МИНЗДРАВ РОССИИ
№ П015863/01- 211117
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лопедиум®

наименование лекарственного препарата

капсулы, 2 мг

лекарственная форма, дозировка

Салютас Фарма ГмбХ, Германия

наименование производителя, страна

Изменение № 2

Дата внесения Изменения «____» 211117 20___ г.

Старая редакция	**Новая редакция**
Фармакологические свойства *Фармакодинамика* Связываясь с опиоидными рецепторами кишечной стенки, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, снижая тем самым тонус и моторику гладкой мускулатуры кишечника.. Замедляет перистальтику и увеличивает время прохождения кишечного содержимого. Повышает тонус анального сфинктера. Способствует удержанию каловых	**Фармакологические свойства** *Фармакодинамика* Связываясь с опиоидными рецепторами кишечной стенки, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, снижая тем самым тонус и моторику гладкой мускулатуры кишечника. Замедляет перистальтику и увеличивает время прохождения кишечного содержимого. Повышает тонус анального сфинктера. Способствует удержанию каловых

масс и урежению позывов к дефекации, уменьшает частоту актов дефекации. Действие наступает быстро и продолжается 4 - 6 ч. *Фармакокинетика* Лоперамид подвергается метаболизму при первом прохождении, обусловливающему низкую биодоступность препарата при пероральном приеме. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови 3 - 5 ч. Лоперамид в следовых количествах проникает через гематоэнцефалический барьер, что не имеет клинически значимого эффекта. 1/3 лоперамида выводится из организма в неизмененном виде, остальная часть выводится в виде метаболитов кишечником. Менее 2 % активной субстанции выводится в неизмененном виде через почки. Период полувыведения ($T_{1/2}$) - 7 - 15 ч.	масс и урежению позывов к дефекации, уменьшает частоту актов дефекации. Действие наступает быстро и продолжается 4 - 6 ч. *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.
Передозировка *Симптомы:* угнетение центральной нервной системы (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания), задержка мочи, кишечная непроходимость. *Лечение:* антидот - налоксон; учитывая, что продолжительность действия лоперамида больше, чем у налоксона, возможно повторное введение последнего.	**Передозировка** *Симптомы:* угнетение центральной нервной системы (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания), задержка мочи, кишечная непроходимость. Дети могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые. У пациентов с передозировкой лоперамида гидрохлорида наблюдались сердечные осложнения, такие как удлинение интервала QT, развитие тахисистолической

Необходимо медицинское наблюдение, по крайней мере, в течение 48 часов.	желудочковой аритмии типа «пируэт» (torsade de pointes), другие серьезные желудочковые аритмии, остановка сердца и обморок. Сообщалось также о летальных случаях. *Лечение:* антидот - налоксон; учитывая, что продолжительность действия лоперамида больше, чем у налоксона, возможно повторное введение налоксона. Необходимо медицинское наблюдение, по крайней мере, в течение 48 ч.
Особые указания Лопедиум® используется для симптоматического лечения диареи. В случае установления причины заболевания следует проводить направленную терапию. У пациентов, страдающих диареей, в особенности у детей, возможны гиповолемия и снижение содержания электролитов. В таких случаях крайне необходимы возмещение потери электролитов и регидратация. В случае отсутствия улучшения при острой диарее после использования препарата на протяжении 48 ч следует обратиться к врачу.	**Особые указания** Лопедиум® используется для симптоматического лечения диареи. В случае установления причины заболевания следует проводить соответствующую терапию. У пациентов, страдающих диареей, в особенности у детей, возможны потеря жидкости и электролитов. В таких случаях крайне необходимы возмещение потери электролитов и регидратация. В случае отсутствия улучшения при острой диарее после использования препарата на протяжении 48 ч следует обратиться к врачу.

Если при лечении диареи у пациентов с синдромом приобретенного иммунодефицита (СПИД) развивается вздутие живота, препарат следует незамедлительно отменить. В очень редких случаях у пациентов с диагнозом СПИД, страдающих инфекционным колитом, возможен запор с риском токсического мегаколона. Лопедиум® следует применять с осторожностью при печеночной недостаточности во избежание токсического поражения центральной нервной системы. Если при лечении развивается запор, вздутие живота или кишечная непроходимость, препарат следует отменить. *Указание для пациентов с сахарным диабетом*: каждая капсула соответствует 0,01 ХЕ.	Если при лечении диареи у пациентов с синдромом приобретенного иммунодефицита (СПИД) развивается вздутие живота, препарат следует незамедлительно отменить. В очень редких случаях у пациентов с диагнозом СПИД, страдающих инфекционным колитом, возможен запор с риском токсического мегаколона. Лопедиум® следует применять с осторожностью при печеночной недостаточности во избежание токсического поражения центральной нервной системы. Если при лечении развивается запор, вздутие живота или кишечная непроходимость, препарат следует отменить. *Указание для пациентов с сахарным диабетом*: каждая таблетка соответствует 0,01 ХЕ.

Руководитель группы поддержки
зарегистрированных продуктов
ЗАО «Сандоз» Слизкова К.Ш.