

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ДИАРА® ЭКСПРЕСС

Регистрационный номер

Торговое наименование

Диара® Экспресс

Международное непатентованное наименование

Лоперамид

Лекарственная форма

Таблетки, диспергируемые в полости рта (вишневые, апельсиновые)

Состав

1 таблетка, диспергируемая в полости рта (вишневая, апельсиновая) содержит:

Действующее вещество: лоперамида гидрохлорид – 2 мг;

Вспомогательные вещества: декстрозы моногидрат, маннитол, кросповидон (коллидон CL-SF), кроскармеллоза натрия (примеллоза), основной бутил метакрилата сополимер (Эудрагит® Е РО), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный (аэросил), аспартам, натрия лаурилсульфат, ментол, ароматизатор вишневый (мальтодекстрин, гуммиарабик, глицерил триацетат, вкусоароматические вещества) или ароматизатор апельсиновый (мальтодекстрин, гуммиарабик, бутилгидроксианизол, вкусоароматические вещества).

Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской, с характерным слабым запахом вишни (или апельсина).

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

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 005780-090919

СОГЛАСОВАНО

117711

и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику. Повышает тонус анального сфинктера, уменьшая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

В результате клинического исследования были получены данные о том, что противодиарейный эффект наступает в течение одного часа после приема однократной дозы (4 мг).

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-деметилование является основным путем метаболизма лоперамида и осуществляется преимущественно при участии ингибитора изоферментов CYP3A4 и CYP2C8.

Вследствие активного пресистемного метаболизма концентрация неизменного лоперамида в плазме крови ничтожно мала.

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 часов, варьируя от 9 до 14 часов. Неизменный 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

Диара® Экспресс таблетки, диспергируемые в полости рта не следует применять у детей в возрасте до 6 лет.

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 005780-090919

СОГЛАСОВАНО

117711

Диара® Экспресс противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамиду и/или любому из компонентов препарата, а также в первом триместре беременности.

Диара® Экспресс не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Диара® Экспресс таблетки, диспергируемые в полости рта противопоказаны больным фенилкетонурией.

Диара® Экспресс 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.

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

С осторожностью

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания.

Диара® Экспресс не рекомендуется применять во время беременности и в период грудного вскармливания. В случае диареи при беременности или кормлении грудью необходима консультация с лечащим врачом для назначения соответствующего лечения.

Способ применения и дозы

Внутрь. Таблетку кладут на язык, в течение нескольких секунд она растворяется, после чего ее проглатывают со слюной, не 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) 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 6 таблеток (12 мг); максимальная суточная доза у детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 таблетки на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 6 таблеток (12 мг).

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

Применение у детей

Не применять Диара® Экспресс 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 фармакологические данные у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких больных Диара® Экспресс следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»).

Побочное действие

По данным клинических исследований

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у $\geq 1\%$ пациентов, принимавших препарат при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у $\geq 1\%$ пациентов, принимавших препарат при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

По данным постмаркетинговых исследований (спонтанных сообщений о нежелательных реакциях и клинических или эпидемиологических исследований)

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

Нарушения со стороны иммунной системы.

Редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции, включая анафилактический шок, и анафилактоидные реакции.

Нарушения со стороны нервной системы.

Часто: головная боль, головокружение. Нечасто: сонливость. Редко: нарушение координации, угнетение сознания, гипертонус, потеря сознания, ступор.

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 005780-090919

СОГЛАСОВАНО

117711

Нарушения со стороны органа зрения.

Редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта.

Часто: запор, тошнота, метеоризм. Нечасто: боль в животе, дискомфорт в области живота, сухость во рту, боль в эпигастральной области, рвота, диспепсия. Редко: вздутие живота, кишечная непроходимость (в том числе, паралитическая кишечная непроходимость), мегаколон (в том числе, токсический мегаколон), глоссалгия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей.

Нечасто: кожная сыпь. Редко: ангионевротический отек, кожный зуд, крапивница, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и многоформную эритему.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей.

Редко: задержка мочи.

Общие расстройства.

Редко: утомляемость.

Передозировка

Симптомы

При передозировке (в том числе, при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочеиспускания, паралитическая кишечная непроходимость, запор, признаки угнетения центральной нервной системы (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 «Особые указания»). Также описывались случаи смертельного исхода при преднамеренной передозировке.

Терапия

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.

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 интраконазола, 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, гемфибролиза, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. При применении комбинации интраконазола 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.

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 005780-090919

СОГЛАСОВАНО

117711

Особые указания

Лечение диареи препаратом Диара® Экспресс 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).

Диара® Экспресс таблетки диспергируемые в полости рта содержат источник фенилаланина. Прием больным фенилкетонурией противопоказан.

При отсутствии эффекта после 2 суток лечения необходимо прекратить прием препарата, уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты со СПИДом, принимающие Диара® Экспресс 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.

Диара® Экспресс 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 (см. раздел «Передозировка»).

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. Диара® Экспресс не следует использовать в течение длительного периода времени без наблюдения врача, пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и/или рекомендуемую продолжительность лечения.

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 механизмами

В период лечения препаратом Диара® Экспресс 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, диспергируемые в полости рта, 2 мг (вишневые, апельсиновые).

По 6 или 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

Отпускают без рецепта.

Производитель/организация, принимающая претензии

АО «ФП «Оболenskое», Российская Федерация.

142279, Российская Федерация, Московская обл., Серпуховский м.р-н, г.п. Оболенск, рп. Оболенск, район рп Оболенск промышленная зона, стр. №78;

142279, Российская Федерация, Московская обл., Серпуховский м.р-н, г.п. Оболенск, рп. Оболенск, район рп Оболенск промышленная зона, влд. №39, стр. 1

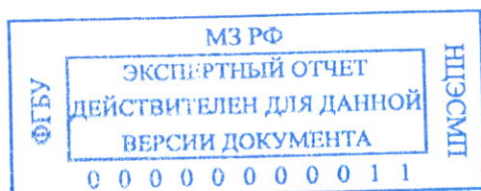
Тел./факс: (4967) 36-01-07.

www.obolensk.ru

Директор по регуляторике и исследованиям



Сетдекова Г.У.



117711