

СОГЛАСОВАНО

“Научный центр экспертизы лекарств  
и медицинских технологий” АОЗТ МЗ РА

Директор \_\_\_\_\_ Топчян А.В.

УТВЕРЖДЕНО  
Председатель Фармакологического совета МЗ РА

В. Амроян

“ 02 ” 02 2014 г

**ЛИСТОК-ВКЛАДЫШ**  
(Информация для потребителей)

**ЛОПЕРАМИД**  
2 мг капсулы для приема внутрь

Регистрационное свидетельство в РА: №

Торговое название препарата – Лоперамид

Международное (непатентованное) название препарата – Лоперамид (Loperamide)

Лекарственная форма: капсулы для приема внутрь.

**Общая характеристика**

*Основные физико-химические свойства*

Твердые желатиновые капсулы (корпус – коричневый, крышечка – розовая), содержащие гранулы белого или почти белого цвета.

**Состав**

Одна капсула содержит:

**активное вещество:** лоперамида гидрохлорид - 2 мг;

**вспомогательные вещества:** микрокристаллическая целлюлоза, натрия крахмала гликолат, магния стеарат.

**Химическое название и CAS номер**

4-(4-*p*-Хлорфенил-4-гидроксипиперидин)-*NN*-диметил-2,2-дифенилбутириамида гидрохлорид;  
4552-83-5.

**Фармакологическая группа и код АТХ**

Противодиарейное средство; А07DA03.

**Фармакологическое действие**

Механизм действия обусловлен связыванием лоперамида с опиоидными рецепторами в стенке кишечника. ЛОПЕРАМИД ингибирует высвобождение ацетилхолина и простагландинов, снижая перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику.

Повышает тонус анального сфинктера, способствуя лучшему удерживанию каловых масс и уменьшая императивные позывы к дефекации.

**Фармакокинетика**

**Всасывание:** после приема препарата внутрь абсорбция лоперамида составляет 40%.

**Метаболизм:** подвергается интенсивному метаболизму в процессе окислительного *N*-деметилирования при "первом прохождении" через печень.

**Распределение:** связывание с белками плазмы - около 95%, преимущественно с альбуминами.  
**Выведение:** выводится в форме конъюгированных метаболитов с калом. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) составляет в среднем 10 ч.

### Показания

- Симптоматическое лечение острой и хронической диареи (за исключением хронической диареи у детей).
- Колостома или илеостома (с целью уменьшения частоты дефекаций и объема стула).

### Способ применения и дозы

У **взрослых** при **острой диарее** первая доза ЛОПЕРАМИДа составляет 4 мг (2 капсулы), в дальнейшем после каждого эпизода жидкого стула принимают по 2 мг (по 1 капсуле) [но суточная доза не должна превышать 16 мг (8 капсул)].

У **взрослых** при **хронической диарее** начальная доза ЛОПЕРАМИДа составляет 4-8 мг, разделенная на несколько приемов. Максимальная суточная доза - 16 мг. В том случае, если в течение 10 дней применения ЛОПЕРАМИДа в дозе 16 мг не отмечается клинического улучшения, прием препарата следует прекратить и проконсультироваться с врачом.

У **детей при острой диарее в возрасте от 8-12 лет** доза ЛОПЕРАМИДА составляет 2 мг 4 раза в день в течение до 5 дней; **от 12-18 лет** - первоначально 4 мг, затем 2 мг после каждого жидкого стула на срок до 5 дней (обычная доза 6 - 8 мг в день; максимум 16 мг в день).

### Противопоказания

- Повышенная чувствительность к лоперамиду и другим компонентам препарата.
- Язвенный колит в стадии обострения.
- Острая дизентерия, которая характеризуется стулом с примесью крови и высокой температурой.
- Бактериальный энтероколит, вызванный инвазивными микроорганизмами, в том числе *Salmonella*, *Shigella* и *Campylobacter*;
- Псевдомембранозный колит, ассоциированный с терапией антибиотиками широкого спектра действия.
- Замедление перистальтики (из-за возможного риска серьезных осложнений, таких как кишечная непроходимость, мегаколон, токсический мегаколон. при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости применение препарата необходимо немедленно отменить).
- Дивертикулез.
- Применение в педиатрии при хронической диарее.
- Детский возраст до 8 лет при острой диарее.
- Бактериальный энтероколит, вызванный инвазивными организмами, включая *Salmonella spp.*, *Shigella spp.*, *Campylobacter spp.*
- Беременность, кормление грудью.

### Беременность и кормление грудью

ЛОПЕРАМИД противопоказан к применению во время беременности и в период кормления грудью.

### Побочные реакции

**Со стороны пищеварительной системы:** запор, вздутие живота, кишечная колика, боль или дискомфорт в животе, тошнота, рвота, сухость во рту; в отдельных случаях - кишечная непроходимость (особенно у детей и при несоблюдении рекомендуемого режима дозирования).

**Со стороны ЦНС и периферической нервной системы:** утомляемость, сонливость, головокружение.

**Аллергические реакции:** кожная сыпь.

**Прочие:** редко - задержка мочи.

### **Передозировка**

**Симптомы:** признаки угнетения функции ЦНС (ступор, нарушения координации, сонливость, миоз, гипертонус скелетных мышц, угнетение дыхания), кишечная непроходимость.

**Лечение:** промывание желудка, назначение активированного угля (не позже чем через 3 ч после приема ЛОПЕРАМИДа), искусственная вентиляция легких, проведение симптоматической терапии. Антидот - налоксон. Т.к. продолжительность действия ЛОПЕРАМИДа больше чем у налоксона (1-3 ч), может потребоваться повторное назначение последнего. Для выявления возможного угнетения ЦНС больной должен находиться под тщательным наблюдением по крайней мере в течение 48 ч.

### **Особые указания**

Применение ЛОПЕРАМИДа не заменяет проведение этиотропной терапии диареи, а также не отменяет необходимость компенсации нарушений водно-электролитного баланса.

В случае развития в ходе терапии запора, метеоризма или явлений, характерных для кишечной непроходимости, прием ЛОПЕРАМИДа немедленно прекращают.

При острой диарее, в том случае, если в течение 48 ч применения ЛОПЕРАМИДа не отмечается клинического улучшения, прием препарата следует прекратить и проконсультироваться с врачом. При наличии синдрома раздражения толстой кишки препарат принимать только после консультации с врачом и установления точного диагноза.

У пациентов с нарушениями функции печени во время лечения ЛОПЕРАМИДОМ проводят тщательное медицинское наблюдение (с целью исключить возможность токсического поражения ЦНС).

**Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами:** ЛОПЕРАМИД не нарушает быстроту психомоторных реакций, однако в случае возникновения таких побочных действий препарата, как чувство усталости, сонливость или головокружение, пациентам не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания.

### **Лекарственное взаимодействие**

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-гликопротеин, концентрация лоперамида в плазме крови увеличивается 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 СУР3А4 и Р-гликопротеина, приводит к увеличению плазменной концентрации лоперамида в 3 – 4 раза. В этом же исследовании применение ингибитора СУР2С8, гемфиброзила, приводило к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. Комбинация итраконазола и гемфиброзила в 4 раза увеличила пиковую концентрацию лоперамида в плазме крови и в 13 раз увеличила общую экспозицию в плазме крови. Это повышение не было ассоциировано с действием на центральную нервную систему (ЦНС), функцию которой оценивали по психомоторным тестам (т. е. субъективной оценке сонливости и тесту замены цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и кетоконазола, ингибитора СУР3А4 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 применении десмопрессина внутрь, 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 эффекты лоперамида, а препараты, увеличивающие скорость прохождения через желудочно-кишечный тракт, могут уменьшать эффекты лоперамида.

### **Условия хранения**

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от влаги и света месте при температуре 15-25<sup>0</sup>С.

### **Срок хранения**

Срок годности - 3 года. Не использовать после истечения срока годности.

### **Условия отпуска**

Отпускается без рецепта.

### **Упаковка**

Картонная упаковка, содержащая 10 капсул (1 блистер по 10 капсул).

### **Производитель**

**ООО “АРПИМЕД”**

Республика Армения, Котайки марз, г. Абовян, 2-ой мкр, дом 19

Тел.: 374 (222) 21703, 21740 Факс: 374 (222) 21924

### **Владелец регистрационного удостоверения**

**ООО “АРПИМЕД”**

Республика Армения, Котайки марз, г. Абовян, 2-ой мкр, дом 19

Тел.: 374 (222) 21703, 21740 Факс: 374 (222) 21924