

Состав

действующее вещество: лоперамида гидрохлорид;

1 капсула содержит лоперамида гидрохлорида 2 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, тальк, магния стеарат
оболочка капсулы: желатин, титана диоксид (E 171), железа оксид черный (E172), железа оксид желтый (E 172), патентованный синий V (E 131).

Лекарственная форма

Капсулы твердые.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы серого - темно-зеленого цвета, размер 3, содержащие гомогенный порошок белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, которые подавляют перистальтику. Код АТХ А07D А03.

Фармакодинамика

Лоперамида гидрохлорид связывается с опиатными рецепторами кишечной стенки. В результате подавляется высвобождение ацетилхолина и простагландинов, снижая таким образом пропульсивную перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого через пищеварительный тракт, 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 примерно только 0,3%.

Распределение: результаты исследований по распределению лоперамида у крыс показывают высокую аффинность в отношении стенки кишечника с преимущественным связыванием с рецепторами продольного слоя мышечной оболочки. Связывание лоперамида с белками крови 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 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.

Пациенты детского возраста: фармакокинетические исследования по применению лоперамида пациентам детского возраста не проводили. Ожидается, что фармакокинетическая 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

Повышенная чувствительность к лоперамида гидрохлорида или к любому из компонентов препарата.

Возраст до 12 лет.

- острой дизентерией, характеризующееся наличием крови в стуле и лихорадкой;
- острым язвенным колитом или псевдомембранозным колитом, связанным с применением антибиотиков широкого спектра действия;
- бактериальным энтероколитом, вызванным микроорганизмами семей Salmonella, Shigella, Campylobacter.

Лопедиум не следует применять, если надо избежать угнетения перистальтики 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

Сообщалось о случаях взаимодействия с лекарственными препаратами, которые имеют подобные фармакологические свойства. Лекарственные средства, имеющие угнетающее действие на центральную нервную систему (ЦНС), нельзя применять детям одновременно с лоперамидом.

Доклинические данные показали, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Одновременное назначение лоперамида (разовая доза 16 мг) с ингибиторами Р-гликопротеина (хинидин, ритонавир) приводит к повышению уровня лоперамида в плазме крови в 2-3 раза. Клиническая значимость указанной фармакокинетического взаимодействия при применении лоперамида в рекомендованных терапевтических дозах (от 2 до 16 мг) 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. В этом же исследовании ингибитор СYP2C8 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 ЦНС, определялось с помощью психомоторных тестов (то есть субъективная сонливость и тест на замену цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (16 мг однократно) и кетоконазол, 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 содержимого через желудочно-кишечный тракт, могут ослаблять 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 будет исследована.

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

Запрещается применение лоперамида в ситуациях, когда следует избегать подавления перистальтики из-за возможного риска серьезных последствий, таких как мегаколон и токсический мегаколон.

Пациентам с синдромом приобретенного иммунодефицита (СПИД), которые принимают Лопедиум при диарее, следует немедленно прекратить лечение при появлении первых признаков вздутия живота. Существуют отдельные сообщения о случаях кишечной непроходимости с повышенным риском появления токсического мегаколona 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.

Фармакокинетические данные по применению препарата пациентам с нарушениями функции печени отсутствуют, однако таким пациентам лоперамид следует применять с осторожностью по причине замедления метаболизма первого прохождения и это может приводить к относительной передозировке,

что может привести токсическое действие на ЦНС.

С осторожностью следует применять препарат пациентам в случаях обострения язвенного колита. Лекарственные препараты, продлевающие время прохождения, могут привести к развитию токсического мегаколону у пациентов этой группы.

Несмотря на то, что лоперамид хорошо метаболизируется и вместе с метаболитами с калом, обычно не требуется корректировать дозу для пациентов с нарушениями функции почек.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует назначать пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

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 летальном исходе. 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 двух недель.

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

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

- возраст пациента 40 лет и с момента последнего нападения СРК 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 симптомов или если симптомы не улучшились в течение двух недель, следует обратиться к врачу.

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

Возможно возникновение усталости, головокружение 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

Применение в период беременности

Несмотря на отсутствие данных о тератогенных или эмбриотоксических свойствах лоперамида гидрохлорида, ожидаемую терапевтическую пользу следует сопоставить с потенциальными рисками до начала применения лоперамида гидрохлорида, особенно в случае применения в течение первого триместра беременности. Не рекомендуется принимать этот препарат в период беременности.

Применение в период кормления грудью

Поскольку незначительное количество лоперамида может проникать в грудное молоко, прием препарата в период кормления грудью не рекомендуется.

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

Лопедиум 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.

Капсулы следует принимать, запивая жидкостью.

Симптоматическое лечение острой у взрослых и детей старше 12 лет.

Начальная доза - 2 капсулы (4 мг), в дальнейшем 1 капсула (2 мг) после каждого следующего жидкого стула. Обычная доза составляет 3-4 капсулы (6-8 мг) в сутки. Максимальная суточная доза при острой диарее не должна превышать 6 капсул (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 капсулы (4 мг) в дальнейшем принимать по 1 капсуле (2 мг) после каждого случая жидкого стула или согласно предварительным рекомендациям врача. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 капсул (12 мг).

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

Применение у больных пожилого возраста.

Не требуется коррекция дозы для пациентов пожилого возраста.

Применение при нарушениях функции почек.

Не требуется коррекция дозы для пациентов с нарушением функции почек.

Применение при нарушениях функции печени.

Фармакокинетические данные о действии препарата у пациентов с нарушениями функции печени отсутствуют, однако таким пациентам следует назначать лоперамид с осторожностью из-за замедления метаболизма первого прохождения.

Дети

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

Передозировка

Симптомы. В случае передозировки (включая относительная передозировка вследствие печеночной дисфункции) может возникать угнетение ЦНС (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания, запор, задержка мочи и комплекс симптомов, подобных кишечной непроходимости. Дети и пациенты с нарушением функции печени могут быть более чувствительными к воздействию на ЦНС.

У лиц с передозировкой лоперамидом гидрохлоридом наблюдались сердечные нарушения, такие как удлинение интервала QT и комплекса QRS, пируэт тахикардия (torsade de pointes), другие серьезные желудочковые аритмии, остановка сердца и обмороки. Сообщалось также о летальных исходах. Передозировка может проявить имеющийся синдром Бругада.

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.

Лечение. В случае передозировки пациенту следует немедленно обратиться к врачу. При возникновении симптомов передозировки как антидот можно применять налоксон. Поскольку продолжительность действия лоперамида длиннее налоксон (1-3 часа), может потребоваться повторное введение налоксона. С целью выявления симптомов возможного угнетения ЦНС больной должен находиться под тщательным наблюдением не менее 48 часов.

Побочные реакции

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, сонливость, ступор, угнетение или потеря сознания, гипертония, нарушение координации, тремор.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, запор, метеоризм, боль в животе, сухость во рту, рвота, диспепсия, глоссалгия, вздутие живота, непроходимость кишечника, включая паралитический илеус; мегаколон, включая токсический мегаколон, боль в верхней части живота.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: задержка мочи.

Со стороны кожи и подкожной ткани: сыпь, буллезная сыпь, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, мультиформную эритема; ангионевротический отек, крапивница, зуд.

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

Со стороны органа зрения: миоз.

Общие расстройства: повышенная утомляемость.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 капсул в блистере, по 1 блистеру в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

1. Салютас Фарма ГмбХ (производство in bulk, упаковки, выпуск серии).
2. Лек С.А. (Упаковка, выпуск серии).

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

1. Отто-она-Гюрике-алле 1, 39179, Барлебен, Германия.
2. Ул. Доманиевська 50 С, Варшава, 02-672, Польша.

Источник инструкции

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