ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лоперамид Велфарм

Регистрационный номер: ЛП-005734

Торговое наименование препарата: Лоперамид Велфарм

Международное непатентованное наименование: лоперамид

Лекарственная форма: капсулы

Состав на 1 капсулу:

Действующее вещество: лоперамида гидрохлорид – 2,0 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный), крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный (аэросил), тальк, магния стеарат.

Состав капсулы желатиновой: титана диоксид, краситель хинолиновый желтый, краситель солнечный закат желтый, желатин.

Описание: капсулы № 4 желтого цвета. Содержимое капсул – порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противодиарейное средство

Код АТХ: A07DA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лоперамид, 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 уменьшает частоту актов дефекации.

Фармакокинетика

Всасывание

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 %. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови 3 - 5 ч. Лоперамид в следовых количествах проникает через гематоэнцефалический барьер, что не имеет клинически значимого эффекта.

Метаболизм

Лоперамид подвергается метаболизму при первом прохождении, обусловливающему низкую биодоступность препарата при пероральном приеме. 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.

Выведение

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 ч, варьируя от 9 до 14 ч. 1/3 лоперамида выводится из организма в неизмененном виде, остальная часть выводится в виде метаболитов кишечником. Менее 2 % выводится в неизмененном виде через почки.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

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 различного 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

Повышенная чувствительность к лоперамиду и/или любому из компонентов препарата. Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозно-галактозная мальабсорбция. Первый триместр беременности, период грудного вскармливания. Детский возраст до 6 лет. Не применять в качестве основной терапии при: острой дизентерии, характеризующейся стулом с примесью крови и высокой температурой; язвенном колите в стадии обострения; бактериальном энтероколите, вызванным патогенными микроорганизмами, в том числе *Salmonella, Shigella* и *Campylobacter*; остром псевдомембранозном энтероколите, связанным с терапией антибиотиками широкого спектра действия. 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.

С осторожностью

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение препарата в первом триместре беременности противопоказано.

Несмотря на отсутствие указаний на тератогенное или эмбриотоксическое действие, в период беременности препарат можно назначить только в том случае, если предполагаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Препарат в небольших количествах выделяется в грудное молоко, поэтому применение препарата в период лактации противопоказано.

Способ применения и дозы

Внутрь, капсулы проглатывать, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Взрослым при острой и хронической диарее первоначально назначают по 2 капсулы (4 мг) в день, затем по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула. Максимальная суточная доза – 8 капсул (16 мг).

Детям старше 6 лет при острой диарее и хронической диарее назначают по 1 капсуле (2 мг) в день, затем по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула. 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 прием препарата следует прекратить.

Пациентам пожилого возраста и при почечной недостаточности коррекция дозы не требуется.

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

Продолжительность лечения составляет 2 дня. При сохранении симптомов более 24 ч необходимо немедленно обратиться к врачу. Длительный прием препарата возможен только под контролем врача.

Побочное действие

Частота побочных эффектов представлена в следующей градации: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10000, <1/1000) и очень редко (<1/10000).

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 органов чувств: редко – миоз.

Нарушения со стороны пищеварительной системы: 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 мочевыделительной системы: редко – задержка мочеиспускания.

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

Прочее: редко – усталость.

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.

Необходимо медицинское наблюдение, по крайней мере, в течение 48 ч.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном приеме лоперамида и ингибиторов Р-гликопротеина, CYP3A4 или CYP2C8 (хинидин, ритонавир, итраконазол, гемфиброзил, кетоконазол) возможно повышение плазменного уровня лоперамида. При одновременном приеме лоперамида и десмопрессина для перорального применения возможно повышение плазменного уровня последнего. Препараты, имеющие схожие фармакологические свойства, могут усиливать действие лоперамида; препараты, усиливающие транзит пищи по желудочно-кишечному тракту – ослаблять его действие.

Особые указания

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.

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.

Лоперамид 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.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения препаратом необходимо соблюдать осторожность. Следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как возможно возникновение ощущения усталости, головокружения, сонливости.

Форма выпуска

Капсулы 2 мг.

4, 6, 7, 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

10, 20, 30, 40, 50, 60 капсул в банку полимерную из полипропилена с крышкой натягиваемой из полиэтилена высокого давления или в банку полимерную из полиэтилена низкого давления с крышкой натягиваемой из полиэтилена низкого давления или с крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления.

Каждую банку, 1, 2, 3, 4, 5, 6 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

200 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению помещают в тару из гофрированного картона (для стационаров).

Условия хранения

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

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия

125362, г. Москва, ул. Водников, д. 2, офис 31

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия

Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях препарата можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте: www.brway.ru, в разделе «VELPHARM» – «Фармаконадзор».