

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ЛОФЛАТІЛ®
(LOFLATIL®)

Склад:

діючі речовини: лопераміду гідрохлорид (loperamide hydrochloride), симетикон (simethicone);

1 таблетка містить лопераміду гідрохлориду 2 мг, симетикону 125 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, алюмінію-магнію силікат, лактози моногідрат, кальцію гідрофосфат, кремнію діоксид колоїдний безводний, повідон К-30, кислота стеаринова, натрію кроскармелоза, покриття Opadry II 85G52482 жовтий: спирт полівініловий, тальк, титану діоксид (Е 171), поліетиленгліколі, лецитин, заліза оксид жовтий (Е 172).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: капсулоподібні таблетки, вкриті оболонкою жовтого кольору, з розподільчою рискою з одного боку.

Фармакотерапевтична група.

Антиперистальтичні засоби. Лоперамід, комбінації. Код АТХА07D А53.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лофлатіл® є комбінованим препаратом, що поєднує два лікарські засоби: лопераміду гідрохлорид та симетикон.

Механізм дії лопераміду гідрохлориду.

Лопераміду гідрохлорид зв'язується з опіатними рецепторами кишкової стінки. Внаслідок цього пригнічується вивільнення ацетилхоліну та простагландинів, знижуючи у такий спосіб пропульсивну перистальтику та збільшуючи час проходження вмісту через травний тракт, а також здатність стінки кишечника до абсорбції рідини. Лопераміду гідрохлорид збільшує тонус анального сфінктера, знижуючи тим самим нетримання калових мас та позиви до дефекації.

Механізм дії симетикону.

Симетикон є нетоксичною інертною поверхнево-активною сполукою, що має піногасильні властивості, і тому полегшує симптоми, пов'язані з діареєю, у тому числі метеоризм, абдомінальний дискомфорт, здуття та спазми.

Фармакокінетика.

Для лопераміду гідрохлориду.

Абсорбція: більша частина лопераміду, прийнятого внутрішньо, абсорбується з кишечника, але в результаті інтенсивного метаболізму першого проходження системна біодоступність становить приблизно лише 0,3 %.

Розподіл: результати досліджень з розподілу лопераміду у щурів показують високу афінність відносно стінки кишечника з переважним зв'язуванням з рецепторами поздовжнього шару м'язової оболонки.

Зв'язування лопераміду з білками становить 95 %, головним чином з альбуміном. Доклінічні дані показали, що лоперамід є субстратом Р-глікопротеїну.

Метаболізм: лоперамід майже повністю екстрагується печінкою, де він переважно метаболізується, кон'югується та екскретується з жовчю. Окисне N-деметилування є основним метаболічним шляхом лопераміду, цей процес опосередкований головним чином ізоформами СYP3A4 та СYP2C8. Внаслідок цього дуже інтенсивного ефекту першого проходження через печінку концентрації незміненого лікарського засобу у плазмі крові залишаються дуже низькими.

Елімінація: період напіввиведення лопераміду у людей становить приблизно 11 годин з діапазоном 9-14 годин. Екскреція незміненого лопераміду та його метаболітів відбувається в основному з калом.

Популяція пацієнтів дитячого віку: фармакокінетичних досліджень популяції пацієнтів дитячого віку не проводили. Очікується, що фармакокінетична поведінка лопераміду та взаємодії лікарських засобів з лоперамідом будуть аналогічними тим, що спостерігаються у дорослих.

Для симетикону.

Симетикон діє винятково на поверхні пухирців газу і не всмоктується слизовою оболонкою травного тракту. Симетикон не всмоктується слизовою оболонкою травного тракту і після перорального прийому виводиться у незмінному вигляді. Симетикон не має центральної дії.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування гострої діареї у дорослих та дітей віком від 12 років, що супроводжується абдомінальним дискомфортом, включаючи здуття, спастичні болі і метеоризм.

Протипоказання.

Лофлатіл® протипоказаний:

- пацієнтам з відомою підвищеною чутливістю до лопераміду гідрохлориду, симетикону або до будь-якого з компонентів препарату;
- пацієнтам з гострою дизентерією, що характеризується наявністю крові у випорожненнях та підвищеною температурою тіла;
- пацієнтам з гострим виразковим колітом;
- пацієнтам з псевдомембранозним колітом, пов'язаним із застосуванням антибіотиків широкого спектра дії;
- пацієнтам з бактеріальним ентероколітом, спричиненим мікроорганізмами родин *Salmonella*, *Shigella* та *Campylobacter*;
- пацієнтам з кишковою непрохідністю або обструктивними захворюваннями травного тракту.

Лофлатіл® взагалі не слід застосовувати, якщо треба уникнути пригнічення перистальтики через можливий ризик виникнення значних ускладнень, включаючи кишкову непрохідність, мегаколон та токсичний мегаколон.

Необхідно негайно припинити прийом препарату, якщо розвивається запор, здуття живота або кишкова непрохідність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Взаємодії, пов'язані з лопераміду гідрохлоридом.

Повідомлялося про випадки взаємодії з лікарськими препаратами, що мають подібні фармакологічні властивості. Лікарські препарати, що мають пригнічувальну дію на центральну нервову систему, не застосовувати одночасно з прийомом Лофлатилу® дітям.

Доклінічні дані показали, що лоперамід є субстратом Р-глікопротеїну. Одночасне призначення лопераміду (в дозі 16 мг) разом з інгібіторами Р-глікопротеїну (хінідин, ритонавір) призводило до підвищення рівня лопераміду у плазмі крові в 2-3 рази. Клінічна значущість зазначеної фармакокінетичної взаємодії при застосуванні лопераміду в рекомендованих дозах невідома.

Супутнє застосування лопераміду (4 мг одноразово) та ітраконазолу, інгібітору CYP3A4 та Р-глікопротеїну призводило до три-чотириразового збільшення концентрацій лопераміду у плазмі крові. У цьому ж дослідженні інгібітор CYP2C8 гемфіброзил підвищував вміст лопераміду приблизно у 2 рази. Комбіноване застосування ітраконазолу та гемфіброзилу призводило до чотириразового збільшення максимального вмісту лопераміду у плазмі крові та тринадцятиразового збільшення загальної експозиції у плазмі крові. Це підвищення не було пов'язане з впливом на центральну нервову систему (ЦНС), що визначався за допомогою психомоторних тестів (тобто суб'єктивна сонливість та тест на заміну цифрових символів).

Супутнє застосування лопераміду (16 мг одноразово) та кетоконазолу, інгібітору CYP3A4 і Р-глікопротеїну, призводило до п'ятиразового підвищення концентрації лопераміду у плазмі крові. Це підвищення не було пов'язане зі збільшенням фармакодинамічних ефектів, що визначалося за допомогою пупілометрії.

Супутнє лікування десмопресином для перорального застосування призводило до триразового підвищення концентрації десмопресину у плазмі крові, вірогідно, внаслідок повільнішої моторики шлунково-кишкового тракту.

Очікується, що лікарські засоби з аналогічними фармакологічними властивостями можуть посилювати дію лопераміду, а лікарські засоби, що прискорюють проходження їжі у шлунково-кишковому тракті, можуть знижувати його дію.

Взаємодії, пов'язані з симетиконом.

Левотироксин може зв'язуватися з симетиконом. Абсорбція левотироксину у кишечнику може бути порушена при одночасному прийомі з симетиконом.

Особливості застосування.

Лікування діареї лопераміду гідрохлоридом та симетиконом носить симптоматичний характер. Якщо можна визначити етіологію захворювання (або зазначено, що потрібно це зробити), у разі можливості слід проводити специфічне лікування.

У хворих з діареєю, особливо у дітей, ослаблених пацієнтів літнього віку може виникнути дегідратація та дисбаланс електролітів. У таких випадках найважливішим заходом є застосування замісної терапії для поповнення рідини та електролітів.

Застосування препарату не замінює введення відповідної кількості рідини та відновлення електролітів.

Оскільки стійка діарея може свідчити про потенційно серйозні стани, лікарський засіб не слід застосовувати тривалий час, поки причина діареї не буде досліджена.

При гострій діареї, коли не спостерігається клінічне поліпшення протягом 48 годин, застосування препарату Лофлатіл® слід припинити і звернутися до лікаря.

Пацієнтам із синдромом набутого імунodefіциту, які приймають Лофлатіл® при діареї, необхідно негайно припинити лікування при появі перших ознак здуття живота. Існують окремі повідомлення про випадки кишкової непрохідності з підвищеним ризиком появи токсичного мегаколону у пацієнтів, хворих на СНІД, з інфекційними колітами як вірусного, так і бактеріального походження, при лікуванні лопераміду гідрохлоридом.

Хоча фармакокінетичні дані для пацієнтів з порушенням функції печінки відсутні, таким пацієнтам Лофлатіл® слід застосовувати з обережністю через уповільнення метаболізму першого проходження. Цей лікарський засіб необхідно з обережністю призначати хворим з порушенням функції печінки, оскільки він може призвести до відносного передозування, що може спричинити токсичне ураження ЦНС.

Лікарські препарати, що подовжують час проходження, можуть призвести до розвитку токсичного мегаколону у пацієнтів цієї групи.

Зважаючи на те, що лоперамід добре метаболізується та лоперамід або його метаболіти виводяться з фекаліями, зазвичай не потрібно коригувати дозу препарату Лофлатіл® у пацієнтів з порушенням функції нирок.

Оскільки препарат містить лактозу, його не слід застосовувати пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази Лаппа або синдромом мальабсорбції глюкози-галактози.

Якщо препарат приймати для контролю нападів діареї, зумовленої синдромом подразненого кишечника, що був попередньо діагностований лікарем, і клінічного покращення не спостерігається протягом 48 годин, потрібно припинити застосування лопераміду гідрохлориду і звернутися до лікаря. Також слід звернутися до лікаря, якщо характер симптомів змінився або повторювані напади діареї тривають довше 2-х тижнів.

Для лікування гострих нападів діареї, зумовленої синдромом подразненого кишечника, Лофлатіл® слід приймати лише якщо лікар попередньо діагностував це захворювання.

У зазначених нижче випадках препарат не слід застосовувати без попередньої консультації з лікарем, навіть якщо вам відомо, що у вас синдром подразненого кишечника (СПК):

- вік пацієнта від 40 років і з моменту останнього нападу СПК минув деякий час;
- вік пацієнта від 40 років і цього разу симптоми СПК відрізняються;
- нещодавня кровотеча з кишечника;

- тяжкий запор;
- нудота або блювання;
- втрата апетиту або зменшення маси тіла;
- утруднене або болісне сечовипускання;
- гарячка;
- нещодавня подорож за кордон.

У випадку виникнення нових симптомів, погіршення симптомів або якщо симптоми не покращилися протягом 2-х тижнів, слід звернутися до лікаря.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не рекомендується приймати цей лікарський засіб у період вагітності або годування груддю. У зв'язку з цим вагітним жінкам і жінкам, які годують дитину груддю, слід порекомендувати звернутися до свого лікаря для одержання відповідного лікування.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Під час лікування препаратом слід утримуватися від керування транспортними засобами чи роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі.

Початкова доза становить 2 таблетки одноразово, у подальшому приймати по 1 таблетці після кожного акту дефекації, але не більше 4 таблеток на добу. Тривалість застосування – не більше 2 діб.

Діти віком від 12 років.

Початкова доза – 1 таблетка одноразово, у подальшому приймати по 1 таблетці після кожного акту дефекації, але не більше 4 таблеток на добу. Тривалість застосування – не більше 2 діб.

Пацієнти літнього віку.

При лікуванні пацієнтів літнього віку корекція дози не потрібна.

Порушення функції нирок.

Не потрібна корекція дози для пацієнтів з порушенням функції нирок.

Порушення функції печінки.

Хоча фармакокінетичні дані про дію препарату у пацієнтів з порушенням функції печінки відсутні, таким пацієнтам потрібно призначати Лофлаліл® з обережністю через уповільнення у них метаболізму першого проходження (див. розділ «Особливості застосування»).

Діти.

Не застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Симптоми: при передозуванні (включаючи передозування, зумовлене порушенням функції печінки) можливе пригнічення центральної нервової системи (ступор, порушення координації рухів, сонливість, міоз, підвищення тону м'язів, пригнічення дихання) та паралітична кишкова непрохідність, затримка сечі. У дітей пригнічення центральної нервової системи може виникати частіше.

Лікування. У випадку передозування пацієнту слід негайно звернутися до лікаря. При виникненні симптомів передозування пацієнту слід ввести як антидот налоксон. Оскільки період напіввиведення лопераміду більший, ніж період напіввиведення налоксону (від 1 до 3 годин), може знадобитися додаткове введення налоксону. Необхідний цілодобовий моніторинг функції дихання. За станом пацієнта необхідно уважно спостерігати не менше 48 годин для виявлення можливого пригнічення ЦНС.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, анафілактичні реакції, включаючи анафілактичний шок, анафілактоїдні реакції.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висипання на шкірі, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, бульозні висипання (у т. ч. синдром Стівенса-Джонсона), мультиформна еритема, токсичний епідермальний некроліз.

З боку травного тракту: сухість у роті, нудота, запор, мегаколон (включаючи токсичний мегаколон протікання), кишкова непрохідність (включаючи паралітичну кишкову непрохідність), біль у животі, дискомфорт у животі, блювання, здуття живота, диспепсія, метеоризм.

З боку нервової системи: головний біль, дисгевзія (зміна смакового відчуття), сонливість, запаморочення, пригнічення свідомості, втрата свідомості, ступор, гіпертонус, порушення координації.

З боку сечовидільної системи: затримка сечі.

З боку органів зору: міоз.

Загальні розлади: астенія, підвищена втомлюваність.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у картонній упаковці.

По 10 таблеток у стрипі, по 1 стрипу у картонній упаковці.

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у картонній упаковці, по 10 упаковок у картонній коробці.

По 10 таблеток у стрипі, по 1 стрипу у картонній упаковці, по 10 упаковок у картонній коробці.

По 10 таблеток у блістері, по 10 блістерів у картонній упаковці.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у картонній упаковці.

По 10 таблеток у стрипі, по 1 стрипу у картонній упаковці.

За рецептом.

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у картонній упаковці, по 10 упаковок у картонній коробці.

По 10 таблеток у стрипі, по 1 стрипу у картонній упаковці, по 10 упаковок у картонній коробці.

По 10 таблеток у блістері, по 10 блістерів у картонній упаковці.

Виробник.

КУСУМ ХЕЛТХКЕР ПВТ ЛТД/

KUSUM HEALTHCARE PVT LTD.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

СП-289 (А), РІІКО Індастріал ара, Чопанкі, Бхіваді, Діст. Алвар (Раджастан), Індія/

SP-289 (A), RIICO Industrial area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), India.