

Состав

действующее вещество: loperamide hydrochloride;

1 таблетка содержит 2 мг лоперамида гидрохлорида

вспомогательные вещества: желатин, манит (Е 421), аспартам (Е 951), ароматизатор мятный (содержит следы сульфитов), натрия гидрокарбонат.

Лекарственная форма

Таблетки, диспергируются в ротовой полости.

Основные физико-химические свойства: округлые лиофилизированные таблетки от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, подавляющие перистальтику. Код АТХ А07D А03.

Фармакодинамика

Лоперамид связывается с опиатными рецепторами кишечной стенки, уменьшая пропульсивную перистальтику, увеличивая время прохождения содержимого кишечника и улучшая всасывание воды и электролитов. Лоперамид повышает тонус анального сфинктера, помогает уменьшить недержание каловых масс и позывы к дефекации.

Фармакокинетика

Всасывания. Большая часть лоперамида после перорального применения всасывается в кишечнике, но в результате значительного метаболизма первого прохождения, системная биодоступность составляет лишь примерно 0,3%.

Распределение. Исследование распределения лоперамида у крыс демонстрируют высокую аффинность к кишечной стенке с преимущественным связыванием с рецепторами продольного мышечного слоя. Связывание лоперамида с белками плазмы 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, связывается и выводится с желчью. Окислительное N-деметилования является основным метаболическим путем

лоперамида и опосредуется преимущественно CYP3A4 и CYP2C8. В результате очень интенсивного эффекта первого прохождения концентрация неизмененного лекарственного средства в плазме крови остается крайне низкой.

Вывод. Период полувыведения лоперамида у человека составляет примерно 11:00 (диапазон 9-14 часов). Выделение неизмененного лоперамида и его метаболитов преимущественно с калом.

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 ® Экспресс противопоказан:

- пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамида гидрохлорида или к любому из компонентов препарата, чтобы предотвратить тяжелые кожные проявления, включая
- синдром Стивенса - Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и полиморфную эритему;
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 ® Экспресс вообще 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.

Особые меры безопасности

Лечение диареи носит симптоматический характер. Если можно определить этиологию заболевания, то следует проводить специфическое лечение.

У больных с диареей, особенно у детей, ослабленных пациентов и лиц пожилого возраста, может возникнуть дегидратация и дисбаланс электролитов. В таких случаях важнейшим мероприятием является применение заместительной терапии для пополнения жидкости и электролитов. Применение препарата Имодиум ® Экспресс не заменяет введение соответствующего количества жидкости и восстановления 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, если клиническое улучшение не наблюдается в течение 48 часов, применение лоперамида гидрохлорида следует прекратить и обратиться за консультацией к врачу.

Запрещается применение лоперамида в ситуациях, когда следует избегать подавления перистальтики за возможного риска серьезных последствий, таких как мегаколон и токсический мегаколон. Пациенты с синдромом приобретенного иммунодефицита, которые принимают Имодиум ® Экспресс при диарее, должны немедленно прекратить лечение при появлении первых признаков вздутия живота. Существуют отдельные сообщения о случаях кишечной непроходимости с повышенным риском появления токсического мегаколон при лечении лоперамида гидрохлорид пациентов, больных СПИДом, с инфекционными колитами как вирусной, так и бактериального происхождения.

Злоупотребление или неправильное применение лоперамида как опиоидного заменителя было описано у лиц с опиоидной зависимостью.

Хотя фармакокинетические данные для пациентов с нарушением функции печени отсутствуют, таким пациентам Имодиум ® Экспресс следует применять с осторожностью из-за замедления метаболизма первого прохождения. Пациенты с нарушением функции печени должны находиться под тщательным наблюдением с целью своевременного выявления признаков токсического поражения ЦНС.

С осторожностью следует применять препарат пациентам с обострением язвенного колита. Лекарственные средства, удлиняющие время прохождения, могут привести к развитию токсического мегаколон у пациентов этой группы.

Поскольку лоперамид хорошо метаболизируется и он и его метаболиты выводятся с калом, обычно не требуется корректировать дозу препарата пациентам с нарушением функции почек.

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 QT и *torsades de pointes*, были зарегистрированы в связи с передозировкой. (См. Раздел «Передозировка»). Пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и / или рекомендованную продолжительность лечения.

Если препарат принимают 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, Имодиум® Экспресс следует принимать, только если врач предварительно диагностировал этот синдром.

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

- возраст 40 или более лет и с момента последнего нападения СПК прошло некоторое время;
- возраст 40 или более лет и на этот раз симптомы СРК отличаются;
- недавняя кровотечение из кишечника;
- тяжелый запор
- тошнота или рвота
- потеря аппетита или снижение 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.

Ароматизатор мятный содержит сульфиты, которые могут изредка вызывать реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Манит (Е 421) может оказать мягкое слабительное действие.

Аспартам (Е 951) - производная фенилаланина, который представляет опасность для больных фенилкетонурией.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействия

Сообщалось о случаях взаимодействия с лекарственными средствами, имеющими подобные фармакологические свойства. Лекарственные средства, угнетающие центральную нервную систему, не следует применять детям одновременно с препаратом Имодиум® Экспресс.

Доклинические данные показали, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Одновременное назначение лоперамида (в разовой дозе 16 мг) с препаратами-ингибиторами Р-гликопротеинов (хинидин, ритонавир) приводило к повышению уровня лоперамида в плазме в 2-3 раза. Клиническая значимость указанной фармакокинетического взаимодействия при применении лоперамида в рекомендованных дозах (от 2 до 16 мг) неизвестна.

Одновременное применение лоперамида (4 мг однократно) и итраконазола, ингибитора CYP3A4 и Р-гликопротеина, приводило к 3-4-кратного увеличения 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-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 транзит пищи по желудочно-кишечному тракту, могут снижать его действие.

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

Учитывая возможность потери сознания, угнетение сознания, возникновение усталости, головокружение или сонливости при синдроме диареи, при применении лоперамида гидрохлорида не рекомендуется управлять автомобилем или работать со сложной техникой.

Применение в период беременности или кормления грудью

Безопасность применения препарата во время беременности не установлена, хотя в исследованиях на животных признаков тератогенных или эмбриотоксического свойств лоперамида гидрохлорида отмечено не было. Как и для других лекарственных средств, применение лоперамида во время беременности не рекомендуется, особенно во время первого триместра.

Незначительное количество лоперамида может появляться в грудном молоке. Поэтому лоперамид не рекомендуется применять во время кормления грудью.

Беременным и кормящим грудью, следует рекомендовать обратиться к врачу для получения соответствующего лечения.

Способ применения и дозы

Таблетку, диспергируется в ротовой полости, следует положить на язык. Таблетка растворится, и ее необходимо будет проглотить вместе со слюной. Таблетку, диспергируется в ротовой полости, запивать не нужно.

Острая диарея

Взрослые, пожилые пациенты и дети старше 12 лет

Начальная доза - две таблетки (4 мг), в дальнейшем - по 1 таблетке (2 мг) после каждого жидкого стула. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 таблеток (12 мг). При острой диарее, если в течение 48 часов не наблюдается клинического улучшения, прием препарата следует прекратить.

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

первичного диагноза врачом .

Взрослые (от 18 лет):

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

Пациенты пожилого возраста

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Нарушение функции почек

Пациентам с нарушением функции почек коррекция дозы не требуется.

Нарушение функции печени

Хотя данных с таковой у пациентов с нарушением функции печени, таким пациентам Имодиум ® Экспресс следует применять с осторожностью из-за замедления в них метаболизма первого прохождения (см. Раздел «Особые меры безопасности»).

Дети

Лекарственное средство 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 / или серьезные желудочковые аритмии, включая torsades de pointes (типа «пируэт»), которые ассоциируются со злоупотреблением или неправильным применением лоперамида.

У лиц, сознательно употребляли высокие дозы лоперамида (сообщалось о дозах от 40 до 792 мг в сутки), наблюдались остановка сердца, обмороки. Также были зафиксированы летальные исходы. (См. Раздел «Особые меры безопасности»).

Злоупотребления, неправильного использования и / или умышленно передозировки с чрезмерно

большими дозами лоперамид может привести к синдрому Бругада.

Лечение

В случае передозировки следует начинать мониторинг ЭКГ. Как антидот можно применять налоксон. Поскольку продолжительность действия лоперамида длиннее, чем продолжительность действия налоксона (1-3 часа), может потребоваться повторное лечение налоксоном. Поэтому следует проводить тщательный мониторинг состояния пациентов по крайней мере в первые 48 часов с целью выявления возможного угнетения ЦНС.

Побочные реакции

Взрослые и дети старше 12 лет

Побочные эффекты у пациентов с острой диареей

Побочные эффекты, возникающие с частотой 1% или выше, о которых сообщалось в данных клинических исследованиях:

Со стороны нервной системы: головная боль.

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

Побочные эффекты, возникающие с частотой менее 1% в вышеуказанных клинических исследованиях:

Со стороны нервной системы: головокружение.

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

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь.

Побочные эффекты у пациентов с острой диареей

Нежелательные реакции, о которых сообщалось в $\geq 1\%$ пациентов, при лечении лоперамида гидрохлорид:

Со стороны пищеварительного тракта: рвота.

Побочные эффекты, возникающие с частотой менее 1%, о которых сообщалось в вышеуказанных клинических исследованиях:

Со стороны нервной системы: сонливость, головокружение, головная боль.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, боль в животе, запор.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь.

Постмаркетинговый опыт.

Побочные эффекты, о которых поступили спонтанные сообщения с частотой:

очень часто ($\geq 1/10$);

часто ($\geq 1/100$, $<1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$)

редко ($\geq 1/10\,000$, $<1/1000$);

очень редко ($<1/10\,000$), 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, гипертония, сонливость, ступор.

Со стороны органа зрения: очень редко - миоз.

Со стороны пищеварительного тракта: 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 эритему 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

3 года.

Условия хранения

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

Упаковка

По 6 таблеток в блистере, по 1 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Каталент ЮК Суиндон Зидис Лимитед.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

50-100 Холмерс Фарм Вэй Пусть Вейк, ХП12 4 ЭГ, Англия.

Источник инструкции

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