

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

ЛОПЕДИУМ® 2 mg шумливи таблети
LOPERAMIDUM HYDROCHLORIDUM

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Една шумлива таблета содржи 2 mg лоперамид хидрохлорид
Помошни состојки: глюкоза, соединенија на натриум и калиум.
За комплетната листа на помошни состојки видете го делот 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Шумлива таблета

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1. Терапевтски индикации

Лопедиум е наменет за симптоматски третман на акутна дијареа кај возрасни и деца над 12 годишна возраст доколку не е достапна каузална терапија. Третман со лоперамид подолго од 2 дена може да се спроведе само по препорака на лекар и под медицински мониторинг.

4.2. Дозирање и начин на употреба

Возрасни:

На почетокот на третманот за акутна дијареа, 4 mg лоперамид хидрохлорид, што е еквивалентно на 2 шумливи таблети Лопедиум.

Потоа, 2 mg лоперамид хидрохлорид после секоја неформирана столица, што е еквивалентно на 1 шумлива таблета Лопедиум.

Дневната доза од 12 mg лоперамид хидрохлорид, што е еквивалентна на 6 шумливи таблети Лопедиум не смее да се надмине.

Деца постари од 12 години

На почетокот на третманот за акутна дијареа, а потоа и после секоја неформирана столица, 2 mg лоперамид хидрохлорид, што е еквивалентно на 1 шумлива таблета Лопедиум.

Дневната доза од 8 mg лоперамид хидрохлорид, што е еквивалента на 4 шумливи таблети Лопедиум не смее да се надмине.

Деца под 12 годишна возраст

Имајќи ја во предвид големата количина на активна супстанција, Лопедиум не е погоден за деца под 12 годишна возраст. За оваа возрасна популација се достапни други фармацевтски дозирани форми.

Начин на употреба

Шумливите таблети се раствораат во чаша вода и се пијат веднаш по растворањето.

1 шумлива таблета Лопедиум содржи 0,5 g глюкоза и следните електролити:

Cl⁻ 100 mg, еквивалентно на 2,8 mval

Ca²⁺ 118,14 mg, еквивалентно на 1,5 mval



K⁺ 58 mg, еквивалентно на 1,5 mval
Mg²⁺ 333 mg, еквивалентно на 6,9 mval
Na⁺ 269 mg, еквивалентно на 11,7 mval

Времетраење на употреба

Лопедиум шумливите таблети може да се употребуваат максимум 2 дена.

Доколку дијареата перзистира и после третман од 2 дена, понатамошната терапија со Лопедиум треба да се прекине и да се консултира доктор.

Забелешка: препорачаната доза и препорачаното времетраење на терапијата од 2 дена не смее да се надминува, бидејќи може да дојде до тешка опстипација.

Терапија со лоперамид подолго од 2 дена може да се спроведува само по препорака на лекар и под медицински надзор.

При дијареа може да дојде до голем губиток на течности и соли. Во таков случај мора да се обезбеди адекватна надокнада на течности и електролити како една од најзначајните терапевтски мерки за третман на дијареа. Ова посебно се однесува за децата.

4.3 Контраиндикации

- Преосетливост кон активната супстанција или кон било која друга составна компонента на лекот.
- Деца под 12 годишна возраст (деца под 2 годишна возраст не смеат да примаат лоперамид. Деца помеѓу 2 и 12 години можат да примаат лоперамид само по препорака на лекар).
- Сосостојби во кои успорувањето на интестиналната активност треба да се избегнува. Ова вклучува илеус, мегаколон и токсичен мегаколон. Лоперамид треба веднаш да се прекине доколку се јави опстипација, надуен stomак и илеус.
- Дијареа пропратена со треска и/или крвава столица (на пр. акутна дизинтерија).
- Акутен напад на улцеративен колитис.
- Бактериски ентероколитис предизвикан од инвазивни микроорганизми (на пр. салмонела, шигела и *Campylobacter*).
- Дијареа која се јавила во тек или по земање на антибиотици (псевдомембранозен-антибиотски колитис).
- Хронична дијареа (хронична дијареа може да се третира со лоперамид само по медицинска препорака).

4.4 Посебни мерки на претпазливост и посебни предупредувања

Кај пациенти со СИДА кои се на терапија со Лопедиум за третман на дијареа, терапијата треба веднаш да се прекине при првите знаци за надуен stomак. Има изолирани случаи на токсичен мегаколон кај пациенти со СИДА. Тие се подложни на инфективни колитиси предизвикани од вирусни и бактериски патогени, кои се третирани со лоперамид хидрохлорид.

Иако не се достапни фармакокинетски податоци за пациенти со оштетена функција на црниот дроб, Лопедиум треба да се користи со претпазливост поради намалениот метаболизам при првото преминување низ црниот дроб кај овие пациенти. Пациентите со дисфункција на црниот дроб треба внимателно да се следат за знаци за CNS токсичност.

Третманот на дијареа со Лопедиум е само симптоматски. Треба да се спроведе и специфичен третман секогаш кога може да се идентификува причинителот на болеста.

Дијареата може да предизвика тежок губиток на течности и соли. Поради тоа мора да се обезбеди адекватна надокнада на течности и електролити како една од најзначајните терапевтски мерки за третман на дијареа. Ова посебно се однесува за децата.



Handwritten signature

Лекот во својот состав содржи глукоза. Пациентите со ретка глукоза-галактозна малапсорбција не може да го употребуваат овој лек.

Една шумлива таблета содржи 11,7 mmol (269 mg) натриум. Ова треба да се има во предвид за пациентите што се на диета со контролиран внес на натриум (мала количина на натриум/мала количина на соли).

Една шумлива таблета содржи 1.5 mmol (58 mg) калиум. Ова треба да се има во предвид кај пациентите со намалена бубрежна функција или кај пациентите што се на диета со контролиран внес на калиум.

4.5 Интеракции со други лекови и други форми на интеракции

Претклиничките податоци покажуваат дека лоперамид е субстрат на П-гликопротеинот. Истовремената употреба на лоперамид и познати инхибитори на П-гликопротеинот, какви што се кинидин и ритонавир, како и итраконазол (кој во исто време го инхибира и CYP 3A4) резултира со зголемување на плазматското ниво на лоперамид за 2-4 пати. CYP 2C8 инхибиторот гемфиброзил исто така ги зголемува плазматските концентрации на лоперамид за два пати. Комбинацијата на итраконазол и гемфиброзил може да ја зголеми експозицијата дури до 13 пати.

Меѓутоа, овие зголемувања немаат значајни ефекти на централниот нервен систем; клиничкото значење на овие наоди не е разјаснето.

Медицинските производи кои ја намалуваат гастричната и интестиналната активност (на пр. аналгетици кои содржат морфин) можат да го зголемат ефектот на лоперамид.

4.6 Бременост и доење

Бременост

Податоците од лимитиран број (105) на експозиции на бремени жени не укажуваат на несакани дејства на лоперамид на бременоста и/или феталното/неонаталното здравје. До сега не се достапни други релевантни епидемиолошки податоци. Експерименталните анимални студии не укажуваат на директни или индиректни штетни ефекти врз бременоста, ембрионалниот/феталниот развој, родилниот или постнаталниот развој (видете дел 5.3). Лоперамид не треба да се користи во текот на бременоста.

Доење

Лоперамид се излучува во мајчиното млеко во мали количини. Поради тоа, лоперамид не треба да се користи во периодот на доењето.

4.7 Ефекти врз способноста за возење и ракување со машини

Доколку е присутна дијареа, можат да се јават замор, вртоглавица и поспаност. Поради тоа е потребна претпазливост при управување со моторно возило или ракување со машини.

4.8 Несакани дејства

Фреквенцијата на јавување на несаканите дејства е дефинирана на следниов начин:

Многу често ($\geq 1/10$), Често ($\geq 1/100$, $< 1/10$), Помалку често ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), Ретко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), Многу ретко ($< 1/10000$), Непозната (не може да се утврди од достапните податоци).

Податоци од клинички студии

Најчесто регистрирани несакани дејства во спроведените клинички студии биле

Чести

- опстипација,
- сува уста,
- флатуленција,
- стомачни спазми,
- колики,
- замаеност,
- мачнина,
- повраќање,
- главоболка,
- стомачна болка.



Handwritten signature in blue ink.

Искуства стекнати во пост-маркетиншкиот период

Пореметувања во имунолошкиот систем

Непозната фреквенција:

- Изолирани случаи на алергиски реакции и во некои случаи тешки хиперсензитивни реакции, вклучувајќи и анафилактичен шок/ анафилактоидни реакции.

Психијатриски пореметувања

Непозната фреквенција:

- Сомноленција

Пореметувања во нервниот систем систем

Непозната фреквенција:

- замор,
- вртоглавица.

Гастроинтестинални пореметувања

Непозната фреквенција:

- стомачна болка,
- илеус,
- надуен стомак,
- мачнина,
- опстипација,
- повраќање,
- мегаколон вклучувајќи и токсичен мегаколон,
- флатуленција,
- диспепсија.

Пореметувања на кожата и поткожните ткива

Непозната фреквенција:

- кожен раш,
- уртикарија,
- пруритус,
- ангиоедем,
- булозни кожни реакции вклучувајќи Stevens-Johnson синдром,
- мултиформен еритем,
- токсична епидермална некролиза.

Бубрежни и уринарни пореметувања

Непозната фреквенција:

- уринарна ретенција во изолирани случаи.

4.9 Предозирање

Симптоми на предозирање со лоперамид се опстипација, уринарна ретенција, илеус и невротоксичност (спазми, апатија, сомноленција, хореоатетоза, атаксија, респираторна депресија). Опиоидниот антагонист налоксон може да се проба да се користи како антидот. Бидејќи лоперамид е подолго ефективен од налоксонот (1-3 часа), може да биде индицирана повторна администрација на налоксон. Пациентот треба внимателно да се следи во тек на најмалку 48 часа со цел навреме да се регистрира евентуална можна појава на симптоми на предозирање.

За да се отстранат остатоците од активна супстанца од желудникот, во колку е потребно може да се спроведе гастрична лаважа.

5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1 Фармакодинамски својства

Фармакотерапевтска група

Антидијароик, инхибитор на мотилитетот. АТС код: AO7DA03



Handwritten signature

Лоперамид е синтетски пиперидински дериват кој содржи структури и на халоперидол и на дифеноксилат. Тој го зголемува интестиналниот тонус, превенира пропульзивна перисталтика и ја намалува фреквенцијата на евакуација во случај на дијареа. Лоперамид е агонист на периферните опиоидни рецептори.

5.2 Фармакокинетски својства

Лоперамид подлежи на изразит метаболизам при првото преминување низ црниот дроб, поради што неговата биолошка расположивост по перорална администрација е многу мала. Максималните плазматски концентрации се постигнуваат по после приближно 3-5 часа. Лоперамид генерално пенетрира низ крвно-мозочната бариера во многу мали количини кај возрасни. Една третина од лоперамид се екскретира во непроменета форма, а околу две третини се екскретираат во форма на метаболити преку фецесот. Помалку од 2% од активната супстанција се елиминира како непроменета преку бубрезите. Плазматскиот полуживот на елиминација изнесува 7-15 часа.

5.3 Претклинички податоци за безбедност

Претклинички ефекти се регистрирани само при доволна апсорпција на дози при употреба на кои ги надминуваат максималните терапевтски дози кај луѓе и имаат само мало клиничко значење.

Испитувањата на лоперамид или лоперамид оксид, пролек на лоперамид, не покажале никакви мутагени ефекти во *In vitro* и *In vivo* спроведените тестови.

Канцерогените студии со лоперамид оксид, не покажале никакви податоци за тумороген потенцијал.

Во експерименталните анимални студии не се регистрирани токсични релевантни ефекти на фертилитетот, ембриофеталниот развој и лактацијата при администрација на дози кои не се токсични за мајката. Нема податоци за тератогени ефекти.

6- ФАРМАЦЕВТСКИ ПОЕДИНОСТИ

6.1 Листа на ексципиенси

Калциум лактат монохидрат
Лимонска киселина (Ph. Eur.)
D-глюкоза
Цврста маст
Хипромелоза фталат
Натриум хидроген карбонат
Натриум карбонат
Натриум хлорид
Натриум цитрат
Натриум цикламат
Натриум хидроген карбонат
Пропилен гликол
Натриум сахаринат 2 H₂O
Силика диоксид хидрат
Магнезиум цитрат
Арома (портокал)

Препорака за дијабетичари:

Една шумлива таблета содржи 0,5 g глюкоза, еквивалентно на 0.04 BE (лебни единици)

6.2 Инкомпатибилност

Не се познати.

6.3 Рок на траење

3 години



6.4 Начин на чување

Контејнерот (тубата) да се чува цврсто затворена, заради заштита од влага.

6.5 Природа и содржина на пакувањето

Кртонска кутија со 1 контејнер (туба) која содржи 10 шумливи таблети.

7.НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕКОТ ВО ПРОМЕТ

Лек Скопје ДООЕЛ, Перо Наков б.б., Скопје, Р.Македонија

8. БРОЈ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

**9. ДАТУМ НА ПРВОТО ОДОБРЕНИЕ ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕКОТ ВО ПРОМЕТ И
ДАТУМ НА ПОСЛЕДНОТО ОБНОВЕНО ОДОБРЕНИЕ**

10. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Февруари 2010 година

Handwritten signature

