

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО
ПРЕПАРАТА
Имодиум® Экспресс

Регистрационный номер: П N016140/01

Торговое наименование: Имодиум® Экспресс

Международное непатентованное наименование – лоперамид

Лекарственная форма – таблетки-лиофилизат

Состав (на одну таблетку):

Действующее вещество: лоперамида гидрохлорид 2 мг.

Вспомогательные вещества: желатин, маннитол, аспартам, ароматизатор мятный, натрия гидрокарбонат.

Описание

Белые или почти белые, круглые лиофилизированные таблетки. На одной стороне таблетки допускается наличие выпуклости по центру, неровной шероховатой поверхности и неровных истонченных краев таблетки. На другой стороне таблетки – фаска, допускается шероховатость поверхности.

Фармакотерапевтическая группа – противодиарейное средство

Код АТХ – А07DA03.

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.

В результате клинического исследования были получены данные о том, что противодиарейный эффект наступает в течение одного часа после приема однократной дозы (4 мг).

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-деметилирование является основным путем метаболизма лоперамида и осуществляется преимущественно при участии ингибитора изоферментов СYP3A4 и СYP2C8. Вследствие активного пресистемного метаболизма концентрация неизмененного лоперамида в плазме крови ничтожно мала.

У человека период полувыведения лоперамида составляет в среднем 11 часов, варьируя от 9 до 14 часов. Неизмененный 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), а также симптоматическое лечение острых эпизодов диареи, связанных с синдромом раздраженного кишечника (СРК), у пациентов старше 18 лет после поставленного врачом диагноза. В качестве

вспомогательного лекарственного средства при диарее инфекционного генеза. Регуляция стула у пациентов с илеостомой.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Имодиум® Экспресс таблетки-лиофилизат не следует применять у детей в возрасте до 6 лет.

Имодиум® Экспресс противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к лоперамиду и/или любому из компонентов препарата, а также в первом триместре беременности.

Имодиум® Экспресс не рекомендуется принимать в период грудного вскармливания.

Имодиум® Экспресс таблетки-лиофилизат противопоказаны больным фенилкетонурией.

Имодиум® Экспресс 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.

Имодиум® Экспресс не следует применять в случаях, когда замедление перистальтики нежелательно из-за возможного риска развития серьезных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона. Имодиум® Экспресс необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутии живота или кишечной непроходимости.

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

Имодиум® Экспресс следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени вследствие замедленного пресистемного метаболизма.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Имодиум® Экспресс не рекомендуется применять во время беременности и в период грудного вскармливания. В случае диареи при беременности или кормлении грудью необходима консультация с лечащим врачом для назначения соответствующего лечения.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Таблетку кладут на язык, в течение нескольких секунд она растворяется, после чего ее проглатывают со слюной, не запивая водой.

Взрослые и дети старше 6 лет:

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

Хроническая диарея: начальная доза – 2 таблетки (4 мг) в сутки для взрослых и 1 таблетка (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 таблеток (2–12 мг) в сутки.

Максимальная суточная доза не должна превышать 6 таблеток (12 мг); максимальная суточная доза у детей рассчитывается, исходя из массы тела (3 таблетки на 20 кг массы тела ребенка), но не должна превышать 6 таблеток (12 мг).

При нормализации стула или при отсутствии стула более 12 ч препарат отменяют.

Симптоматическое лечение острых эпизодов диареи, связанных с синдромом раздраженного кишечника (СРК)

Пациенты в возрасте 18 лет и старше:

Сначала две таблетки (4 мг), затем по 1 таблетке (2 мг) после каждого жидкого стула или в соответствии с рекомендациями врача. Максимальная суточная доза не должна превышать 6 таблеток (12 мг).

Применение у детей

Не применять Имодиум® Экспресс 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 печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких больных Имодиум® Экспресс следует применять с осторожностью вследствие замедленного пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»).

УКАЗАНИЯ ПО ПРИМЕНЕНИЮ

Поскольку таблетки-лиофилизат довольно хрупкие, во избежание повреждения их не следует продавливать сквозь фольгу.

Для того чтобы достать таблетку из блистера необходимо выполнить следующие действия:

- возьмите фольгу за край и полностью снимите ее с ячейки, в которой находится таблетка;
- осторожно надавите снизу и извлеките таблетку из упаковки.

**ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ**

По данным клинических исследований

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у ≥ 1 % пациентов, принимавших Имодиум® Экспресс при острой диарее: головная боль, запор, метеоризм, тошнота, рвота.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у ≥ 1 % пациентов, принимавших Имодиум® Экспресс при хронической диарее: головокружение, метеоризм, запор, тошнота.

По данным постмаркетинговых исследований (спонтанных сообщений о нежелательных реакциях и клинических или эпидемиологических исследований)

Нижеперечисленные нежелательные реакции классифицировали следующим образом: *очень часто* (≥ 10 %), *часто* (≥ 1 %, но < 10 %), *нечасто* ($\geq 0,1$ %, но < 1 %), *редко* ($\geq 0,01$ %, но $< 0,1$ %) и *очень редко* ($< 0,01$ %, включая единичные сообщения).

Нарушения со стороны иммунной системы. Редко: реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции, включая анафилактический шок, и анафилактоидные реакции.

Нарушения со стороны нервной системы. Часто: головная боль, головокружение. Нечасто: сонливость. Редко: нарушение координации, угнетение сознания, гипертонус, потеря сознания, ступор.

Нарушения со стороны органа зрения. Редко: миоз.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта. Часто: запор, тошнота, метеоризм. Нечасто: боль в животе, дискомфорт в области живота, сухость во рту, боль в эпигастральной области, рвота, диспепсия. Редко: вздутие живота, кишечная непроходимость (в том числе, паралитическая кишечная непроходимость), мегаколон (в том числе, токсический мегаколон), глоссалгия. Частота неизвестна: острый панкреатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей. Нечасто: кожная сыпь. Редко: ангионевротический отек, кожный зуд, крапивница, буллезная сыпь,

включая синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и многоформную эритему.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей. Редко: задержка мочи.

Общие расстройства. Редко: утомляемость.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы

При передозировке (в том числе, при относительной передозировке вследствие нарушения функции печени) могут появиться задержка мочеиспускания, паралитическая кишечная непроходимость, запор, признаки угнетения центральной нервной системы (ЦНС) (угнетение дыхания, обструкция дыхательных путей, рвота с нарушением сознания, ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, гипертонус мышц). Дети и пациенты с нарушением функции печени могут быть более чувствительны к влиянию лоперамида на ЦНС, чем взрослые.

У лиц, преднамеренно принявших чрезмерную дозу (от 40 мг до 240 мг/сутки) лоперамида гидрохлорида, отмечалось удлинение интервала QT и комплекса QRS и/или серьезные желудочковые аритмии, включая тахикардию по типу «пируэт»; остановка сердца, обморок (*см. раздел «ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ»*). Также описывались случаи смертельного исхода при преднамеренной передозировке.

Злоупотребление, неправильное применение и/или передозировка высокими дозами лоперамида может привести к клиническому проявлению синдрома Бругада.

Терапия

В случае передозировки необходимо начать ЭКГ-мониторинг для выявления удлинения интервала QT.

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 как минимум 48 часов с целью своевременного обнаружения признаков возможного угнетения ЦНС.

В связи с тем, что тактика купирования передозировки постоянно изменяется, рекомендуется связаться с токсикологическим центром (при наличии) для получения наиболее актуальных рекомендаций по лечению передозировки.

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 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 приеме 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

Лечение диареи препаратом Имодиум® Экспресс носит только симптоматический характер. 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).

Имодиум® Экспресс, таблетки-лиофилизат содержат источник фенилаланина. Прием больным фенилкетонурией противопоказан.

Сульфиты могут вызывать аллергические реакции, чаще всего симптомы астмы у людей с сопутствующей астмой. Могут наблюдаться реакции, похожие на аллергический ринит, крапивницу и анафилаксию.

Поскольку персистирующая диарея может быть показателем потенциально более серьезных состояний, препарат не следует принимать в течение длительного периода времени, пока не будет выяснена основная причина диареи.

При острой диарее, если клиническое улучшение не наблюдается в течение 48 часов, прием препарата Имодиум® Экспресс следует прекратить и проконсультироваться с врачом.

Пациенты со СПИДом, принимающие Имодиум® Экспресс для лечения диареи, должны прекратить прием препарата при первых признаках вздутия живота, а также признаках кишечной непроходимости. 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.

Имодиум® Экспресс необходимо применять с осторожностью у пациентов с печеночной недостаточностью, так как это может привести к токсическому воздействию на ЦНС вследствие относительной передозировки.

Злоупотребление или неправильное применение лоперамида в качестве заменителя опиоидов описывали у лиц с опиоидной зависимостью (*см. раздел «ПЕРЕДОЗИРОВКА»*).

Если пациенты принимают Имодиум® Экспресс для контроля эпизодов диареи, связанных с ранее диагностированным синдромом раздраженного кишечника, и клиническое улучшение не наблюдается в течение 48 часов, прием лоперамида гидрохлорида следует прекратить и проконсультироваться с врачом. Пациентам также следует обратиться к врачу, если характер их симптомов меняется или если повторяющиеся эпизоды диареи продолжаются более 2 недель.

Сообщалось об удлинении интервала QT и развитии желудочковой аритмии, включая тахикардию по типу «пируэт», в связи с передозировкой лоперамида, в некоторых случаях со смертельным исходом. Передозировка может выявить существующий синдром Бругада. Имодиум® Экспресс не следует использовать в течение длительного периода времени без наблюдения врача, пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и/или рекомендуемую продолжительность лечения.

Если пациенты принимают этот препарат для симптоматического лечения эпизодов острой диареи, связанных с синдромом раздраженного кишечника (СРК), должны соблюдаться дополнительные меры предосторожности при использовании:

- Пациенты должны принимать препарат для лечения симптомов СРК, только если ранее данный диагноз был поставлен врачом.
- Пациентам в возрасте 40 лет и старше следует проконсультироваться с врачом перед использованием препарата, если симптомы СРК не проявлялись в течение некоторого времени или если текущая симптоматическая картина отличается от предыдущих симптомов СРК.
- Пациенты должны проконсультироваться с врачом перед использованием препарата, если у них: кишечное кровотечение, сильный запор, тошнота или рвота, потеря аппетита или снижение массы тела, трудности или боль при мочеиспускании, высокая температура тела; если пациенты недавно выезжали за границу.

Если симптомы ухудшаются, если появляются новые симптомы, если характер симптомов меняется или если повторяющиеся эпизоды диареи продолжаются более двух недель, необходимо незамедлительно обратиться к врачу.

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 препаратом Имодиум® Экспресс 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

Таблетки-лиофилизат 2 мг.

По 6 или 10 таблеток-лиофилизат в блистере из алюминия/алюминия.

По 1 блистеру (по 6 или 10 таблеток), 2 блистера (по 10 таблеток) или 3 блистера (по 6 таблеток) вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре от 15 до 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в оригинальной упаковке.

СРОК ГОДНОСТИ

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Без рецепта.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Производитель готовой лекарственной формы и фасовщик (первичная упаковка):

«Каталент ЮК Суиндон Зайдис Лимитед», Великобритания/Catalent UK Swindon Zydis Limited, United Kingdom

Фактический адрес производственной площадки: Франкланд Роуд, Благров, Суиндон, SN5 8RU, Великобритания/ Frankland Road, Blagrove, Swindon, SN5 8RU, United Kingdom

Упаковщик (вторичная упаковка) и выпускающий контроль качества:
«ДжНТЛ Консьюмер Хелс (Франция) С.А.С.», Франция/«JNTL Consumer Health (France) S.A.S.», France

Фактический адрес производственной площадки: Домен де Мегремон, Валь-де-Рей, 27100, Франция/Domaine de Maigremont, Val-De-Reuil, 27100, France

**ВЛАДЕЛЕЦ
УДОСТОВЕРЕНИЯ/ОРГАНИЗАЦИЯ,
ПРЕТЕНЗИИ ПОТРЕБИТЕЛЯ**

**РЕГИСТРАЦИОННОГО
ПРИНИМАЮЩАЯ**

ООО «Джонсон & Джонсон», Россия
121614, г. Москва, ул. Крылатская, д. 17, корп. 2
тел. (495) 726-55-55