показания к применению

Симптоматическое лечение острой и хронической диареи (генеза: аллергического, эмоционального, лекарственного, лучевого; при изменении режима питания и качественного состава пищи, при нарушении метаболизма и всасывания). В качестве вспомогательного лекарственного средства при диарее инфекционного генеза. Регуляция стула у пациентов с илеостомой.

Противопоказания

Лоперамид капсулы не следует применять у детей в возрасте до 6 лет.

Лоперамид противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к действующему веществу и/или любому из компонентов препарата.

Лоперамид капсулы противопоказаны при дефиците лактазы, непереносимости лактозы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Лоперамид противопоказан в первом триместре беременности.

Лоперамид не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Лоперамид нельзя применять в качестве основной терапии:

- у пациентов с острой дизентерией, которая характеризуется стулом с примесью крови и высокой температурой;
- у пациентов с язвенным колитом в стадии обострения;

- у пациентов с бактериальным энтероколитом, вызванным патогенными микроорганизмами, в том числе Salmonella, Shigella и Campylobacter;
- у пациентов с псевдомембранозным колитом, связанным с терапией антибиотиками широкого спектра действия.

Лоперамид не следует применять в случаях, когда замедление перистальтики нежелательно из-за возможного риска развития серьезных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона.

Лоперамид необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

С осторожностью

Лоперамид следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени вследствие замедленного пресистемного метаболизма.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение во время беременности

Данные о том, что лоперамид обладает тератогенным или эмбриотоксическим действием, отсутствуют. Препарат противопоказан в первом триместре беременности. В период беременности лоперамид не рекомендуется применять без консультации с лечащим врачом.

Препарат можно назначать только в том случае, если предполагаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Применение во время грудного вскармливания

Небольшое количество лоперамида может проникать в грудное молоко, поэтому лоперамид не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь, запивая водой.

Взрослые и дети старше 6 лет:

Острая диарея: начальная доза - 2 капсулы (4 мг) для взрослых и 1 капсула (2 мг) для детей, далее по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула.
Хроническая диарея: начальная доза - 2 капсулы (4 мг) в сутки для взрослых и 1 капсула (2 мг) для детей; далее начальная доза должна быть откорректирована таким образом, чтобы частота нормального стула составляла 1-2 раза в сутки, что обычно достигается при поддерживающей дозе от 1 до 6 капсул (2-12 мг) в сутки.

Максимальная суточная доза при острой и хронической диарее у взрослых - 8 капсул (16 мг); максимальная суточная доза у детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 капсулы на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 8 капсул (16 мг).

При нормализации стула или при отсутствии стула более 12 ч препарат отменяют.

Применение у детей

Не применять Лоперамид у детей до 6 лет.

Применение у пожилых пациентов

При лечении пожилых пациентов корректировка дозы не требуется.

Применение у пациентов с нарушениями функции почек

При лечении пациентов с нарушениями функции почек корректировка дозы не требуется.

Применение у пациентов с нарушениями функции печени

Хотя фармакокинетические данные у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких пациентов Лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»).

Если после лечения улучшения не наступает или симптомы усугубляются, или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом. Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

Побочное действие

Нежелательные реакции - это нежелательные явления, для которых следует считать доказанной причинно-следственную связь с применением лоперамида на основе всесторонней оценки имеющейся информации о нежелательном явлении.

По данным клинических исследований нежелательные реакции, наблюдавшиеся у >1 % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: сонливость, головокружение, головная боль, сухость во рту, боль в животе, тошнота, рвота, запор, дискомфорт и вздутие живота, боль в верхних отделах живота, сыпь.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у >1 % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головная боль, боль в животе, сухость во рту, дискомфорт в области живота, диспепсия.

По данным спонтанных сообщений о нежелательных реакциях нижеперечисленные нежелательные реакции классифицировали следующим образом: очень частые (>10 %), частые (>1 %, но <10 %), не частые (>0,1 %, но <1 %), редкие (>0,01 %, но <0,1 %) и очень редкие (<0,01 %, включая единичные сообщения).

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции, включая анафилактический шок, и анафилактоидные реакции.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко: нарушение координации, угнетение сознания, гипертонус, потеря сознания, сонливость, ступор.

Нарушения со стороны органа зрения: очень редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень редко: кишечная непроходимость (в том числе паралитическая кишечная непроходимость), мегаколон (в том числе токсической мегаколон).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко: ангионевротический отек, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса - Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и мультиформную эритему; зуд, крапивница.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко: задержка мочи.

Общие расстройства: очень редко: утомляемость.

Если после лечения улучшения не наступает или симптомы усугубляются, или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом. Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

Передозировка

Симптомы

При передозировке (в том числе при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочи, кишечная непроходимость, признаки угнетения центральной нервной системы (ЦНС): ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, гипертонус мышц, угнетение дыхания. Дети могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые.

Терапия

При появлении симптомов передозировки в качестве антидота можно использовать налоксон. Поскольку длительность действия лоперамида больше, чем налоксона (1-3 часа), может потребоваться повторное применение налоксона. Поэтому необходимо тщательно наблюдать за состоянием пациента в течение не менее 48 часов с целью своевременного обнаружения признаков возможного угнетения ЦНС.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

По данным доклинических исследований лоперамид является субстратом Р-гликопротеина.

При одновременном применении лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и хинидина или ритонавира, являющихся ингибиторами Р-гликопротеина, концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 2-3 раза. Клиническое значение описанного фармакокинетического взаимодействия с ингибиторами Р-гликопротеина при применении лоперамида в рекомендованных дозах неизвестно. Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 4 мг) и итраконазола, ингибитора изофермента CYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. При применении комбинации итраконазола и гемфиброзила пиковая концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 4 раза, а общая концентрация - в 13 раз. Это повышение не было связано с влиянием на ЦНС, что оценивалось по психомоторным тестам (т. е. субъективной оценке сонливости и тесту замены цифровых символов). Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и кетоконазола, ингибитора изофермента CYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к пятикратному повышению концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не было связано с увеличением фармакодинамического действия, оцененного по величине зрачка.

При одновременном пероральном приеме десмопрессина концентрация десмопрессина в плазме крови увеличилась в 3 раза, вероятно, из-за замедления моторики желудочно-кишечного тракта.

Ожидается, что препараты со схожими фармакологическими свойствами могут усиливать действие лоперамида,

а препараты, увеличивающие скорость прохождения через желудочно-кишечный тракт, могут уменьшать действие лоперамида.

Если Вы применяете вышеперечисленные или другие лекарственные препараты (в том числе безрецептурные) перед применением препарата Лоперамид проконсультируйтесь с врачом.

Особые указания

Лечение диареи препаратом Лоперамид носит только симптоматический характер. В тех случаях, когда возможно установить причину диареи, необходимо проводить соответствующую терапию.

У пациентов с диареей, особенно у детей, может иметь место потеря жидкости и электролитов. В таких случаях необходимо проводить соответствующую заместительную терапию (восполнение жидкости и электролитов).

При отсутствии эффекта после 2 суток лечения необходимо прекратить прием препарата, уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты со СПИДом, принимающие лоперамид для лечения диареи, должны прекратить прием препарата при первых признаках вздутия живота. Поступали единичные сообщения о запоре с повышенным риском развития токсического мегаколона у пациентов со СПИДом и инфекционным колитом вирусной и бактериальной этиологии, которым проводилась терапия лоперамидом.

Хотя данные о фармакокинетике лоперамида у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких пациентов лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма, поскольку это может привести к относительной передозировке и токсическому поражению ЦНС.

Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности - не выбрасывайте его в сточные воды и на улицу. Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения препаратом Лоперамид следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстрой психомоторных реакций, так как препарат может вызывать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

Форма выпуска

Капсулы 2 мг.

По 7 или 10 капсул в контурную ячеиковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 7, 10, 14, 20, 28, 30, 40, 50 или 100 капсул в банки из полиэтилентерефталата для лекарственных средств или полипропиленовые для лекарственных средств, укупоренные крышками из полиэтилена высокого давления с контролем первого вскрытия, или крышками полипропиленовыми с системой «нажать-повернуть», или крышками из полиэтилена низкого давления с контролем первого вскрытия.

Одну банку или 1, 2, 3, 4 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Держатель регистрационного удостоверения и производитель

Держатель РУ: **ООО «Атолл**», Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Производитель, ответственный за выпускающий контроль качества: **ООО «Озон»**, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Все претензии потребителей следует направлять представителю держателя регистрационного удостоверения: ООО «Озон»

445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail:ozon@ozon-pharm.ru