

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**Лоперамид ШТАДА**

**Регистрационный номер:** P N002271/01

**Торговое наименование:** Лоперамид ШТАДА

**Международное непатентованное наименование:** лоперамид

**Лекарственная форма:** капсулы

**Состав на одну капсулу:**

*действующее вещество:* лоперамида гидрохлорид – 2,0 мг;

*вспомогательные вещества:* лактоза, крахмал картофельный, кальция стеарат; капсулы твердые желатиновые (титана диоксид, краситель хинолиновый желтый, краситель азорубин, краситель синий патентованный, краситель бриллиантовый черный, желатин).

**Описание**

Твердые желатиновые капсулы зеленого цвета № 3. Содержимое капсул – порошок белого или почти белого с желтоватым оттенком цвета.

**Фармакотерапевтическая группа:** противодиарейное средство.

**Код АТХ:** A07DA03

**Фармакологические свойства**

***Фармакодинамика***

Лоперамид, связываясь с опиоидными рецепторами в стенке кишечника, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, замедляя таким образом перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику. Повышает тонус анального сфинктера, уменьшая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

***Фармакокинетика***

Большая часть лоперамида всасывается в кишечнике, но вследствие активного пресистемного метаболизма системная биодоступность составляет примерно 0,3 %.

Данные доклинических исследований свидетельствуют о том, что лоперамид является субстратом Р-гликопротеина. Связывание лоперамида с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) составляет 95 %.

Лоперамид преимущественно метаболизируется в печени, конъюгируется и выделяется с желчью. Окислительное N-деметилование является основным путём метаболизма лоперамида и осуществляется преимущественно при участии изоферментов CYP3A4 и CYP2C8. Вследствие активного пресистемного метаболизма концентрация неизменённого лоперамида в плазме крови ничтожно мала.

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 часов, варьируя от 9 до 14 часов. Неизменённый лоперамид и его метаболиты выводятся преимущественно с калом.

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 (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;
- детский возраст до 6 лет;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- беременность (первый триместр);
- период грудного вскармливания.

Лоперамид ШТАДА нельзя применять в качестве основной терапии:

- у пациентов с острой дизентерией, которая характеризуется стулом с примесью крови и высокой температурой;
- у пациентов с язвенным колитом в стадии обострения;
- у пациентов с бактериальным энтероколитом, вызванным патогенными микроорганизмами, в том числе *Salmonella*, *Shigella* и *Campylobacter*;
- у пациентов с псевдомембранозным колитом, связанным с терапией антибиотиками широкого спектра действия.

Лоперамид ШТАДА не следует применять в случаях, когда замедление перистальтики

нежелательно из-за возможного риска развития серьёзных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона. Лоперамид ШТАДА необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

### **С осторожностью**

Лоперамид ШТАДА следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени вследствие замедленного пресистемного метаболизма.

### **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

#### *Беременность*

Данные о том, что лоперамид обладает тератогенным или эмбриотоксическим действием, отсутствуют. Лоперамид ШТАДА противопоказан в первом триместре беременности. В период беременности препарат не рекомендуется применять без консультации с лечащим врачом. Препарат можно назначать только в том случае, если предполагаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

#### *Период грудного вскармливания*

Небольшое количество лоперамида может проникать в грудное молоко, поэтому препарат не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

### **Способ применения и дозы**

Внутрь, запивая водой.

#### ***Взрослые и дети старше 6 лет:***

*Острая диарея:* начальная доза – 2 капсулы (4 мг) для взрослых и 1 капсула (2 мг) для детей, далее по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации в случае жидкого стула.

*Хроническая диарея:* начальная доза – 2 капсулы (4 мг) в сутки для взрослых и 1 капсула (2 мг) для детей; далее начальная доза должна быть откорректирована таким образом, чтобы частота нормального стула составляла 1-2 раза в сутки, что обычно достигается при поддерживающей дозе от 1 до 6 капсул (2-12 мг) в сутки.

Максимальная суточная доза при острой и хронической диарее у взрослых – 8 капсул (16 мг); 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 препарат отменяют.

#### *Применение у детей*

Не применять препарат у детей до 6 лет.

### *Применение у пожилых пациентов*

При лечении пожилых пациентов корректировка дозы не требуется.

### *Применение у пациентов с нарушениями функции почек*

При лечении пациентов с нарушениями функции почек корректировка дозы не требуется.

### *Применение у пациентов с нарушениями функции печени*

Хотя фармакокинетические данные у пациентов с печёночной недостаточностью отсутствуют, у таких больных препарат следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»).

## **Побочное действие**

Нежелательные реакции – это нежелательные явления, для которых следует считать доказанной причинно-следственную связь с применением лоперамида на основе всесторонней оценки имеющейся информации о нежелательном явлении. В отдельных случаях довольно трудно достоверно установить причинно-следственную связь между приёмом лоперамида и возникновением перечисленных симптомов. Кроме того, поскольку клинические исследования проводятся в различных условиях, частота развития нежелательных реакций в клинических исследованиях одного препарата не может быть непосредственно сравнена с частотой развития нежелательных реакций в клинических исследованиях другого препарата и может не отражать частоту развития нежелательных реакций в клинической практике.

### По данным клинических исследований

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у  $\geq 1$  % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота. Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у  $< 1$  % пациентов, принимавших лоперамид при острой диарее: сонливость, головокружение, головная боль, сухость во рту, боль в животе, тошнота, рвота, запор, дискомфорт и вздутие живота, боль в верхних отделах живота, сыпь.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у  $\geq 1$  % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у  $< 1$  % пациентов, принимавших лоперамид при хронической диарее: головная боль, боль в животе, сухость во рту, дискомфорт в области живота, диспепсия.

### По данным спонтанных сообщений о нежелательных реакциях

Нижеперечисленные нежелательные реакции классифицировали следующим образом:

очень частые ( $\geq 10\%$ ), частые ( $\geq 1\%$  и  $< 10\%$ ), нечастые ( $\geq 0,1\%$  и  $< 1\%$ ), редкие ( $\geq 0,01\%$  и  $< 0,1\%$ ) и очень редкие ( $< 0,01\%$ , включая единичные сообщения).

#### *Нарушения со стороны иммунной системы*

Очень редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции, включая анафилактический шок, и анафилактоидные реакции.

#### *Нарушения со стороны нервной системы*

Очень редко: нарушение координации, угнетение сознания, гипертонус, потеря сознания, сонливость, ступор.

#### *Нарушения со стороны органа зрения*

Очень редко: миоз.

#### *Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта*

Очень редко: кишечная непроходимость (в том числе паралитическая кишечная непроходимость), мегаколон (в том числе токсический мегаколон).

#### *Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей*

Очень редко: ангионевротический отек, буллезная сыпь, включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и мультиформную эритему, зуд, крапивница.

#### *Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей*

Очень редко: задержка мочи.

#### *Общие расстройства*

Очень редко: утомляемость.

*Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.*

## **Передозировка**

### *Симптомы*

При передозировке (в том числе при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочи, кишечная непроходимость, признаки угнетения центральной нервной системы (ЦНС): ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, гипертонус мышц, угнетение дыхания. Дети могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые. У пациентов с передозировкой лоперамида наблюдались сердечные осложнения, такие как удлинение интервала QT и QRS комплекса, развитие тахисистолической желудочковой аритмии типа «пируэт» (torsade de pointes), другие серьезные желудочковые аритмии, остановка сердца

и обморок. Сообщалось также о летальных случаях. Передозировка может проявить ранее не диагностированный синдром Бругада.

### *Лечение*

При появлении симптомов передозировки в качестве антидота можно использовать налоксон. Поскольку длительность действия лоперамида больше, чем налоксона (1-3 часа), может потребоваться повторное применение налоксона. Поэтому необходимо тщательно наблюдать за состоянием пациента в течение не менее 48 часов с целью своевременного обнаружения признаков возможного угнетения ЦНС.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

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-гликопротеина, концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась 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 изофермента СYP3A4 и Р-гликопротеина, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови в 3-4 раза. В этом же исследовании применение ингибитора изофермента СYP2C8, гемфиброзила, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. При применении комбинации итраконазола и гемфиброзила пиковая концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 4 раза, а общая концентрация – в 13 раз. Это повышение не было связано с влиянием на ЦНС, что оценивалось по психомоторным тестам (т. е. субъективной оценке сонливости и тесту замены цифровых символов). Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и кетоконазола, ингибитора изофермента СYP3A4 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 пероральном приёме десмопрессина 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 действие лоперамида, а препараты, увеличивающие скорость прохождения через желудочно-кишечный тракт, могут уменьшать действие лоперамида.

### **Особые указания**

Лоперамид используется для симптоматического лечения диареи. В тех случаях, когда возможно установить причину диареи, необходимо проводить соответствующую терапию. У пациентов с диареей, особенно у детей, может иметь место потеря жидкости и электролитов. В таких случаях необходимо проводить соответствующую заместительную терапию (восполнение жидкости и электролитов).

При отсутствии эффекта после 2 суток лечения необходимо прекратить приём препарата, уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты со СПИДом, принимающие лоперамид для лечения диареи, должны прекратить приём препарата при первых признаках вздутия живота. Поступали единичные сообщения о запоре с повышенным риском развития токсического мегаколона у пациентов со СПИДом и инфекционным колитом вирусной и бактериальной этиологии, которым проводилась терапия лоперамидом.

Хотя данные о фармакокинетике лоперамида у пациентов с печёночной недостаточностью отсутствуют, у таких больных лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма, поскольку это может привести к относительной передозировке и токсическому поражению ЦНС.

Передозировка может проявить ранее не диагностированный синдром Бругада. Пациентам не следует превышать рекомендованную дозу препарата и длительность приёма.

Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности – не выбрасывайте его в сточные воды и на улицу! Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду!

### **Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами**

В период лечения следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как препарат может вызывать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

### **Форма выпуска**

Капсулы 2 мг.

По 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению лекарственного препарата в пачку из картона.

#### **Условия хранения**

При температуре не выше 25 °С в потребительской упаковке (пачке картонной).

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Срок годности**

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

#### **Условия отпуска**

Отпускают без рецепта.

#### **Производитель**

**ООО «Хемофарм», Россия**

249032, Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе, д. 62

Тел.: (48439) 90-500;

факс: (48439) 90-525

**Наименование и адрес юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение/ Организация, принимающая претензии**

АО «Нижфарм», Россия

603950, г. Нижний Новгород

ул. Салганская, 7

Тел.: (831) 278-80-88,

факс: (831) 430-72-28

Е-mail: [med@stada.ru](mailto:med@stada.ru).