Состав

действующее вещество: loperamide;

1 капсула содержит 2 мг лоперамида гидрохлорида

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, тальк, магния стеарат;

оболочка капсулы: железа оксид желтый (Е172), железа оксид черный (Е172), титана диоксид (Е 171), индиго (Е 132), эритрозин (Е 127), желатин.

Лекарственная форма

Капсулы.

Основные физико-химические свойства: капсулы размером 4 с зеленой крышечкой и темно-серым корпусом, содержащие порошок белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Препараты, подавляющие перистальтику.

Код АТХ A07D A03.

Фармакодинамика

Лоперамида гидрохлорид связывается с опиатными рецепторами кишечной стенки. В результате подавляется высвобождение ацетилхолина и простагландинов, что приводит к снижению пропульсивной перистальтики и увеличение времени прохождения содержимого через пищеварительный тракт, а также способности стенки кишечника к абсорбции жидкости и электролитов. Лоперамида гидрохлорид увеличивает тонус анального сфинктера, снижая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

Фармакокинетика

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

Распределение результаты исследований распределения лоперамида у крыс показывают высокую аффинность в отношении 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 выводится с желчью. Окислительное N-деметилирования 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 человека составляет примерно 11 часов с диапазоном 9-14 часов. Экскреция неизмененного лоперамида и его метаболитов в основном с калом.

Пациенты детского возраста: фармакокинетических исследований с участием пациентов 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 (старше 18 лет) после установления первичного диагноза врачом.

Противопоказания

Имодиум® 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.

Имодиум® вообще не следует применять, если нужно избежать подавления 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, оказывающие угнетающее действие на центральную нервную систему, не следует применять одновременно с приемом Имодиуму® детям.

Доклинические данные показали, 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. Клиническая значимость указанной 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-кратного увеличения концентрации 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-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 кетоконазол, ингибитора CYP3A4 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 десмопрессином для перорального применения приводило к 3-разового повышения 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 лекарственным средством Имодиум® имеет только симптоматический характер. Если можно определить этиологию заболевания, то по возможности следует проводить специфическое лечение.

Важнейшим мероприятием при острой диареи является предупреждение или восстановления потери жидкости и электролитов. Это особенно важно у детей, ослабленных пациентов и людей пожилого возраста с острой диареей.

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

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

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 риска серьезных последствий, таких как мегаколон и токсический мегаколон.

Пациентам с синдромом приобретенного иммунодефицита, которые принимают Имодиум® при диарее, необходимо немедленно прекратить лечение при появлении первых признаков вздутия живота. Существуют отдельные сообщения о случаях кишечной непроходимости с повышенным риском появления токсического мегаколон у пациентов, больных СПИДом, с инфекционными колитами как вирусной, так и бактериальной этиологии, при лечении лоперамида гидрохлорид.

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 Имодиум® следует применять с осторожностью из-за замедления метаболизма первого прохождения, поскольку он может привести к относительному передозировки, что может привести токсическое поражение ЦНС.

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

Несмотря на то, что лоперамид хорошо метаболизируется и лоперамид или его метаболиты выводятся с калом, обычно не требуется корректировать дозу лоперамида пациентам 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.

Кардиологические осложнения, включая пролонгацию интервала QT, комплекса QRS и torsades de pointes, были зарегистрированы в связи с передозировкой. Некоторые случаи были летальными (см. Раздел «Передозировка»). Пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и рекомендуемую продолжительность лечения.

Если препарат принимали для контроля эпизодов 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, Имодиум® 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 СПК прошло некоторое время;
- возраст пациента 40 лет, и на этот раз симптомы СРК отличаются;
- недавняя кровотечение из кишечника;
- тяжелое запор;
- тошнота или рвота;
- потеря аппетита или уменьшение массы тела;
- затрудненное или болезненное мочеиспускание;
- лихорадка;
- недавняя поездка за границу.

В случае возникновения 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

Возможны потеря сознания, депрессивное уровень сознания, повышение утомляемости, возникновения головокружения или сонливости при синдроме диареи при применении лоперамида гидрохлорида. Поэтому рекомендуется с осторожностью принимать этот препарат при управлении автомобилем или работе с механизмами (см. Раздел «Побочные реакции»).

Применение в период беременности или кормления грудью

Применение в период беременности

Безопасность применения при беременности у человека не установлена, хотя по исследованиям на животных нет никаких признаков того, что лоперамид гидрохлорид имеет какие-либо тератогенные или эмбриотоксические свойства.

Как и для всех лекарственных средств, не рекомендуется применять Имодиум® во время беременности, особенно в течение первого триместра беременности.

Применение в период кормления грудью

Поскольку незначительное количество лоперамида может появляться в грудном молоке, лоперамида гидрохлорид не рекомендуется применять в период кормления грудью.

В связи с этим беременным и кормящим ребенка грудью, следует рекомендовать обратиться к врачу для получения соответствующего лечения.

Фертильность

Эффект на фертильность человека не оценивали.

Способ применения и дозы

Имодиум® не предназначен для начальной терапии серьезной диареи, сопровождающейся снижением уровней жидкости и электролитов. В частности, у детей эту потерю желательно компенсировать путем назначения заместительной терапии парентерально или перорально.

Капсулы следует принимать, запивая жидкостью.

Симптоматическое лечение острой диареи 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).

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

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

Начальная доза составляет 2 капсулы (4 мг) в дальнейшем принимают по 1 капсуле (2 мг) после каждого следующего жидкого стула или согласно предварительным рекомендациям врача. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 капсул (12 мг).

Применение у пациентов 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

Хотя фармакокинетические данные о действии препарата у пациентов с нарушением функции печени отсутствуют, таким пациентам нужно назначать Имодиум® с осторожностью из-за замедления в них метаболизма первого прохождения (см. Раздел «Особенности применения»).

Дети

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

Передозировка

Симптомы

В случае передозировки (включая относительная передозировка вследствие нарушения функции печени) возможно угнетение ЦНС (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус и угнетение дыхания), запор, задержка мочи и кишечная непроходимость. Дети и пациенты с нарушением функции печени могут быть более чувствительными к воздействию на ЦНС.

У лиц, превысили дозы лоперамида, наблюдалось удлинение интервала QT и комплекса QRS, и/или серьезные желудочковые аритмии, включая torsades de pointes (типа «пируэт»), остановка сердца и обмороки (см. Раздел «Особенности применения»).

Также были зафиксированы летальные исходы.

Злоупотребления, неправильного использования и/или умышленно передозировки с чрезмерно большими дозами лоперамида может привести к синдрому Бругада.

Лечение

В случае передозировки пациенту следует немедленно обратиться к врачу. В случае передозировки следует начать мониторинг интервала QT. Если появляются симптомы передозировки со стороны ЦНС, в качестве антидота можно применять налоксон. Поскольку продолжительность действия лоперамида гидрохлорида длиннее действие налоксона (1-3 часа), может потребоваться 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

Безопасность лоперамида гидрохлорида оценивалась в 2755 взрослых и детей старше 12 лет, которые принимали участие в 26 контролируемых и неконтролируемых клинических исследованиях применения лоперамида гидрохлорида для лечения острой диареи. Наиболее частыми побочными эффектами, которые возникали с частотой от 1%, о которых сообщалось в данных клинических исследованиях, были запор (2,7%), метеоризм (1,7%), головная боль (1,2%) и тошнота (1,1%).

Ниже приводятся побочные реакции, которые возникали при применении лоперамида гидрохлорида в клинических исследованиях и в течение постмаркетингового применения.

Частота побочных реакций приводится с использованием следующих условных категорий: очень часто (≥ 1/10); часто (≥ 1/100, <1/10); нечасто (≥ 1/1000, <1/100); редко (≥ 1/10000, <1/1000); очень редко (<1/10000).

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

*Со стороны нервной систем*ы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, сонливость; редко - нарушение координацииа, потеря сознания и, угнетение сознания и, гипертонияа, ступора.

Со стороны органа зрения: редко - миоз.

Со стороны пищеварительного тракта: часто - запор, вздутие живота, тошнота нечасто - боль и дискомфорт в животе, сухость во рту, боль в верхней части живота, рвота, диспепсия редко - кишечная непрохиднистьа (включая паралитической кишечной непроходимости), мегаколона (включая токсический мегаколонб), ощущение растяжение живота.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - сыпь, редко - ангионевротический отек, буллезная висипанняа, включая синдром Стивенса - Джонсона, мультиформную эритема и токсический эпидермальный некролиз, кропивьянкаа и зуд.

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

Общие нарушения: редко - повышенная втомлюванистьа.

а - Эти побочные реакции включены на основе постмаркетинговых сообщений о применении лоперамида гидрохлорида. Поскольку постмаркетинговых сообщений невозможно отличить побочные реакции при острых или хронических заболеваниях или применении взрослым или детям, частота побочных реакции оценена на основе данных всех клинических исследований применения лоперамида гидрохлорида, включая исследования в возрасте до 12 лет (N = 3683).

б - См. раздел. «Особенности применения».

Отчетность по побочных реакций

Отчетность в отношении подозреваемых побочных реакций после утверждения лекарственного средства важна. Это позволяет продолжить мониторинг соотношения польза/риск лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции через национальную систему фармаконадзора.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 6 или 20 капсул в блистере, по 1 блистера в картонной пачке

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Янссен-Силаг/Janssen-Cilag.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Домен де Мегремон, 27100 Вал где Рюй, Франция/Domaine de Maigremont, 27100 Val de Reuil, France.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.