МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Веро-лоперамид

МИНЗДРАВ РОССИИ
Р N000336/01-210920
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Веро-лоперамид

Международное непатентованное или группировочное наименование: лоперамид

Лекарственная форма: таблетки

Состав

Состав на одну таблетку

Действующее вещество:

Лоперамида гидрохлорид	0,002002 г
Вспомогательные вещества:	*для получения таблетки массой 0,14 г*
Лактозы моногидрат	0,07780 г
Крахмал картофельный	0,04879 г
Повидон К-25 (поливинилпирролидон)	0,00441 г
Кремния диоксид коллоидный (аэросил)	0,002798 г
Тальк	0,00280 г
Магния стеарат	0,00140 г

Описание: таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы.

Фармакотерапевтическая группа: противодиарейное средство

Код АТХ: A07DA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лоперамид, связываясь с опиоидными рецепторами в стенке кишечника, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, замедляя таким образом перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику. Повышает тонус анального сфинктера, уменьшая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

Фармакокинетика

Большая часть лоперамида всасывается в кишечнике, но вследствие активного пресистемного метаболизма системная биодоступность составляет примерно 0,3 %.

Данные доклинических исследований свидетельствуют о том, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Связывание лоперамида с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) составляет 95 %.

Лоперамид преимущественно метаболизируется в печени, конъюгируется и выделяется с желчью. Окислительное N-деметилирование является основным путем метаболизма лоперамида и осуществляется преимущественно при участии ингибитора изоферментов CYP3A4 и CYP2C8. Вследствие активного пресистемного метаболизма концентрация неизмененного лоперамида в плазме крови ничтожно мала.

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 часов, варьируя от 9 до 14 часов. Неизмененный лоперамид и его метаболиты выводятся преимущественно с калом.

Фармакокинетические исследования у детей не проводились. Ожидается, что фармакокинетика лоперамида и его взаимодействие с другими лекарственными препаратами будут аналогичны таковым у взрослых.

Показания к применению

Симптоматическое лечение острой и хронической диареи различного генеза (аллергического, эмоционального, лекарственного, лучевого; при изменении режима питания и качественного состава пищи, при нарушении метаболизма и всасывания). В качестве вспомогательного лекарственного средства при диарее инфекционного генеза.

Регуляция стула у пациентов с илеостомой.

Противопоказания

Веро-лоперамид таблетки не следует применять у детей в возрасте до 6 лет.

Веро-лоперамид противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамиду и/или любому из компонентов препарата.

Препарат противопоказан при дефиците лактазы, непереносимости лактозы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Беременность; период грудного вскармливания.

Лоперамид нельзя применять в качестве основной терапии:

- у пациентов с острой дизентерией, которая характеризуется стулом с примесью крови и высокой температурой;
- у пациентов с язвенным колитом в стадии обострения;
- у пациентов с бактериальным энтероколитом, вызванным патогенными микроорганизмами, в том числе Salmonella, Shigella и Campylobacter;
- у пациентов с псевдомембранозным колитом, связанным с терапией антибиотиками широкого спектра действия.

Лоперамид не следует применять в случаях, когда замедление перистальтики нежелательно из-за возможного риска развития серьезных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона. Прием лоперамида необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

С осторожностью

Лоперамид следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени вследствие замедленного пресистемного метаболизма.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение во время беременности

Данные о том, что лоперамид обладает тератогенным или эмбриотоксическим действием отсутствуют. Веро-лоперамид противопоказан во время беременности.

Применение в период грудного вскармливания

Небольшое количество лоперамида может проникать в грудное молоко, поэтому Веро-лоперамид противопоказан в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь, запивая водой.

Взрослые и дети старше 6 лет:

Острая диарея: начальная доза - 2 таблетки (4 мг) для взрослых и 1 таблетка (2 мг) для детей, далее по 1 таблетке (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула.

Хроническая диарея: начальная доза – 2 таблетки (4 мг) в сутки для взрослых и 1 таблетка 2 мг) для детей; далее начальная доза должна быть откорректирована таким образом, чтобы частота нормального стула составляла 1-2 раза в сутки, что обычно достигается при поддерживающей дозе от 1 до 6 таблеток (2-12 мг) в сутки.

Максимальная суточная доза не должна превышать 8 таблеток (16 мг); максимальная суточная доза у детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 таблетки на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 8 таблеток (16 мг).

При нормализации стула или при отсутствии стула более 12 ч препарат отменяют.

Применение у детей

Не применять лоперамид у детей до 6 лет.

Применение у пожилых пациентов

При лечении пожилых пациентов корректировка дозы не требуется.

Применение у пациентов с нарушениями функции почек

При лечении пациентов с нарушениями функции почек корректировка дозы не требуется.

Применение у пациентов с нарушениями функции печени

Хотя фармакокинетические данные у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких пациентов лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»).

Побочное действие

Нежелательные реакции – это нежелательные явления, для которых следует считать доказанной причинно-следственную связь с применением лоперамида на основе всесторонней оценки имеющейся информации о нежелательном явлении. В отдельных случаях довольно трудно достоверно установить причинно-следственную связь между приемом лоперамида и возникновением перечисленных симптомов. Кроме того, поскольку клинические исследования проводятся в различных условиях, частота развития нежелательных реакций в клинических исследованиях одного препарата не может быть непосредственно сравнена с частотой развития нежелательных реакций в клинических исследованиях другого препарата и может не отражать частоту развития нежелательных реакций в клинической практике.

<u>По данным клинических исследований</u>

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у ≥1 % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: сонливость, головокружение, головная боль, сухость во рту, боль в животе, тошнота, рвота, запор, дискомфорт и вздутие живота, боль в верхних отделах живота, сыпь.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у ≥1 % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головная боль, боль в животе, сухость во рту, дискомфорт в области живота, диспепсия.

По данным спонтанных сообщений о нежелательных реакциях

Нижеперечисленные нежелательные реакции классифицировали следующим образом: *очень часто* (≥10 %), *часто* (≥1 %, но <10 %), *нечасто* (≥0,1 %, но <1 %), *редко* (≥0,01 %, но <0,1 %) и *очень редко* (<0,01 %, включая единичные сообщения).

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции, включая анафилактический шок, и анафилактоидные реакции.

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

Нарушения со стороны органа зрения: очень редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень редко: кишечная непроходимость (в том числе, паралитическая кишечная непроходимость), мегаколон (в том числе, токсический мегаколон).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко: ангионевротический отек, зуд, крапивница, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и многоформную эритему.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко: задержка мочи.

Общие расстройства: очень редко: утомляемость.

Передозировка

Симптомы

При передозировке (в том числе, при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочеиспускания, кишечная непроходимость, признаки угнетения центральной нервной системы (ЦНС): ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, гипертонус мышц, угнетение дыхания. Дети могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые.

Терапия

При появлении симптомов передозировки в качестве антидота можно использовать налоксон. Поскольку длительность действия лоперамида больше, чем налоксона (1-3 часа), может потребоваться повторное применение налоксона. Поэтому необходимо тщательно наблюдать за состоянием пациента в течение как минимум 48 часов с целью своевременного обнаружения признаков возможного угнетения ЦНС.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

По данным доклинических исследований лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. При одновременном применении лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и хинидина или ритонавира, являющихся ингибиторами Р-гликопротеина, концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 2-3 раза. Клиническое значение описанного фармакокинетического взаимодействия с ингибиторами Р-гликопротеина при применении лоперамида в рекомендованных дозах неизвестно.

Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 4 мг) и итраконазола, ингибитора изофермента CYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови в 3-4 раза. В этом же исследовании применение ингибитора изофермента CYP2C8, гемфиброзила, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. При применении комбинации итраконазола и гемфиброзила пиковая концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 4 раза, а общая концентрация - в 13 раз. Это повышение не было связано с влиянием на ЦНС, что оценивалось по психомоторным тестам (т. е. субъективной оценке сонливости и тесту замены цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и кетоконазола, ингибитора изофермента CYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к пятикратному повышению концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не было связано с увеличением фармакодинамического действия, оцененного по величине зрачка.

При одновременном пероральном приеме десмопрессина концентрация десмопрессина в плазме крови увеличилась в 3 раза, вероятно, из-за замедления моторики желудочно-кишечного тракта.

Ожидается, что препараты со схожими фармакологическими свойствами могут усиливать действие лоперамида, а препараты, увеличивающие скорость прохождения через желудочно-кишечный тракт, могут уменьшать действие лоперамида.

Особые указания

Лечение диареи препаратом Веро-лоперамид носит только симптоматический характер. В тех случаях, когда возможно установить причину диареи, необходимо проводить соответствующую терапию.

У пациентов с диареей (особенно у детей) может иметь место потеря жидкости и электролитов. В таких случаях необходимо проводить соответствующую заместительную терапию (восполнение жидкости и электролитов).

При отсутствии эффекта после двух суток лечения необходимо прекратить курс препарата, уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты со СПИДом, принимающие Веро-лоперамид для лечения диареи, должны прекратить прием препарата при первых признаках вздутия живота. Поступали единичные сообщения о запоре с повышенным риском развития токсического мегаколона у пациентов со СПИДом и инфекционным колитом вирусной и бактериальной этиологии, которым проводилась терапия лоперамидом.

Хотя данные о фармакокинетике лоперамида у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких пациентов лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма, поскольку это может привести к относительной передозировке и токсическому поражению ЦНС.

Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности, не выбрасывайте его в сточные воды и на улицу! Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду!

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения препаратом Веро-лоперамид следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как препарат может вызывать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

Форма выпуска

Таблетки, 2 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10 или 20 таблеток в банку светозащитного стекла с треугольным венчиком типа БТС, укупоренную крышкой натягиваемой с уплотняющим элементом.

Каждую банку или 1, 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускается без рецепта.

Производитель

АО «ВЕРОФАРМ»

Адрес производства: Россия, 308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д. 14.

Тел.: (4722) 21-32-26; факс: (4722) 21-34-71.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии от потребителей

Юридический адрес: Россия, 107023, г. Москва, Барабанный пер., д. 3.

Адрес принятия претензий: Россия, 308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д. 14.

Тел.: (4722) 21-32-26; факс: (4722) 21-34-71.

Генеральный директор
АО «ВЕРОФАРМ» Иван Поляк