

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

ЛОПЕРАМІД

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: loperamide;

1 капсула містить лопераміду гідрохлориду 2 мг;

допоміжні речовини: цукроза, крохмаль прежелатинізований, магнію стеарат.

Лікарська форма. Капсули.

Тверді желатинові капсули з непрозорим корпусом світло-блакитного кольору та непрозорою кришечкою блакитного кольору або жовтою непрозорою кришечкою та жовтим непрозорим корпусом. Вміст капсул – порошок білого кольору без запаху.

Назва і місцезнаходження виробника.

ТОВ „Стиролбіофарм”.

Україна, 84610, Донецька обл., м. Горлівка, вул. Горлівської дивізії, 97.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що пригнічують перистальтику. Лоперамід.

Код АТС А07D А03.

Лоперамід чинить протидіарейну дію. Лопераміду гідрохлорид зв'язується з опіатними рецепторами кишкової стінки. Внаслідок цього пригнічується вивільнення ацетилхоліну та простагландинів, що призводить до зниження перистальтики. Лопераміду гідрохлорид збільшує тонус анального сфінктера, знижуючи тим самим нетримання калових мас та позиви до дефекації. На відміну від інших опіоїдних агоністів, Лоперамід зв'язує кальмодулін – білок, який регулює кишковий транспорт іонів. Лоперамід не має морфіноподібної дії на центральну нервову систему, притаманної іншим опіатоподібним агоністам, не має центральної дії, бо практично не проникає скрізь гематоенцефалічний бар'єр; не викликає пристрасті та звикання, більш вибірково діє, тому викликає меншу кількість побічних явищ. Дія розвивається швидко та триває 4-6 годин.

Завдяки його значній спорідненості зі стінкою кишечника та високому ступеню метаболізму при першому проходженні препарат практично не потрапляє до системного кровотоку.

При пероральному введенні Лоперамід легко і майже повністю абсорбується із кишечника. Через 1 годину після прийому 85 % Лопераміду виявляється у шлунково-кишковому тракті, 5 % – у печінці, 0,04 % – у мозку (у терапевтичних дозах практично не впливає на центральну нервову систему). Максимальна концентрація Лопераміду в плазмі крові визначається через 4 години; період напіввиведення ($T_{1/2}$) складає 9-14 годин (у середньому 10,8 години). В об'ємі 5 % Лоперамід виводиться із сечею у формі метаболітів, 25 % – з калом, 70 % препарату знову всмоктується у кишечнику. Після всмоктування в об'ємі 30 % Лоперамід знову виводиться у кишечник, в об'ємі 40 % метаболізується у печінці і у формі кон'югатів виводиться з жовчею. При нормальній функції печінки рівні Лопераміду в плазмі крові та в сечі низькі, при порушеннях функції печінки можливе збільшення доз препарату.

Елімінація відбувається шляхом окисного N-деметилування, яке є основним шляхом метаболічних перетворень лопераміду.

Показання для застосування.

Симптоматичне лікування гострої та хронічної діареї.

У пацієнтів з ілеостомою для зменшення частоти та об'єму випорожнень, а також для надання калу твердішої консистенції.

Протипоказання.

Препарат протипоказаний пацієнтам з підвищеною чутливістю до лопераміду гідрохлориду або до будь-якого з компонентів препарату.

Лоперамід не застосовують для первинної терапії пацієнтів з:

- гострою дизентерією, що характеризується наявністю крові у випорожненнях та гарячкою;
- виразковим колітом у разі загострення;
- бактеріальним ентероколітом, спричиненим мікроорганізмами роду *Salmonella*, *Shigella*, *Campylobacter* тощо;
- псевдомембранозним колітом, пов'язаним із застосуванням антибіотиків широкого спектра дії;
- запором, захворюваннями з порушенням перистальтики (паралітичний ілеус).

Лоперамід взагалі не слід застосовувати, якщо треба уникнути пригнічення перистальтики, та необхідно негайно припинити прийом, якщо розвивається запор, здуття живота або часткова кишкова непрохідність.

Препарат протипоказаний при вагітності, у період годування груддю, дітям до 6 років.

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Якщо при лікуванні препаратом розвивається запор, здуття живота, часткова кишкова непрохідність, необхідно відмінити препарат.

При гострій діарейі у випадку відсутності клінічного ефекту протягом 48 годин необхідно припинити прийом препарату і звернутися до лікаря.

Не слід призначати препарат на період більше 4 тижнів без можливості повторного лікарського огляду.

У пацієнтів з гіпертермією і при наявності крові в калі перед призначенням препарату необхідно встановити причину діарейі.

Препарат містить цукрозу, що слід враховувати хворим на цукровий діабет.

У хворих з діареєю, особливо у дітей, може виникнути дегідратація та дисбаланс електролітів. У таких випадках найважливішим заходом є застосування замісної терапії для поповнення рідини та електролітів.

При відсутності ефекту після 2-х діб застосування препарату необхідно уточнити діагноз.

Лоперамід з обережністю застосовувати пацієнтам з дисфункцією печінки. Такі пацієнти мають перебувати під ретельним наглядом для виявлення ознак токсичного ураження центральної нервової системи внаслідок високого ступеня метаболізму препарату при першому проходженні.

Особливі застереження.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату при вагітності протипоказано.

У разі необхідності застосування препарату в період лікування необхідно припинити годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Лоперамід не змінює швидкість реакції. Однак у разі виникнення втоми, сонливості або запаморочення не рекомендується керувати автомобілем або працювати зі складною технікою.

Діти.

Препарат не застосовують дітям віком до 6 років.

Спосіб застосування та дози.

Капсули ковтають не розжовуючи і запиваючи великою кількістю рідини.

Застосовують дорослим та дітям старше 6 років.

Гостра діарея:

початкова доза – 2 капсули (4 мг) для дорослих та 1 капсула (2 мг) для дітей; у подальшому – 1 капсула (2 мг) після кожного наступного рідкого випорожнення.

Термін лікування гострої діарейі – до 5 днів.

При гострій діарейі, якщо протягом 48 годин не спостерігається клінічного поліпшення, прийом препарату слід припинити.

Хронічна діарея:

початкова доза для дорослих – 2 капсули (4 мг) щоденно, для дітей – 1 капсула (2 мг) щоденно; ця доза коректується далі так, щоб частота твердих випорожнень становила 1-2 рази на добу, що зазвичай досягається при підтримуючій дозі 1-6 капсул (2 мг – 12 мг) щодня.

Максимальна добова доза при хронічній діареї для дорослих – 8 капсул (16 мг); для дітей вона повинна бути розрахована, виходячи з маси тіла дитини (3 капсули на 20 кг маси тіла дитини).

Передозування.

Симптоми (включаючи відносне передозування внаслідок дисфункції печінки). пригнічення центральної нервової системи (ступор, порушення координації рухів, сонливість, міоз, м'язовий гіпертонус, пригнічення дихання), запор та кишкова непрохідність. Діти більшою мірою чутливіші до впливу на центральну нервову систему, ніж дорослі.

Лікування: відміна препарату, промивання шлунка. Як антидот можна застосовувати налоксон. Оскільки тривалість дії Лоперамиду довші за дію налоксон (1-3 години), може знадобитися повторне введення налоксону (внутрішньовенно в дозі 0,4 мг/мл з 2-3-хвилинними інтервалами, багаторазово). Одразу ж після передозування вводять активоване вугілля та промивають шлунок; при необхідності підтримують функцію дихання. Для виявлення можливого пригнічення центральної нервової системи хворий має перебувати під ретельним наглядом не менше 48 годин.

Побічні ефекти.

Побічна дія спостерігається, як правило, тільки при тривалому застосуванні препарату. Можливі:
з боку шлунково-кишкового тракту: відчуття дискомфорту та біль у нижній ділянці живота, диспепсія, нудота та блювання, ілеус, метеоризм, запор, порушення дефекації, мегаколон та токсичний мегаколон, вкрай рідко – кишкова непрохідність;

з боку центральної нервової системи: підвищена втомлюваність, головний біль, сонливість або безсоння, запаморочення;

з боку сечостатевого тракту: утруднене сечовипускання (особливо у чоловіків зі збільшеною передміхуровою залозою), затримка сечі, сексуальна дисфункція (рідко);

з боку органа зору: неясність зору, погіршення стану при глаукомі;

алергічні реакції: реакції гіперчутливості (шкірні висипання, набряк, кропив'янка та у вкрай поодиноких випадках пухирчастий висип, що включає синдром Стівенса-Джонсона, мультиформну еритему та токсичний епідермальний некроліз), анафілактичний шок та анафілактоїдні реакції;

інші: ксеростомія, зниження потовиділення у сполученні з підвищеною температурою тіла.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Не рекомендується призначати Лоперамід разом з атропіном та іншими холінолітичними препаратами (щоб уникнути взаємного посилення ефектів), еритроміцином, метоклопрамідом. Колестирамін рекомендується призначати не пізніше ніж за 2 години до прийому Лоперамиду. Одночасне призначення Лоперамиду (в дозі 16 мг) разом із препаратами-інгібіторами Р-глікопротеїнів (квінідин, ритонавір) призводило до підвищення рівня лоперамиду гідрохлориду в плазмі в 2-3 рази. Клінічна значимість зазначеної фармакокінетичної взаємодії при застосуванні Лоперамиду в рекомендованих дозах (від 2 мг до 16 мг) невідома.

Крім препаратів з аналогічними фармакологічними властивостями, взаємодія з іншими препаратами невідома.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальному пакуванні при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 12 капсул в блістері, по 2 блістери у пачці;

по 12 капсул у блістері, по 5 блістерів у пачці;
по 12 капсул у блістері, по 10 блістерів у пачці;
по 30 або 50 капсул у контейнері по 1 контейнеру у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.