

Инструкция по медицинскому применению  
(информация для специалиста)

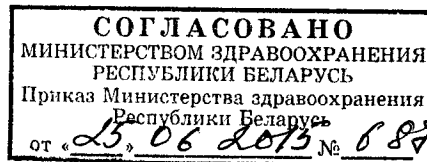
**1. Название лекарственного препарата**

Ларемид® 2 мг, таблетки

**2. Общая характеристика**

Международное непатентованное название

Loperamide



**Описание готовой лекарственной формы**

Таблетки белого или почти белого цвета, плоские с обеих сторон, с фаской.

**3. Состав лекарственного препарата**

1 таблетка содержит:

*Активное вещество:* 2 мг лоперамида гидрохлорида.

*Вспомогательные вещества:* лактоза моногидрат, кукурузный крахмал, повидон К-25, стеариновая кислота.

**4. Форма выпуска**

Таблетки

**5. Фармакотерапевтическая группа**

Противодиарейные средства, кишечные противовоспалительные /  
противоинфекционные средства. Средства, снижающие перистальтику желудочно-  
кишечного тракта.

Код АТХ: А07ДА03

**6. Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Лоперамид связывается с опиатными рецепторами клеток стенки кишечника, замедляет перистальтику кишечника и увеличивает время прохождения кишечного содержимого. Лоперамид повышает тонус анального сфинктера, одновременно уменьшает немедленную потребность в испражнении (позывы к дефекации).

Начало противодиарейного действия наблюдается в течение первого часа с момента приема однократной дозы 4 мг. Клинические испытания с применением других противодиарейных средств подтвердили, что действие лоперамида начинается и проявляется очень быстро.

**Фармакокинетика**

Лоперамид хорошо всасывается из кишечника, однако почти полностью захватывается и биотрансформируется печенью, где он конъюгируется и выделяется с желчью.

Период полувыведения лоперамида у человека составляет от 9 до 14 часов (в среднем 10,8 часов).

Испытания по распределению у крыс показали большое сродство лоперамида с клетками стенок кишечника и связывание преимущественно с рецепторами продольного слоя мышечной оболочки.

Выведение наступает в основном путем окислительного N-деметилирования, которое является основным путем биотрансформации лоперамида. Лоперамид в неизменной форме и его метаболиты выводятся в основном с калом.

### 7. Показания к применению

Препарат Ларемид® применяется для симптоматического лечения острой и хронической диареи различной этиологии.

### 8. Способ применения и дозы

Для приема внутрь.

#### Взрослые

##### Острая диарея

Первая доза 2 таблетки (4 мг), затем 1 таблетка (2 мг) после каждого жидкого стула.

##### Хроническая диарея

Начальная доза составляет 2 таблетки (4 мг) в сутки; начальную дозу следует модифицировать до момента появления от 1 до 2 эпизодов нормального стула в сутки, что обычно достигается путем применения поддерживающей дозы, составляющей 1 до 6 таблеток (2 до 12 мг) в сутки.

Максимальная доза при острой и хронической диарее составляет 8 таблеток (16 мг) в сутки.

#### Дети от 6 лет

##### Острая диарея

Первая доза 1 таблетка (2 мг), затем 1 таблетка (2 мг) после каждого жидкого стула.

##### Хроническая диарея

Начальная доза составляет 1 таблетка (2 мг) в сутки; начальную дозу следует модифицировать до момента появления от 1 до 2 эпизодов нормального стула в сутки, что обычно достигается путем применения поддерживающей дозы, составляющей 1 до 6 таблеток (2 до 12 мг) в сутки.

Максимальная доза при острой и хронической диарее следует установить в пересчете на массу тела (3 таблетки/20 кг м.т./сутки).

##### Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста нет необходимости в коррекции дозы.

##### Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с нарушением функции почек коррекция дозы не требуется.

##### Пациенты с нарушением функции печени

Отсутствуют данные по фармакокинетике препарата у пациентов с нарушением функции печени. У пациентов данной категории, препарат следует применять с осторожностью из-за возможности снижения пресистемного метаболизма лоперамида гидрохлорида.

### 9. Побочные действия

Частота развития нежелательных реакции определяется следующим образом: очень частые ( $\geq 1/10$ ), частые (от  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечастые (от  $\geq 1/1\ 000$  до  $< 1/100$ ), редкие (от  $\geq 1/10\ 000$  до  $< 1/1\ 000$ ) и очень редкие ( $< 1/10\ 000$ ).

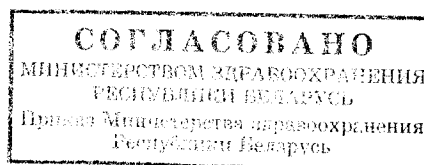
##### Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции (включая анафилактический шок), анафилактоидные реакции.

##### Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головная боль, головокружение.

Нечасто: сонливость.



Редко: потеря сознания, ступор, угнетенный уровень сознания, повышенный мышечный тонус, нарушения координации.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: запор, тошнота, метеоризм.

Нечасто: боль в животе, дискомфорт в животе, сухость во рту, боль в верхних отделах живота, рвота, диспепсия.

Редко: кишечная непроходимость (включая паралитическую кишечную непроходимость), мегаколон (включая токсический мегаколон, глоссит (чувство жжения и боли в языке), вздутие живота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: сыпь.

Редко: буллезная сыпь (включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и многоморфную эритему), ангионевротический отек, крапивница, зуд.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Редко: задержка мочи.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Редко: утомляемость.

## 10. Противопоказания

- Повышенная чувствительность к лоперамиду гидрохлориду или какому-либо вспомогательному веществу.
- Ларемид® не предназначен для лечения детей в возрасте младше 6 лет.
- Лекарственный препарат Ларемид® не следует применять в качестве основной терапии:
  - у пациентов с бактериальной дизентерией, которая характеризуется наличием крови в кале и высокой температурой тела;
  - у пациентов с острой фазой неспецифического язвенного колита;
  - у пациентов с бактериальным энтеритом и колитом, вызванным болезнетворными бактериями родов *Salmonella*, *Shigella* и *Campylobacter*;
  - у пациентов с псевдомембранозным колитом, связанным с приемом антибиотиков широкого спектра действия.

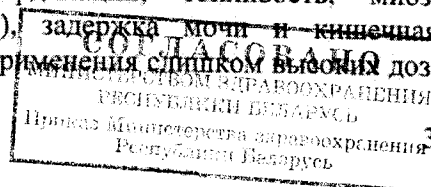
В общем, препарат Ларемид® не следует применять в случаях, когда следует избегать замедления перистальтики кишечника в связи с риском развития серьезных осложнений, включая кишечную непроходимость, гипертрофию толстого кишечника (*megacolon*) и токсическую толстокишечную дилатацию (*toxic megacolon*).

Лечение препаратом Ларемид® следует немедленно прекратить в случае появления запора, вздутия живота или симптомов кишечной непроходимости.

Применение при диарее препарата Ларемид® является исключительно симптоматическим лечением. В каждом случае, когда возможно установить этиологию и это является обоснованным (или показанным), следует применять этиологическую терапию.

## 11. Передозировка

В случае передозировки (также относительной – связанной с печеночной недостаточностью) может возникать: угнетение функции центральной нервной системы (ступор, нарушение двигательной координации, сонливость, миоз, повышенный тонус мышц и угнетение дыхания), задержка мочи и кишечная непроходимость. Неврологические симптомы после применения слишком высокой доз,



могут наступить особенно у детей, а также у лиц с угнетением функции центральной нервной системы (ЦНС).

При возникновении симптомов передозировки в качестве антидота можно ввести налоксон. Поскольку продолжительность действия налоксона короче продолжительности действия лоперамида, за пациентом следует наблюдать на протяжении 48 часов и, в случае развития симптомов угнетения функции ЦНС, повторить введение налоксона.

## 12. Меры предосторожности

Угнетение перистальтики кишечника может маскировать или усиливать симптомы дефицита воды и электролитов, особенно у детей. Поэтому при применении лоперамида следует вводить пациенту надлежащее количество воды и минеральных солей.

Поскольку продолжительная диарея может быть симптомом серьезных заболеваний, не следует применять лоперамид длительное время, пока причина диареи не будет установлена.

Если после приема препарата при острой диарее, в течение 48 часов не наблюдается улучшение клинического состояния пациента, применение препарата Ларемид® следует прекратить, и пациент должен обратиться к врачу.

Препарат следует осторожно применять у пациентов с печеночной недостаточностью. Лоперамид биотрансформируется во время первого прохождения через печень и, следовательно, у лиц с недостаточностью печени имеется риск повышенного токсического действия на ЦНС.

У пациентов с ВИЧ инфекцией, леченных лоперамидом по поводу диареи, следует прекратить применение препарата при появлении первых симптомов вздутия живота. Существуют единичные сообщения о случаях токсического мегаколона при применении лоперамида у пациентов с ВИЧ инфекцией и колитом как бактериальной, так и вирусной этиологии.

Поскольку большая часть препарата биотрансформируется в печени, а метаболиты или препарат в неизменном виде выводятся из организма с калом, корректировка дозы у пациентов с нарушением функции почек не требуется.

Учитывая содержание лактозы, препарат не должен применяться у пациентов с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

## Применение во время беременности и в период кормления грудью

Не проводились исследования по применению лоперамида в период беременности у людей. У животных эмбриотоксическое и тератогенное действие не подтверждено.

При беременности лоперамид следует применять только в случае крайней необходимости.

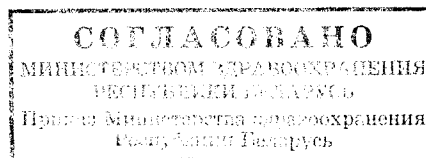
Очень малые количества лоперамида выводятся с грудным молоком, не рекомендуется применять препарат при грудном вскармливании.

## Влияние на способность управлять транспортными средствами или обслуживать механизмы

Учитывая возможность развития таких побочных эффектов как утомляемость, головокружение или сонливость, следует соблюдать осторожность при управлении автомобилем или работе со сложной техникой.

## 13. Взаимодействие с другими лекарственными средствами

У детей следует избегать одновременного применения лоперамида с лекарственными средствами, обладающими угнетающим действием на ЦНС.



Доклинические данные указывают на факт, что лоперамид является субстратом гликопротеина Р. Одновременное применение в однократной дозе 16 мг с хинидином или ритонавиром, которые являются ингибиторами Р-гликопротеина, вызывало 2-3-х кратное повышение концентрации лоперамида в плазме. Клиническое значение этих фармакокинетических взаимодействий ингибиторов Р-гликопротеина с лоперамидом, вводимым в рекомендуемых дозах (2 мг до 16 мг в сутки), остается неизвестным.

Одновременное применение лоперамида (4 мг однократно) и итраконазола, ингибитора СYP3A4 и Р-гликопротеина, приводило к 3-4 кратного увеличения концентрации лоперамида в плазме крови. В этом же исследовании ингибитор СYP2C8 гемфиброзил повышал содержание лоперамида примерно в 2 раза. Комбинированное применение итраконазола и гемфиброзила приводило к 4-кратному увеличению максимального содержания лоперамида в плазме крови и 13-кратному увеличению общей экспозиции в плазме крови. По результатам психомоторных тестов, это повышение не оказывало влияния на ЦНС.

Одновременный прием лоперамида (в дозе 16 мг однократно) и кетоконазола, ингибитора СYP3A4 и Р-гликопротеина, вызывал 5-кратное повышение концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не сопровождалось увеличением фармакодинамических эффектов, согласно данным пупилметрии.

Сопутствующее лечение десмопрессинном для перорального применения приводило к 3-кратному повышению концентрации десмопрессина в плазме крови, вероятно вследствие угнетения моторики желудочно-кишечного тракта.

Предполагается, что препараты со схожими фармакологическими свойствами могут усиливать действие лоперамида, а лекарственные средства, стимулирующие моторику желудочно-кишечного тракта, могут ослаблять его эффект.

#### 14. Условия хранения и срок годности

Хранить при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### Срок годности

3 года.

Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

#### 15. Условия отпуска

Отпуск из аптек без рецепта.

#### 16. Упаковка

По 10 или 30 таблеток в блистере из Ал/ПВХ.

1 блистер (по 10 таблеток) или 2 блистера (по 15 таблеток) вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

#### 17. Информация о производителе

Фармацевтический Завод «Польфарма» АО

Производственный отдел в Новой Дембе

ул. Шиповского 1, 39-460 Нова Демба, Польша

#### 18. Владелец регистрационного удостоверения

АО Варшавский фармацевтический завод Польфа

ул. Каролькова 22/24, 01-207 Варшава, Польша

