МИНЗДРАВ РОССИИ
П N016070/01- 280214
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Имодиум®

Регистрационный номер:

Торговое название: Имодиум®

Международное непатентованное название: лоперамид

Лекарственная форма: капсулы

Состав

Активное вещество (на 1 капсулу): лоперамида гидрохлорид 2 мг.

Вспомогательные вещества (на 1 капсулу): лактозы моногидрат 127,0 мг, крахмал кукурузный 40,0 мг, тальк 9,0 мг, магния стеарат 2,0 мг.

Состав крышечки капсулы: титана диоксид (Е 171) 1,6 %, железа оксид черный (Е 172) 0,4 %, железа оксид красный (Е 172) 1,0 %, железа оксид желтый (Е 172) 0,8 %, желатин до 100 %.

Состав корпуса капсулы: индигокармин (Е 132) 0,03 %, титана диоксид (Е 171) 1,0 %, железа оксид черный (Е 172) 0,0075 %, железа оксид желтый (Е 172) 0,085 %, желатин до 100 %.

Описание

Твердые желатиновые капсулы (размер 4), состоящие из корпуса светло-зеленого цвета и крышечки коричневого цвета. Содержимое капсул – порошок белого цвета.

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 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 (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

Имодиум® капсулы не следует применять у детей в возрасте до 6 лет.

Имодиум® противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамиду и/или любому из компонентов препарата.

Имодиум® капсулы противопоказаны при дефиците лактазы, непереносимости лактозы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Имодиум® противопоказан в первом триместре беременности.

Имодиум® не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Имодиум® 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.

Имодиум® 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. Имодиум® необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

С осторожностью

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

Применение при беременности и лактации

Применение во время беременности

Данные о том, что лоперамид обладает тератогенным или эмбриотоксическим действием, отсутствуют. Имодиум® противопоказан в первом триместре беременности. В период беременности Имодиум® не рекомендуется применять без консультации с лечащим врачом. Препарат можно назначать только в том случае, если предполагаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Применение во время лактации

Небольшое количество лоперамида может проникать в грудное молоко, поэтому Имодиум® не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь, запивая водой.

Взрослые и дети старше 6 лет:

Острая диарея: начальная доза – 2 капсулы (4 мг) для взрослых и 1 капсула (2 мг) для детей, далее по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула.

Хроническая диарея: начальная доза – 2 капсулы (4 мг) в сутки для взрослых и 1 капсула (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 капсул (2–12 мг) в сутки.

Максимальная суточная доза при острой и хронической диарее у взрослых – 8 капсул (16 мг); максимальная суточная доза у детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 капсулы на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 8 капсул (16 мг).

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

Применение у детей

Не применять Имодиум® 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 больных Имодиум® 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 Имодиум® при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших Имодиум® 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 Имодиум® при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у <1 % пациентов, принимавших Имодиум® 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 частые* (≥10 %), *частые* (≥1 %, но <10 %), *не частые* (≥0,1 %, но <1 %), *редкие* (≥0,01 %, но <0,1 %) и *очень редкие* (<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, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса – Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и мультиформную эритему, зуд, крапивница.

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 мочи, 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 не менее 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 Имодиум® 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 2 суток лечения необходимо прекратить прием препарата, уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты со СПИДом, принимающие Имодиум® 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 больных Имодиум® 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 и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

В период лечения препаратом Имодиум® 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

Капсулы, 2 мг.

По 6, 8, 12 или 20 капсул в блистере из ПВХ и фольги алюминиевой. По 1 блистеру вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке картонной.

Условия хранения

Хранить при температуре от 15 до 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Без рецепта.

Производитель

«Янссен-Силаг», Франция

Адрес места производства: Domaine de Maigremont, 27100 Val de Reuil, France/

Домен де Мегремон, 27100 Валь де Рей, Франция

Организация, принимающая претензии:

ООО «Джонсон & Джонсон», Россия

121614, г. Москва, ул. Крылатская, д. 17, стр. 2

Тел. (495) 726-55-55

Специалист по регистрации
ООО «Джонсон & Джонсон»

Общество с ограниченной ответственностью ОГРН 1027725029440 * Москва * "Джонсон & Джонсон" для регистрации

Гащенко М.В.