

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лоперамид, 2 мг, капсулы.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лоперамид.

Каждая капсула содержит 2 мг лоперамида (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. разделы 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капсулы.

Твердые желатиновые капсулы № 3. Корпус капсулы серого цвета, крышечка капсулы зеленого цвета.

Содержимое капсул – порошок белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Лоперамид показан к применению у взрослых, подростков и детей в возрасте от 6 лет.

- 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 средства при диарее инфекционного генеза.
- Регуляция стула у пациентов с илеостомой.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

Взрослым при острой и хронической диарее первоначально назначают 2 капсулы (4 мг), затем по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула; максимальная суточная доза – 6 капсул (12 мг).

После нормализации стула или при отсутствии стула более 12 часов лечение препаратом следует прекратить.

Особые группы пациентов

Данные отсутствуют.

Дети

Дети в возрасте от 0 до 6 лет

Эффективность и безопасность у детей в возрасте от 0 до 6 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Дети в возрасте от 6 до 18 лет

При острой диарее первоначально назначают 1 капсулу (2 мг), далее по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула.

При хронической диарее первоначально назначают 1 капсулу (2 мг), далее по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула, затем 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 детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 капсулы на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 6 капсул (12 мг).

При нормализации стула или при отсутствии стула более 12 ч прием препарата следует прекратить.

Способ применения

Внутрь.

Капсулы проглатывать, не разжевывая, запивая водой.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к лоперамиду или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- Первый триместр беременности (см. раздел 4.6.).
- Период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.).
- Детский возраст до 6 лет.
- Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозно-галактозная мальабсорбция.
- Препарат 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.
- Препарат 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. Препарат Лоперамид необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

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

Особые указания

Лечение диареи препаратом 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).

Поскольку персистирующая диарея может быть показателем потенциально более серьезных состояний, препарат не следует принимать в течение длительного периода времени, пока не будет выяснена основная причина диареи.

При острой диарее, если клиническое улучшение не наблюдается в течение 48 часов, прием препарата Лоперамид следует прекратить и проконсультироваться с врачом.

Пациенты со СПИДом, принимающие препарат Лоперамид для лечения диареи, должны прекратить прием препарата при первых признаках вздутия живота, а также признаках кишечной непроходимости. 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.

Лоперамид необходимо применять с осторожностью у пациентов с печеночной недостаточностью, так как это может привести к токсическому воздействию на ЦНС вследствие относительной передозировки.

Злоупотребление или неправильное применение лоперамида в качестве заменителя опиоидов описывали у лиц с опиоидной зависимостью.

Если пациенты принимают препарат Лоперамид для контроля эпизодов диареи, связанных с ранее диагностированным синдромом раздраженного кишечника, и клиническое улучшение не наблюдается в течение 48 часов, прием лоперамида следует прекратить и проконсультироваться с врачом. Пациентам также следует обратиться к врачу, если характер их симптомов меняется или если повторяющиеся эпизоды диареи продолжаются более 2 недель.

Сообщалось об удлинении интервала QT и развитии желудочковой аритмии, включая тахикардию по типу «пируэт», в связи с передозировкой лоперамида, в некоторых случаях со смертельным исходом. Передозировка может выявить существующий синдром Бругада. Лоперамид не следует использовать в течение длительного периода времени без наблюдения врача, пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и/или рекомендуемую продолжительность лечения.

Если пациенты принимают этот препарат для симптоматического лечения эпизодов острой диареи, связанных с синдромом раздраженного кишечника (СРК), должны соблюдаться дополнительные меры предосторожности при использовании:

- Пациенты должны принимать препарат для лечения симптомов СРК, только если ранее данный диагноз был поставлен врачом.
- Пациентам в возрасте 40 лет и старше следует проконсультироваться с врачом перед использованием препарата, если симптомы СРК не проявлялись в течение некоторого

времени или если текущая симптоматическая картина отличается от предыдущих симптомов СРК.

- Пациенты должны проконсультироваться с врачом перед использованием препарата, если у них: кишечное кровотечение, сильный запор, тошнота или рвота, потеря аппетита или снижение массы тела, трудности или боль при мочеиспускании, высокая температура тела; если пациенты недавно выезжали за границу.

Если симптомы ухудшаются, если появляются новые симптомы, если характер симптомов меняется или если повторяющиеся эпизоды диареи продолжаются более двух недель, необходимо незамедлительно обратиться к врачу.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит лактозу. Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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 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.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение препарата в первом триместре беременности противопоказано.

Лактация

Поскольку небольшое количество лоперамида обнаруживается в грудном молоке, прием в период грудного вскармливания не рекомендуется.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В период лечения препаратом 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 нежелательные реакции, которые могут влиять на указанные способности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции представлены в соответствии с поражением органов и систем органов в последовательности медицинского словаря для нормативно-правовой деятельности (MedDRA). Частота возникновения определялась в соответствии со следующими категориями: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – гиперчувствительность, анафилактические реакции (включая анафилактический шок и анафилактоидные реакции).

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головная боль, головокружение; нечасто – сонливость; редко – потеря сознания, ступор, угнетение сознания, гипертония, нарушение координации.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – запор, метеоризм, тошнота; нечасто – боль или ощущение дискомфорта в области живота, сухость во рту, рвота, расстройство пищеварения, диспепсия; редко – кишечная непроходимость, мегаколон, глоссалгия, вздутие живота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – высыпания на коже; редко – буллезная сыпь (включая мультиморфную эритему, токсический эпидермальный некролиз и синдром Стивенса-Джонсона), ангионевротический отек, крапивница, кожный зуд.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: редко – задержка мочеиспускания.

Общие нарушения и реакции в месте введения: редко – усталость.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке (в том числе при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочеиспускания, паралитическая кишечная непроходимость, запор, признаки угнетения ЦНС (угнетение дыхания, обструкция дыхательных путей, рвота с нарушением сознания, ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, гипертонус мышц). Дети и пациенты с нарушением функции печени могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые.

У лиц, преднамеренно принявших чрезмерную дозу (от 40 мг до 240 мг/сутки) лоперамида гидрохлорида, отмечалось удлинение интервала QT и комплекса QRS и/или серьезные желудочковые аритмии, включая тахикардию по типу «пируэт»; остановка сердца, обморок (см. раздел 4.4.). Также описывались случаи смертельного исхода при преднамеренной передозировке.

Злоупотребление, неправильное применение и/или передозировка высокими дозами лоперамида может привести к клиническому проявлению синдрома Бругада.

Лечение

В случае передозировки необходимо начать ЭКГ-мониторинг для выявления удлинения интервала QT.

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.

В связи с тем, что тактика купирования передозировки постоянно изменяется, рекомендуется связаться с токсикологическим центром (при наличии) для получения наиболее актуальных рекомендаций по лечению передозировки.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: противодиарейные, кишечные противовоспалительные/противомикробные средства, снижающие моторику желудочно-кишечного тракта.

Код АТХ: A07DA03.

Фармакодинамические эффекты

Лоперамид, связываясь с опиоидными рецепторами кишечной стенки (стимуляция холин- и адренергических нейронов через гуанин-нуклеотиды), снижает тонус и моторику гладкой мускулатуры кишечника, замедляет пассаж содержимого кишечника, уменьшает выделение жидкости и электролитов с фекалиями. Повышает тонус анального сфинктера, способствует удержанию каловых масс и урежению позывов к дефекации. Действие наступает быстро и продолжается 4–6 часов.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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

Распределение

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

Биотрансформация

Лоперамид преимущественно метаболизируется в печени, конъюгируется и выделяется с желчью. Окислительное N-деметилование 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.

Элиминация

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

Особые категории пациентов

Дети

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат (сахар молочный)

Крахмал картофельный

Кальция стеарат

Состав капсул твердых желатиновых:

Корпус:

Титана диоксид (E171)

Краситель оксид железа черный (E172)

Желатин

Крышечка:

Титана диоксид (E171)

Краситель индигокармин (E132)

Краситель оксид железа желтый (E172)

Желатин

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По 1, 2 контурной ячейковой упаковке помещают в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

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.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Производство Медикаментов»
(ООО «ПроМед»)

346720, Россия, Ростовская обл., Аксайский район, г. Аксай, проспект Ленина, д. 43.

Почтовый адрес: 346720, Россия, Ростовская обл., Аксайский район, г. Аксай, проспект Ленина, д. 30, а/я 3.

Тел./факс: 8 (800) 7004343

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Производство Медикаментов»
(ООО «ПроМед»)

346720, Россия, Ростовская обл., Аксайский район, г. Аксай, проспект Ленина, д. 43.

Почтовый адрес: 346720, Россия, Ростовская обл., Аксайский район, г. Аксай, проспект Ленина, д. 30, а/я 3.

Тел./факс: 8 (800) 7004343

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска без рецепта.

Общая характеристика лекарственного препарата Лоперамид доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) <http://eec.eaeunion.org> / (https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC).