

Состав

действующее вещество: лоперамида гидрохлорида;

1 таблетка содержит лоперамида гидрохлорида в пересчете на 100% вещество - 2 мг;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, крахмал картофельный; кальция стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета, круглой формы, с плоской поверхностью, с фаской.

Фармакотерапевтическая группа

Препараты, подавляющие перистальтику.

Код АТХ А07D А03.

Фармакодинамика

Лоперамида гидрохлорид связывается с опиатными рецепторами кишечной стенки, в результате чего подавляется высвобождение ацетилхолина и простагландинов. Таким образом лоперамид замедляет пропульсивную перистальтику кишечника, а также увеличивает время прохождения кишечного содержимого через пищеварительный тракт и способность стенки кишечника к абсорбции жидкости.

Лоперамида гидрохлорид повышает тонус анального сфинктера, снижая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

Фармакокинетика

Абсорбция: большая часть лоперамида, принятого внутрь, абсорбируется в кишечнике, но в результате интенсивного метаболизма первого прохождения системная биодоступность составляет примерно лишь 0,3%.

Распределение: данные по высокой аффинности лоперамида относительно стенки кишечника с преимущественным связыванием с рецепторами

продольного слоя мышечной оболочки у крыс. Связывание лоперамида с белками составляет 95%, главным образом с альбумином. Есть данные, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина.

Метаболизм: лоперамид почти полностью экстрагируется печенью, где он преимущественно метаболизируется конъюгируется и выводится с желчью. Окислительное N-деметилирование является основным метаболическим путем лоперамида, этот процесс опосредуется главным образом изоформами CYP3A4 и CYP2C8. В результате очень интенсивного эффекта первого прохождения через печень концентрации неизмененного лекарственного средства в плазме крови остаются очень низкими.

Выведение: период полувыведения лоперамида у людей составляет примерно 11 часов с диапазоном 9-14 часов. Экскреция неизмененного лоперамида и его метаболитов в основном с калом.

Популяция пациентов детского возраста: информация о фармакокинетических параметрах у пациентов детского возраста отсутствует. Ожидается, что фармакокинетическое поведение лоперамида и взаимодействия лекарственных средств с лоперамидом будут аналогичны тем, которые наблюдаются у взрослых.

Показания

Симптоматическое лечение острой диареи у взрослых и детей старше 12 лет.

Симптоматическое лечение острых эпизодов диареи, обусловленной синдромом раздраженного кишечника, у взрослых в возрасте от 18 лет после установления первичного диагноза врачом.

Противопоказания

Лоперамид противопоказан:

- пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамида гидрохлорида или к любому из компонентов препарата;
- детям до 12 лет;
- пациентам с острой дизентерией, характеризующееся наличием крови в стуле и повышенной температурой тела;
- пациентам с острым язвенным колитом или псевдомембранозным колитом, связанным с применением антибиотиков широкого спектра действия;
- пациентам с бактериальным энтероколитом, вызванным микроорганизмами семей Salmonella, Shigella и Campylobacter.

Лоперамид вообще не следует применять, если надо избежать угнетения перистальтики из-за возможного риска возникновения значительных осложнений, включая кишечную непроходимость, мегаколон и токсический мегаколон.

Необходимо немедленно прекратить прием препарата, если развивается запор, вздутие живота или кишечная непроходимость.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Есть данные о случаях взаимодействия лоперамида с лекарственными препаратами, которые имеют подобные фармакологические свойства. Лекарственные препараты, оказывающие угнетающее действие на центральную нервную систему, не следует применять одновременно с приемом лоперамида детям.

Есть данные, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Одновременное назначение лоперамида (в дозе 16 мг) вместе с ингибиторами Р-гликопротеина (хинидин, ритонавир) приводило к повышению уровня лоперамида в плазме крови в 2-3 раза. Клиническое значение указанного фармакокинетического взаимодействия при применении лоперамида в рекомендованных дозах неизвестна.

Одновременное применение лоперамида (4 мг однократно) и итраконазола, ингибитора СYP3A4 и Р-гликопротеина приводило к 3-4-кратного увеличения концентраций лоперамида в плазме крови. Ингибитор СYP2C8 гемфиброзил повышает содержание лоперамида примерно в 2 раза. Комбинированное применение итраконазола и гемфиброзила приводит к 4-кратного увеличения максимального содержания лоперамида в плазме крови и 13-кратного увеличения общей экспозиции в плазме крови. Это повышение не было связано с влиянием на центральную нервную систему (ЦНС), который определялся с помощью психомоторных тестов (то есть субъективная сонливость и тест на замену цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (16 мг однократно) и кетоконазола, ингибитора СYP3A4 и Р-гликопротеина, приводило к 5-кратному повышению концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не было связано с увеличением фармакодинамических эффектов, определялось с помощью пупилометрии.

Сопутствующее лечение десмопрессинном для перорального применения приводило к трехкратному повышению концентрации десмопрессина в плазме

крови, вероятно, вследствие более медленной моторики желудочно-кишечного тракта.

Ожидается, что лекарственные средства с аналогичными фармакологическими свойствами могут усиливать действие лоперамида, а лекарственные средства, которые ускоряют прохождение пищи в желудочно-кишечном тракте, могут снижать его действие.

Особенности применения

Лечение диареи носит симптоматический характер. Если можно определить этиологию заболевания (или указано, что нужно это сделать), то по возможности следует проводить специфическое лечение.

У больных с диареей, особенно у детей, ослабленных пациентов, людей пожилого возраста может возникнуть дегидратация и дисбаланс электролитов. В таких случаях важнейшим мероприятием является применение заместительной терапии для пополнения жидкости и электролитов.

Применение препарата не заменяет введение соответствующего количества жидкости и восстановления электролитов.

Поскольку стойкая диарея может свидетельствовать про потенциально более серьезные состояния, лекарственное средство не следует применять длительное время, пока причина диареи не будет выяснена.

При острой диарее, когда не наблюдается клиническое улучшение в течение 48 часов, применение лоперамида гидрохлорида следует прекратить и обратиться к врачу.

Пациентам с синдромом приобретенного иммунодефицита, которые принимают лоперамид при диарее, необходимо немедленно прекратить лечение при появлении первых признаков вздутия живота. Есть данные о случаях кишечной непроходимости с повышенным риском появления токсического мегаколона у пациентов, больных СПИДом, с инфекционными колитами как вирусной, так и бактериальной этиологии, при лечении лоперамидом.

Злоупотребление лоперамидом или неправильное его применение в качестве опиоидного заменителя было описано у лиц с опиоидной зависимостью.

Хотя фармакокинетические данные для пациентов с нарушением функции печени отсутствуют, таким пациентам лоперамид следует применять с осторожностью из-за замедления метаболизма первого прохождения. Это лекарственное средство необходимо с осторожностью назначать больным с

нарушением функции печени, поскольку он может привести к относительной передозировки, что может привести токсическое поражение ЦНС.

Лекарственные препараты, продлевающие время прохождения, могут привести к развитию токсического мегаколон у пациентов этой группы.

Учитывая быстрый метаболизм лоперамида, а также на выведение лоперамида и его метаболитов с калом, обычно не требуется корректировать дозу препарата у пациентов с нарушением функции почек.

Поскольку препарат содержит лактозу, его не следует применять пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы Лаппа или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Для лоперамида не характерны выраженные кардиологические осложнения в пределах диапазона терапевтических концентраций. Но при существенном превышении этих значений (до 47 раз) лоперамид демонстрирует кардиологические осложнения: угнетение калиевого (hERG) и натриевого потоков и аритмии на животных моделях *in vivo* и *in vitro*.

В связи с передозировкой были зарегистрированы сердечные нарушения, включая удлинение интервала QT и комплекса QRS, пируэт тахикардия (*torsade de pointes*). Сообщалось также о летальных случаях. Передозировка может проявить имеющийся синдром Бругада. Пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и/или рекомендованную продолжительность лечения.

Если препарат принимать для контроля приступов диареи, обусловленной синдромом раздраженного кишечника, который был предварительно диагностирован врачом, и клинического улучшения не наблюдается в течение 48 часов, нужно прекратить применение лоперамида гидрохлорида и обратиться к врачу. Также следует обратиться к врачу, если характер симптомов изменился или повторяющиеся приступы диареи продолжаются более 2 недель.

Для лечения острых приступов диареи, обусловленной синдромом раздраженного кишечника, лоперамид следует принимать, только если врач предварительно диагностировал это заболевание.

В следующих случаях препарат не следует применять без предварительной консультации с врачом, даже если известно, что у пациента синдром раздраженного кишечника (СРК):

- возраст пациента 40 лет и с момента последнего нападения СПК прошло некоторое время;

- возраст пациента 40 лет и на этот раз симптомы СРК отличаются;
- недавняя кровотечение из кишечника;
- тяжелый запор;
- тошнота или рвота;
- потеря аппетита или уменьшение массы тела
- затрудненное или болезненное мочеиспускание;
- лихорадка;
- недавняя поездка за границу.

В случае новых симптомов, ухудшение или если клинический состояние не улучшилось в течение двух недель, следует обратиться к врачу.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Возможно возникновение повышения утомляемости, головокружения или сонливости при синдроме диареи при применении лоперамида гидрохлорида. Поэтому рекомендуется с осторожностью принимать этот препарат при управлении автомобилем или работе с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Не рекомендуется принимать этот препарат в период беременности. В связи с этим беременным женщинам и женщинам, которые кормят ребенка грудью, следует порекомендовать обратиться к врачу для получения соответствующего лечения.

Способ применения и дозы

Лоперамид не предназначен для начальной терапии серьезной диареи, сопровождающейся снижением уровней жидкости и электролитов. Наблюдается в эту потерю желательно компенсировать благодаря назначению заместительной терапии парентерально или перорально.

Таблетки следует принимать не разжевывая, запивая водой.

Симптоматическое лечение острой диареи у взрослых и детей старше 12 лет

Начальная доза - 2 таблетки (4 мг), в дальнейшем 1 таблетка (2 мг) после каждого следующего жидкого стула. Обычная доза составляет 3-4 таблетки (6-8 мг) в сутки. Максимальная суточная доза при острой диарее не должна превышать 6 таблеток (12 мг).

Симптоматическое лечение острых приступов диареи, обусловленной синдромом раздраженного кишечника, у взрослых в возрасте от 18 лет после установления первичного диагноза врачом

Начальная доза составляет две таблетки (4 мг) в дальнейшем принимать по 1 таблетке (2 мг) после каждого случая жидкого стула или согласно предварительным рекомендациям врача. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 таблеток (12 мг).

При острой диарее, если в течение 48 часов не наблюдается клинического улучшения, прием лоперамида следует прекратить.

Применение у больных пожилого возраста

Не требуется коррекция дозы для пациентов пожилого возраста.

При нарушениях функции почек

Не требуется коррекция дозы для пациентов с нарушением функции почек.

Дети

Препарат применять детям от 12 лет для симптоматического лечения острой диареи.

Передозировка

Симптомы.

В случае передозировки (включая относительная передозировка вследствие нарушения функции печени) может возникать угнетение центральной нервной системы (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания), задержка мочи и комплекс симптомов, подобных кишечной непроходимости.

Дети и пациенты с нарушением функции печени могут быть более чувствительными к воздействию на центральную нервную систему.

У лиц, которые превысили дозы лоперамида, наблюдались сердечные нарушения, такие как удлинение интервала QT и комплекса QRS, пируэт тахикардия (torsade de pointes), другие серьезные желудочковые аритмии, остановка сердца и обмороки.

У лиц, которые сознательно употребляли высокие дозы лоперамида (сообщалось о дозах от 40 до 792 мг в сутки), наблюдались остановка сердца, обмороки. Также

были зафиксированы летальные исходы. Передозировка может проявить имеющийся синдром Бругада.

Лечение.

В случае передозировки пациенту следует немедленно обратиться к врачу. В случае передозировки следует начинать мониторинг ЭКГ. Если появляются симптомы передозировки, как антидот можно применять налоксон. Поскольку продолжительность действия лоперамида больше, чем у налоксона (1-3 часа), может понадобиться повторное назначение налоксона. Для выявления возможного угнетения центральной нервной системы больной должен находиться под тщательным наблюдением не менее 48 часов.

Побочные реакции

Взрослые и дети старше 12 лет

Побочные реакции у пациентов с острой диареей, возникали с частотой от 1%, о которых сообщалось в исследованиях по безопасности лоперамида гидрохлорида:

Со стороны нервной системы: головная боль.

Со стороны пищеварительного тракта: запор, вздутие живота, тошнота.

Побочные эффекты, возникающие с частотой менее 1% в исследованиях по безопасности лоперамида гидрохлорида:

Со стороны нервной системы: головокружение.

Со стороны пищеварительного тракта: сухость во рту, метеоризм, боль и дискомфорт в животе, рвота, боль в верхней части живота, диспепсия.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь.

Постмаркетинговый опыт применения лоперамида гидрохлорида

Наблюдались следующие побочные эффекты, которые по частоте возникновения делятся следующим образом:

- очень часто ($\geq 1/10$);
- часто ($\geq 1/100$, $<1/10$);
- нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$);
- редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$);
- очень редко ($<1/10000$), включая отдельные сообщения.

Со стороны иммунной системы: очень редко - реакции повышенной чувствительности, анафилактические реакции (включая анафилактический шок) и анафилактоидные реакции.

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

Со стороны органа зрения: очень редко - миоз.

Со стороны ЖКТ: очень редко - кишечная непроходимость (включая паралитической кишечной непроходимости), мегаколон (включая токсический мегаколон).

Со стороны кожи и ее придатков: очень редко - ангионевротический отек, буллезная сыпь, синдром Стивенса-Джонсона, мультиформную эритема и токсический эпидермальный некролиз, крапивница и зуд.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: очень редко - задержка мочи.

Общие расстройства: очень редко - повышенная утомляемость.

Срок годности

4 года.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ОАО «Киевмедпрепарат».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).