

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ЛОПЕРАМІД

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: 1 таблетка містить лопераміду гідрохлориду у перерахуванні на 100 % речовину – 2 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль картопляний; кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Таблетки білого або майже білого кольору, круглої форми, з плоскою поверхнею, з фаскою.

Назва та місцезнаходження виробника.

ПАТ «Київмедпрепарат», Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що пригнічують перистальтику.

Код АТС А07D А03.

Лоперамід має антидіарейну активність. Взаємодіє з опіатними рецепторами стінки кишечника та блокує вивільнення ацетилхоліну і простагландину. Уповільнює перистальтику кишечника та збільшує час проходження кишкового вмісту. Препарат підвищує тонус анального сфінктера, сприяє утриманню калових мас та зменшенню частоти позивів до дефекації.

Лоперамід є високо специфічною речовиною для стінок кишечника, досягає системної циркуляції у обмеженому об'ємі, і практично не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр. Поріг центральної дії набагато перевищує дозу, що має максимальний ефект проти діареї. Дія настає швидко (через 1 годину після прийому таблеток внутрішньо 85 % лопераміду виявляється у шлунково-кишковому тракті, 5 % – у печінці) та триває 4-6 годин. Максимальна концентрація лопераміду у плазмі крові визначається через 4 години. Зв'язування з білками плазми крові – 97 %.

Виводиться здебільшого у вигляді кон'югатів з жовчю та фекаліями. Період напіввиведення у середньому становить 12 годин. При нирковій недостатності можливе підвищення концентрації лопераміду у сироватці крові.

Показання для застосування. Симптоматичне лікування гострої та хронічної діареї різного генезу.

Можна рекомендувати у випадку виникнення «діареї мандрівника» з тривалістю лікування до 2-х діб. Тільки у випадку появи крові у випорожненнях застосування потрібно відкласти до з'ясування причин цього явища.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до лопераміду гідрохлориду або до будь-якого іншого компонента препарату. Непереносимість галактози, дефіцит лактази, синдром глюкозно-галактозної мальабсорбції.

Не застосовувати для первинної терапії пацієнтам із:

- гострою дизентерією, з наявністю крові у випорожненнях та пропасницею;
- гострим виразковим та псевдомембранозним колітом, що виникли внаслідок застосування антибіотиків широкого спектру дії;
- бактеріальним ентероколітом, спричиненим *Salmonella*, *Shigella* або *Campylobacter*;
- порушеннями функції печінки, необхідної для метаболізму препарату, оскільки це може призвести до відносного передозування.

Стани, при яких є небажаним пригнічення перистальтики, через можливий ризик

виникнення значних ускладнень, включаючи кишкову непрохідність, мегаколон і токсичний мегаколон.

Необхідно негайно припинити прийом препарату, якщо розвивається запор, здуття живота або часткова кишкова непрохідність.

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Лікування діареї носить симптоматичний характер. Якщо можна визначити етіологію захворювання (або зазначено, що потрібно це зробити), то у разі можливості слід проводити специфічне лікування (препарат не замінює антибактеріального лікування при інфекційних захворюваннях).

Під час лікування діареї (особливо у дітей) необхідно поповнювати втрату рідини та електролітів та дотримуватися дієти.

З обережністю слід застосовувати препарат при зневодненні організму, пацієнтам літнього віку (ризик втрати рідини та електролітів).

Пацієнтам із синдромом набутого імунodefіциту, які приймають препарат при діареї, необхідно припинити лікування при появі перших ознак здуття живота. Існують окремі повідомлення про випадки появи токсичного мегаколону у пацієнтів, хворих на СНІД, з інфекційними колітами як вірусного, так і бактеріального походження, при лікуванні лоперамідом.

Хоча фармакокінетичні дані для пацієнтів з порушенням функції печінки відсутні, таким пацієнтам лоперамід слід застосовувати з обережністю через уповільнення метаболізму першого проходження. Пацієнтам з порушенням функції печінки слід перебувати під ретельним наглядом з метою своєчасного виявлення ознак токсичного ураження центральної нервової системи.

З обережністю слід застосовувати лоперамід пацієнтам у випадках загострення виразкового коліту. Лікарські препарати, що подовжують час проходження, можуть призвести до розвитку токсичного мегаколону у пацієнтів цієї групи.

Зважаючи на те, що препарат добре метаболізується, лоперамід або його метаболіти виводяться з фекаліями, зазвичай не потрібно коригувати дозу лоперамід у пацієнтів з порушенням функції нирок.

Особливі застереження.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Незважаючи на відсутність даних про тератогенні та ембріотоксичні властивості лоперамід у, призначати препарат у період вагітності, особливо в I триместрі, слід тільки у випадку, коли очікуваний терапевтичний ефект для матері перевищує потенційний ризик для плода/дитини.

Лоперамід у невеликій кількості проникає в грудне молоко, тому при необхідності застосування препарату годування дитини груддю рекомендується припинити.

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

Препарат зазвичай не впливає на швидкість психомоторних реакцій, однак у випадку виникнення слабкості, відчуття втоми, сонливості або запаморочення не рекомендується керувати автомобілем або працювати зі складною технікою.

Діти.

Дітям до 6 років препарат протипоказаний.

Спосіб застосування та дози.

Лоперамід призначати внутрішньо перорально. Лоперамід не призначений для початкової терапії серйозної діареї, що супроводжується зниженням рівнів рідини та електролітів. Зокрема у дітей цю втрату бажано компенсувати завдяки призначенню замісної терапії парентерально або перорально.

При гострій діарейі початкова доза для дорослих становить 2 таблетки (4 мг), для дітей віком від 6 років – 1 таблетка (2 мг); у подальшому – 1 таблетка (2 мг) після кожного наступного рідкого випорожнення.

При хронічній діарейі початкова доза для дорослих становить 2 таблетки (4 мг) щоденно, для дітей віком від 6 років – 1 таблетка (2 мг) щоденно. Ця доза коригується далі так, щоб частота твердих випорожнень становила 1-2 рази на добу, що зазвичай досягається при підтримуючій дозі 1-6 капсул (2-12 мг) на добу.

Максимальна добова доза при гострій та хронічній діарейі для дорослих становить 8 таблеток (16 мг); для дітей вона має бути розрахована, виходячи з маси тіла дитини (3 таблетки на 20 кг маси тіла дитини).

При гострій діарейі, якщо протягом 48 годин не спостерігається клінічного покращення, прийом лоперамиду гідрохлориду слід припинити.

Застосування для лікування хворих літнього віку.

Не потрібна корекція дози для пацієнтів літнього віку.

Застосування при порушенні функції нирок.

Не потрібна корекція дози для пацієнтів із порушенням функції нирок.

Застосування при порушенні функції печінки.

Хоча фармакокінетичні дані про дію лоперамиду у пацієнтів з порушенням функції печінки відсутні, таким пацієнтам потрібно призначати препарат з обережністю через уповільнення у них метаболізму першого проходження (див. розділ «Належні заходи безпеки при застосуванні»).

Передозування.

Симптоми: пригнічення центральної нервової системи (ступор, порушення координації, сонливість, міоз, м'язовий гіпертонус, пригнічення дихання), затримка сечі та комплекс симптомів, подібних до кишкової непрохідності. Діти більш чутливі до впливу на центральну нервову систему у зв'язку з тим, що у них гематоенцефалічний бар'єр ще не функціонує повною мірою.

Лікування: при передозуванні препаратом одразу ввести активоване вугілля і промити шлунок. У якості антидота застосувати налоксон (внутрішньовенно у дозі 0,4 мг/мл із 2-3 хвилининими інтервалами, багаторазово, оскільки тривалість дії лоперамиду гідрохлориду більша за налоксон (1-3 години)). Необхідним є посилений нагляд у перші 48 годин. При необхідності слід підтримувати функцію дихання.

Побічні ефекти.

Алергічні реакції: висип, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, бульозні висипання, синдром Стівенса-Джонсона, мультиформна еритема та токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла), а також тяжкі реакції гіперчутливості, включаючи анафілактичний шок та анафілактоїдні реакції.

З боку травного тракту: запор, метеоризм, сухість у роті, спазми і коліки у животі, абдомінальний біль, кишкова непрохідність, нудота, блювання, мегаколон, включаючи токсичний мегаколон; диспепсія.

З боку сечовивідних шляхів: затримка сечі.

З боку нервової системи: запаморочення, головний біль, втрата свідомості, пригнічення свідомості, тремор.

З переліку вищезгаданих побічних реакцій під час прийому препарату можуть проявлятися симптоми, характерні для діарейного синдрому (абдомінальний біль/дискомфорт, нудота, блювання, сухість у роті, відчуття втоми, сонливість, запаморочення, метеоризм). Тому дуже важко відрізнити ці симптоми та прояви побічних ефектів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Противірибкові препарати. Ітраконазол значно (у 3-4 рази) підвищує пікову концентрацію

лопераміду у плазмі крові, а також подовжує період напіввиведення препарату. Одночасний прийом лопераміду і кетоконазолу підвищує рівень в сироватці крові лопераміду у 5 разів, але це не призводить до збільшення фармакодинамічних ефектів препарату.

Гіполіпідемічні засоби. Одночасний прийом лопераміду і гемфіброзилу у 2 рази підвищує концентрацію лопераміду в крові і подовжує його період напіввиведення.

Комбінація ітраконазолу і гемфіброзилу при одночасному застосуванні з лоперамідом призводить до підвищення рівня лопераміду у сироватці крові в 4 рази і в 13 разів збільшує час знаходження препарату в сироватці крові, але ці показники не впливають на функцію центральної нервової системи.

Інгібітори Р-глікопротеїнів. Одночасне застосування лопераміду (в дозі 16 мг) разом з ритонавіром або хінідином може призвести до підвищення рівня лопераміду у плазмі крові у 2-3 рази.

Антибактеріальні препарати. Використання ко-тримоксазолу підвищує біодоступність лопераміду.

Антиаритмічні препарати. Одночасне застосування хінідину і лопераміду може призводити до пригнічення функції дихання.

Гормони гіпоталамуса, гіпофіза, гонадотропні гормони і їх антагоністи. Застосування десмопресину і лопераміду призводить до підвищення рівня десмопресину в сироватці крові у 2 рази за рахунок його підвищеного всмоктування у кишково-шлунковому тракті.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 2 блістери у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.