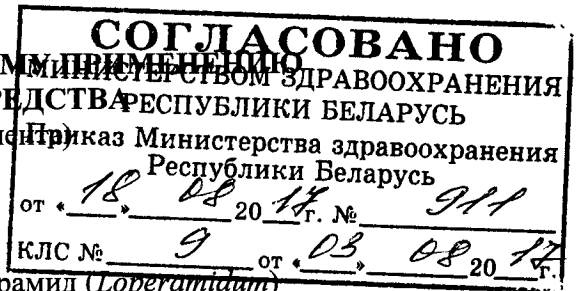


**ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ**
(информация для пациентов)

**НАЗВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА**

Торговое название: ЛОПЕРАМИД ГРИНДЕКС

Международное непатентованное название: Лоперамид (*Loperamidum*)**ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА****Описание**

Твердые желатиновые капсулы. Корпус розового цвета, крышечка темно-зеленого цвета.

СОСТАВ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

1 капсула содержит:

активное вещество: лоперамида гидрохлорид 2 мг,*вспомогательные вещества*: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, магния стеарат.Капсула:*корпус*: титана диоксид (E 171), краситель синий патентованный V (E 131), краситель пунцовый 4R (E 124), желатин,*крышечка*: титана диоксид (E 171), краситель хинолиновый желтый (E 104), краситель синий патентованный V (E 131), краситель железа оксид желтый (E 172), желатин.**ФОРМА ВЫПУСКА**

Капсулы.

КОД КЛАССИФИКАЦИИ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

Противодиарейные средства. Средства, снижающие перистальтику ЖКТ.

Код АТХ: A07DA03

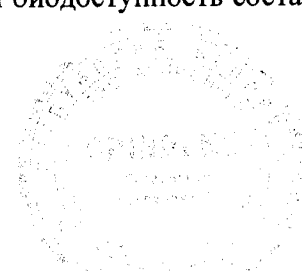
ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**Фармакодинамика**

Лоперамид связывается с опиатными рецепторами в стенке кишечника. В результате этого он ингибирует высвобождение ацетилхолина и простагландинов, уменьшая пропульсивную перистальтику и удлиняя время транзита содержимого кишечника. Лоперамид повышает тонус анального сфинктера, уменьшая недержание и необходимость дефекации.

В связи с высоким аффинитетом к стенкам кишечника и быстрым метаболизмом, лоперамид попадает в кровоток в очень малом количестве.

ФармакокинетикаВсасывание

После применения внутрь лоперамид всасывается из кишечника, однако в результате выраженного метаболизма первого прохождения системная биодоступность составляет около 0,3 %.



Распределение

Лоперамиду присущ высокий аффинитет к рецепторам продольной мускулатуры стенки кишечника. 95 % активного вещества связывается с белками плазмы, главным образом, альбуминами. Лоперамид является субстратом Р-гликопротеина.

Биотрансформация

Лоперамид почти полностью выделяется из организма через печень, где он метаболизируется, конъюгируется и выводится с желчью. Окислительное N-деметилирование является главным путем метаболизма лоперамида и осуществляется посредством CYP3A4 и CYP2C8.

Выведение

Полупериод выведения лоперамида составляет 11 часов (в интервале от 9 до 14 часов). Неизменный лоперамид и его метаболиты выделяются, главным образом, с фекалиями.

ПОКАЗАНИЯ ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ

Симптоматическое лечение острой диареи у взрослых и детей старше 12 лет.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Капсулы принимают внутрь, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Взрослые и дети старше 12 лет

Начальная доза – 2 капсулы (4 мг), далее применяют по 1 капсуле (2 мг) после каждого жидкого опорожнения живота. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 капсул (12 мг).

Дети младше 12 лет: препарат нельзя применять.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с нарушениями функции почек коррекция дозы не нужна.

Пациенты с нарушениями функции печени. Хотя фармакокинетические данные о действии препарата у пациентов с нарушениями функции печени отсутствуют, таким пациентам необходимо назначать препарат с осторожностью из-за замедления у них метаболизма первого прохождения.

Продолжительность применения не должна превышать 48 часов. Если симптомы не уменьшаются в течение двух дней, следует прекратить прием препарата и обратиться к врачу. Если опорожнение живота нормализуется раньше, применение препарата следует прекратить.

Если Вы пропустили очередной прием препарата, примите его незамедлительно. Не применяйте двойную дозу для замены пропущенной. Продолжайте прием согласно рекомендациям врача.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

При применении лоперамида чаще всего сообщалось о таких побочных действиях, как запор, накопление газов, головная боль и тошнота.

Далее перечисленные побочные действия упорядочены в соответствии с базой данных классификации систем органов и частоты встречаемости MedDRA: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10\ 000$), неизвестно (нельзя определить по имеющимся данным).

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Со стороны иммунной системы

Редко: реакция повышенной чувствительности, анафилактическая реакция (в том числе анафилактический шок), анафилактоидная реакция.

Со стороны нервной системы

Часто: головная боль.

Нечасто: сонливость, головокружение.

Редко: потеря сознания, ступор, подавленный уровень сознания, гипертония, нарушения координации.

Со стороны глаз

Редко: миоз.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: запор, тошнота, накопление газов.

Нечасто: боли в животе, ощущение дискомфорта в животе, ощущение сухости во рту, боль в верхнем отделе живота, рвота, диспепсия.

Редко: илеус (в том числе паралитический илеус), мегаколон (в том числе токсический мегаколон), глоссодиния, вздутие живота.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: высыпания.

Редко: буллезная сыпь (в том числе синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и *erythema multiforme*), ангионевротический отек, крапивница, зуд.

Со стороны почек и мочевыводящих путей

Редко: задержка мочи.

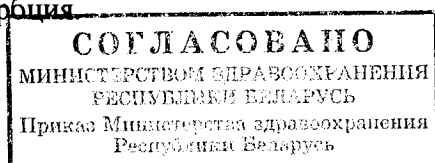
Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко: усталость.

При появлении перечисленных побочных реакций, а также при появлении побочной реакции, не упомянутой в инструкции, необходимо обратиться к врачу.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Повышенная чувствительность к любому компоненту препарата;
- дивертикулез;
- кишечная непроходимость (в т.ч. при необходимости избегать подавления перистальтики), мегаколон и токсический мегаколон;
- острый язвенный колит или псевдомембранозный колит, связанный с применением антибиотиков широкого спектра действия;
- бактериальный энтероколит, вызванный микроорганизмами семейства *Salmonella*, *Shigella* и *Campylobacter*;
- нарушения функции печени, необходимой для метаболизма препарата, так как это может привести к относительной передозировке;
- острая диарея с сопутствующей лихорадкой и испражнениями с примесью крови;
- беременность (I триместр) и кормление грудью;
- детский возраст до 12 лет;
- дефицит лактазы, непереносимость галактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция



ПЕРЕДОЗИРОВКА

При передозировке лоперамидом могут возникать следующие симптомы:

- угнетение центральной нервной системы (ступор, нарушения координации движений, сонливость, миоз, мышечный гипертонус, угнетение дыхания). Дети более чувствительны к влиянию на центральную нервную систему в связи с тем, что у них гематоэнцефалитический барьер еще не функционирует полной мерой;
- задержка мочи и комплекс симптомов, подобных кишечной непроходимости;
- серьезные побочные действия со стороны сердечно-сосудистой системы, включающие удлинение интервала QT, *torsades de pointes* и другие желудочковые аритмии, остановку сердца, обмороки и смерть.

Лечение симптоматическое, активированный уголь, промывание желудка, искусственная вентиляция легких. При развитии симптомов кардиотоксичности необходимо проводить фармакотерапию нарушений сердечного ритма антиаритмическими препаратами или решить вопрос о проведении электрической стимуляции сердца или кардиоверсии. Антidot – налоксон; учитывая то, что продолжительность действия лоперамида больше, чем у налоксона, возможно повторное введение последнего.

В случае передозировки препарата необходимо медицинское наблюдение, по крайней мере, в течение 48 часов.

МЕРЫ ПРЕДОСТОРОЖНОСТИ

Возможный риск от неправильного применения лоперамида может быть значительно снижен при условии ограничения длительности применения 48 часами, исключения применения детям до 12 лет, а также в случае повышенной температуры или при наличии крови в стуле.

В процессе лечения лоперамидом необходимо соблюдать соответствующую диету и выбирать оптимальный режим приема жидкости.

Больным, страдающим воспалительными заболеваниями кишечника, при вздутии живота применение препарата следует сразу же прекратить, поскольку это является одним из признаков токсического мегаколона.

Снижение перистальтики кишечника под влиянием лоперамида может усиливать проникновение некоторых штаммов микроорганизмов в слизистую кишечника и вследствие этого продлить диарею с сохранением повышенной температуры.

Следует с осторожностью применять лоперамид у пациентов, склонных к удлинению интервала QT, *torsades de pointes* и другим серьезным аритмиям, или которые принимают ингибиторы цитохрома CYP3A4, CYP2C8, P-гликопротеина, так как это может вызвать усиление побочных действий.

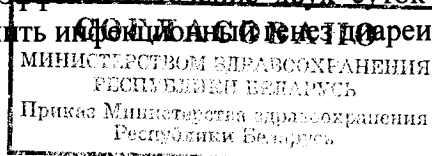
Пациентов с нарушениями функции печени следует предупредить о возможном угнетающем действии препарата на ЦНС из-за накопления лоперамида в организме.

У пациентов с нарушениями функции почек корректировка дозы лоперамида обычно не требуется, так как он и его метаболиты выводятся в основном с фекалиями.

У пациентов пожилого возраста и детей старше 12 лет возможно маскирование симптомов обезвоживания и изменение реакции на лоперамид. Поэтому во время лечения диареи (особенно у детей) необходимо пополнять потерю жидкости и электролитов. Лоперамид может вызвать задержку мочеиспускания у детей.

Не следует превышать рекомендуемую дозу препарата. При передозировке лоперамидом могут развиваться серьезные побочные действия.

При отсутствии эффекта в течение двух суток приема препарата следует уточнить диагноз и исключить инфекционную природу диареи.



В состав капсул входит краситель пунцовый 4R (E 124), который может вызвать аллергические реакции. Капсулы содержат также лактозу, поэтому препарат не следует применять пациентам с непереносимостью лактозы, галактоземией и с нарушением всасывания глюкозы/галактозы.

Применение в период беременности или кормления грудью. Несмотря на отсутствие данных о тератогенных и эмбриотоксических свойствах препарата, назначать лоперамид в период беременности, особенно в I триместре, можно только в том случае, если ожидаемый терапевтический эффект превышает потенциальный риск для плода/ребенка.

Лоперамид в небольших количествах проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата следует прекратить кормление грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. Лоперамид обычно не влияет на способность к работе с техникой и на управление транспортом, однако при появлении повышенной утомляемости, сонливости или головокружения не рекомендуется управлять автотранспортом или работать с другими механизмами.

Дети. Детям до 12 лет лоперамид противопоказан. Применение детям от 12 лет следует контролировать взрослыми (пополнение потери жидкости и электролитов).

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Сопутствующие лекарственные средства могут действовать синергически, повышая концентрацию лоперамида в крови и блокируя пути его выведения. Это приводит к усилению фармакологического действия лоперамида и его побочного действия.

Ингибиторы P-гликопротеина

Одновременное применение лоперамида (в разовой дозе 16 мг) с ингибиторами P-гликопротеина, хинидином или ритонавиром, вызывало повышение концентрации лоперамида в плазме крови в 2-3 раза.

Итраконазол и гемфиброзил

Одновременное применение лоперамида (разовая доза 4 мг) с итраконазолом, который является ингибитором CYP3A4 и P-гликопротеина, вызывало большую концентрацию лоперамида в плазме в 3-4 раза. Ингибитор CYP2C8, гемфиброзил, увеличивал концентрацию лоперамида в плазме приблизительно в 2 раза. При комбинировании итраконазола и гемфиброзила максимальная концентрация лоперамида в плазме увеличивалась в 4 раза, но общее действие в плазме увеличивалось в 13 раз.

Кетоконазол

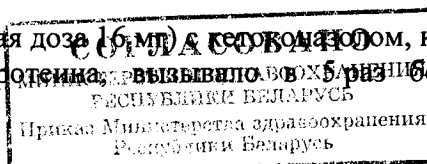
Одновременное применение лоперамида (разовая доза 16 мг) с кетоконазолом, который является ингибитором CYP3A4 и P-гликопротеина, вызывало в 5 раз большую концентрацию лоперамида в плазме.

Десмопрессин

Одновременное применение внутрь с десмопрессин^{ом} вызывало в 3 раза большую концентрацию десмопрессина в плазме, что, возможно, связано с увеличенной подвижностью желудочно-кишечного тракта.

Антихолинергические средства

Антихолинергические средства замедляют деятельность желудка и кишечника, они могут усилить действие лоперамида.



Опиатные анальгетические средства

Одновременное применение опиатных анальгетических средств с лоперамидом может привести к образованию запора.

Ко-тримоксазол

Одновременное применение с ко-тримоксазолом увеличивает биодоступность лоперамида, что приводит к усилению его действия.

УСЛОВИЯ И СРОК ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения – 5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Без рецепта.

УПАКОВКА

По 10 капсул в блистере из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 1 блистеру вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке из картона.

ИНФОРМАЦИЯ О ПРОИЗВОДИТЕЛЕ (ЗАЯВИТЕЛЕ)

АО «Гриндекс».

Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

Телефон: +371 67083205

Факс: +371 67083505

Электронная почта: grindeks@grindeks.lv

Дата последней корректировки текста: май 2017 г.

