

## **Состав**

*действующее вещество:* loperamide;

1 таблетка содержит лоперамида гидрохлорида 0,002 г;

*вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, магния стеарат, стеариновая кислота, повидон.

## **Лекарственная форма**

Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки от белого до белого с желтоватым оттенком цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Препараты, подавляющие перистальтику.

Код АТХ А07D А03.

## **Фармакодинамика**

Лоперамида гидрохлорид связывается с опиоидными рецепторами кишечной стенки. Вследствие этого угнетается высвобождение ацетилхолина и простагландинов, снижая таким образом пропульсивную перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по пищеварительному тракту, а также способность стенки кишечника к абсорбции жидкости. Лоперамида гидрохлорид увеличивает 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 около 0,3 %.

*Распределение:* результаты исследований по распределению лоперамида у крыс показывают высокую аффинность относительно стенки кишечника с преимущественным связыванием с рецепторами продольного слоя мышечной оболочки. Связывание лоперамида с белками составляет 95 %, главным образом с альбумином. Доклинические данные показали, что лоперамид является

субстратом Р-гликопротеина.

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

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

*Популяция пациентов детского возраста:* фармакокинетические исследования популяции пациентов детского возраста не проводились. Ожидается, что фармакокинетика лоперамида и взаимодействие лекарственных средств с лоперамидом будут аналогичны тем, которые наблюдаются у взрослых.

## **Показания**

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

Симптоматическое лечение острых эпизодов диареи, обусловленной синдромом раздраженного кишечника, у взрослых (с 18 лет) после установления первичного диагноза врачом.

## **Противопоказания**

Лоперамид противопоказан:

- пациентам с известной повышенной чувствительностью к лоперамида гидрохлориду или к любому из компонентов препарата;
- пациентам с острой дизентерией, характеризующейся наличием крови в испражнениях 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 семейств *Salmonella*, *Shigella* и *Campylobacter*.

Лоперамид вообще не следует применять, если нужно избежать угнетения перистальтики из-за 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**

Сообщалось о случаях взаимодействия с лекарственными препаратами, которые имеют подобные фармакологические свойства. Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему, не следует применять одновременно с Лоперамидом детям.

Доклинические данные показали, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Одновременное применение лоперамида (в дозе 16 мг) вместе с ингибиторами

Р-гликопротеина (хинидин, ритонавир) приводило к повышению уровня лоперамида в плазме крови в 2-3 раза. Клиническая значимость указанного фармакокинетического взаимодействия при применении лоперамида в рекомендованных дозах неизвестна.

Одновременное применение лоперамида (4 мг однократно) и итраконазола, ингибитора CYP3A4 и Р-гликопротеина, приводило к 3-4-кратному увеличению концентраций лоперамида в плазме крови. В этом же исследовании ингибитор CYP2C8 гемфиброзил повышал содержание лоперамида примерно в 2 раза. Комбинированное применение итраконазола и гемфиброзила приводило к 4-кратному увеличению максимального содержания лоперамида в плазме крови и 13-кратному увеличению общей экспозиции в плазме крови. Это повышение не было связано с влиянием на центральную нервную систему (ЦНС), которое определялось с помощью психомоторных тестов (то есть субъективная сонливость и тест на замену цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (16 мг однократно) и кетоконазола, ингибитора CYP3A4 и Р-гликопротеина, приводило к 5-кратному повышению концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не было связано с увеличением фармакодинамических эффектов, что определялось с помощью пупилометрии.

Сопутствующее лечение десмопрессином для перорального применения приводило к

3-кратному 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 транзит пищи по желудочно-кишечному тракту, могут снижать его действие.

## **Особенности применения**

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

У пациентов 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 о более серьезных состояниях, лекарственное средство не следует применять длительное время, пока причина диареи не будет исследована.

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. Существуют отдельные сообщения о случаях кишечной непроходимости с повышенным риском появления токсического мегаколона у пациентов, больных СПИДом, с инфекционными колитами как вирусного, так и бактериального происхождения, при лечении лоперамида гидрохлоридом.

Хотя фармакокинетические данные относительно пациентов с нарушением функции печени отсутствуют, таким пациентам Лоперамид следует применять с осторожностью по причине замедления метаболизма первого прохождения. Это лекарственное средство необходимо с осторожностью назначать больным с нарушением функции печени, поскольку оно может привести к относительной передозировке, что может вызвать токсическое поражение центральной нервной системы.

Лекарственные препараты, которые продлевают время прохождения, могут привести к развитию токсического мегаколона у пациентов этой группы.

Учитывая то, что лоперамид хорошо метаболизируется и неизмененное вещество или метаболиты выводятся с калом, обычно не требуется корректировать дозу лоперамида для 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.

Кардиологические осложнения, включая пролонгацию интервала QT и комплекса QRS, torsade de pointes, были зарегистрированы в связи с передозировкой. Некоторые случаи имели смертельный исход (см. раздел «Передозировка»). Передозировка может раскрыть существующий синдром Бругада. Пациенты не должны превышать рекомендованную 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 двух недель.

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

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

- возраст пациента от 40 лет и с момента последнего приступа СРК прошло некоторое время;
- возраст пациента от 40 лет и на этот раз симптомы СРК отличаются;
- недавнее 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 возникновения новых симптомов, ухудшения симптомов или если симптомы не уменьшились в течение двух недель, следует обратиться к врачу.

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

Возможно возникновение повышенной утомляемости, головокружения или сонливости во время применения 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 это лекарственное средство в период беременности. Беременным и женщинам, которые кормят ребенка грудью, следует обратиться к своему врачу для получения соответствующего лечения.

### **Способ применения и дозы**

Лоперамид не предназначен для начальной терапии серьезной диареи, сопровождающейся снижением уровней жидкости и электролитов. В частности у детей эту потерю желательно компенсировать при помощи парентеральной или пероральной заместительной терапии.

*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 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 (с 18 лет) после установления первичного диагноза врачом.*

Начальная доза составляет 2 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 для лечения больных пожилого возраста.*

Не требуется коррекция дозы для пациентов пожилого возраста.

*Применение при нарушении функции почек.*

Не требуется коррекция дозы для пациентов с нарушением функции почек.

*Применение при нарушении функции печени.*

Хотя фармакокинетические данные о действии препарата у пациентов с нарушением функции печени отсутствуют, таким пациентам нужно назначать Лоперамид с осторожностью из-за замедления у них метаболизма первого прохождения.

## **Дети**

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

## **Передозировка**

*Симптомы.*

В случае передозировки (включая относительную передозировку вследствие нарушения функции печени) может возникать угнетение центральной нервной системы (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания), задержка мочи и комплекс симптомов, схожих с кишечной непроходимостью.

Дети могут быть более чувствительны к воздействию на центральную нервную систему.

У пациентов, которые превысили дозы лоперамида, наблюдалась пролонгация интервала QT и комплекса QRS, torsade de pointes, другие серьезные желудочковые аритмии, остановка сердца, обмороки. Также были зафиксированы смертельные случаи. Передозировка может раскрыть существующий синдром Бругада.

*Лечение.*

В случае передозировки пациенту следует немедленно обратиться к врачу. Поскольку продолжительность действия Лоперамида больше, чем у налоксона (1-3 часа), может потребоваться повторное применение налоксона. Для выявления возможного угнетения центральной нервной системы больной должен

находиться под тщательным наблюдением не менее 48 часов.

## **Побочные реакции**

*Взрослые и дети с 12 лет.*

*Побочные эффекты у пациентов с острой диареей.*

Побочные эффекты, которые возникали с частотой от 1 %:

*Со стороны нервной системы: головная боль.*

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

Побочные эффекты, которые возникали с частотой менее 1 %:

*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.

Ниже указаны побочные эффекты, о которых поступали спонтанные сообщения, по частоте возникновения:

- 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 органов зрения: очень редко – миоз.*

*Со стороны пищеварительного тракта: очень редко – кишечная непроходимость (включая паралитическую кишечную непроходимость), мегаколон (включая токсический мегаколон).*



*Со стороны кожи и ее придатков:* очень редко – ангионевротический отек, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона, мультиформную эритему и токсический эпидермальный некролиз, крапивницу и зуд.

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

*Общие расстройства:* очень редко – повышенная утомляемость.

### **Срок годности**

5 лет.

### **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**

Частное акционерное общество «Лекхим-Харьков».

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Украина, 61115, Харьковская обл., город Харьков, улица Северина Потоцкого, дом 36.

### **Источник инструкции**

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