

Лоперамид

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Лоперамид

Международное непатентованное или группировочное наименование: лоперамид

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка содержит:

Действующее вещество: лоперамида гидрохлорид – 2,0 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 106,0 мг, крахмал кукурузный – 26,0 мг, повидон-К17 – 5,0 мг, магния стеарат – 1,0 мг.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки от белого до белого с желтоватым оттенком цвета с фаской и риской.

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.

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

Фармакокинетика

Абсорбция

Большая часть лоперамида всасывается в кишечнике, но вследствие активного пресистемного метаболизма системная 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-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.

Элиминация

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

Особые группы пациентов

Дети

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

Препарат Лоперамид применяется у взрослых и детей старше 6 лет по показаниям: симптоматическое лечение острой и хронической диареи различного генеза (в том числе 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

Гиперчувствительность к лоперамиду и/или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата.

Детский возраст до 6 лет.

Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Беременность, период грудного вскармливания.

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.

В случаях, когда замедление перистальтики нежелательно из-за возможного риска развития серьезных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона. Лоперамид 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

Беременность

Лоперамид не рекомендуется применять во время беременности. В случае диареи во время беременности необходима консультация с лечащим врачом для назначения соответствующего лечения.

Лактация

Лоперамид не рекомендуется применять в период грудного вскармливания. В случае диареи в период грудного вскармливания необходима консультация с лечащим врачом для назначения соответствующего лечения.

Способ применения и дозы

Внутрь.

Таблетки проглатывать, не разжевывая, запивая 100 мл воды.

Режим дозирования

Взрослым при острой и хронической диарее назначают в начальной дозе 2 таблетки (4 мг); затем по 1 таблетке (2 мг) после каждого акта дефекации (в случае жидкого стула); максимальная суточная доза – 6 таблеток (12 мг).

Дети

Детям старше 6 лет при острой диарее назначают в начальной дозе 1 таблетку (2 мг), затем по 1 таблетке после каждого акта дефекации (в случае жидкого стула); максимальная суточная доза – 6 таблеток (12 мг). Не применять препарат у детей до 6 лет.

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

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

При лечении пожилых пациентов корректировка дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

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

Пациенты с нарушением функции печени

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

Побочное действие

Взрослые

Наиболее частыми ($\geq 1\%$ пациентов) нежелательными реакциями (НР) в клинических исследованиях лоперамида при острой диарее были: запор, метеоризм, головная боль, тошнота, рвота.

Наиболее частыми ($\geq 1\%$ пациентов) НР в клинических исследованиях при хронической диарее были: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

Ниже представлены НР, о которых сообщалось при применении лоперамида в ходе клинических исследований или при пострегистрационном применении.

По данным Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ), НР классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: *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* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

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.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: запор, тошнота, метеоризм;

Нечасто: боль в животе, ощущение дискомфорта 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: буллезная сыпь (включая многоформную 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.

Дети

В целом, профиль НР у детей был аналогичен профилю НР у взрослых.

Передозировка

Симптомы

При передозировке (в том числе, при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться: задержка мочи, 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, 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.

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.

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 СYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови в 3-4 раза. В этом же исследовании применение ингибитора изофермента СYP2C8, 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 СYP3A4 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

Лоперамид применяется только для симптоматического лечения диареи. В случае установления причины 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 с синдромом приобретенного иммунодефицита (СПИД), принимающие 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 с диагнозом СПИД 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 поражению центральной нервной системы (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.

Лоперамид не следует применять 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.

Вспомогательные вещества

Препарат Лоперамид содержит лактозы моногидрат (сахар молочный). Пациентам с редко встречающимися наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, непереносимость лактозы вследствие дефицита лактазы или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции, не следует принимать данный лекарственный препарат.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения лоперамидом следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как лоперамид может вызывать головокружение и другие нежелательные реакции (НР), которые могут влиять на указанные способности.

Форма выпуска

Таблетки 2 мг.

По 10, 20, 25, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной либо пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

Или по 10, 20, 25, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку) и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В 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

Отпускают без рецепта.

Держатель регистрационного удостоверения: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11.

Производитель: ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

Либо

Производитель: ООО «Озон Фарм»

Россия, Самарская обл., г.о. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 23.03.2023 № 5461
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0001)

Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «Озон Фарм»

Россия, 445043, Самарская обл., г.о. Тольятти, тер. ОЭЗ ИИТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

Тел.: +79874599993, +79874599994

E-mail: ozonpharm@ozon-pharm.ru