

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау министрлігі медициналық және
фармацевтикалық қызметті
бақылау комитеті Төрағасының
2013 жылғы "07" 06
№ 519 бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

Дәрілік заттың медицинада қолданылуы жөніндегі нұсқаулық

Имодиум®

Саудалық атауы
Имодиум®

Халықаралық патенттелмеген атауы
Лоперамид

Дәрілік түрі

Ауыз қуысында ұнтақталынатын таблеткалар

Құрамы

Бір таблетканың құрамында
белсенді зат – 2 мг лоперамид гидрохлориді,
қосымша заттар: желатин, маннитол, аспартам, жалбыз хош
иістендіргіш, натрий гидрокарбонаты.

Сипаттамасы

Ақ немесе ақ дерлік түсті дөңгелек лиофилизацияланған
таблеткалар.

Фармакотерапиялық тобы
Диареяға қарсы дәрілер. Асқазан-ішек жолының
перистальтикасын төмендететін препараттар. Лоперамид.
АТХ коды A07DA03

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Лоперамид ішектен жақсы сіңеді, бірақ алғаш өтудің белсенді
метаболизмі салдарынан жүйелік биожетімділігі шамамен
0,3 құрайды. Соруға арналған таблеткалар Имодиум®
капсуласының сіну жылдамдығы мен дәрежесіне биобаламалы.
Лоперамидтің қан плазмасы ақуыздарымен (көбінесе
альбуминмен) байланысуы 95% құрайды. Клиникаға дейінгі
дәрілер лоперамид Р-гликопротеиннің субстраты болып
табылатындығын айғақтайды.
Лоперамид көбіне бауырда конъюгаттардың түзілуі арқылы
метаболизденеді және өтпен бірге бөлініп шығады. CYP3A4
және CYP2C8 арқылы тотықтыратын N-деметилдену лоперамид
метаболизмінің негізгі жолы болып табылады. Алғаш өтудің
осы әсерінің нәтижесінде өзгеріске ұшырамаған лоперамидтің
плазмалық концентрациялары болмашы ғана аз.
Адамда лоперамидтің жартылай шығарылу кезеңі орта
есеппен 11 сағатты құрайды, 9 сағаттан 14 сағатқа дейін
өзгеріп отырады. Өзгеріске ұшырамаған лоперамид және
оның метаболиттері көбіне нәжіспен бірге шығарылады.

Фармакодинамикасы

Лоперамид ішектің қабырғасында апииндық рецепторлармен
байланысып, ацетилхолиннің және простагландиндердің босап
шығуын басады, осылайша, ішектің перистальтикасын
төмендетіп, ішіндегі заттың өту уақытын арттырады. Артқы өтіс
сфинктерінің тонусын арттырып, осылайша нәжісті ұстай
алмаушылықты және үлкен дәретке отырғысы келуді азайтады.

Қолданылуы

- жедел және созылмалы диареяда симптоматикалық ем ретінде
- илеостомасы бар науқастарда нәжісті реттеуге

Қолдану тәсілі және дозалары

Ішке. Таблетканы тілге салады, бірнеше секундтан кейін ол
ериді, содан кейін оны сумен ішпей, сілекеймен бірге жұтады.
Ересектер және 12 жастан асқан балалар:
Жедел диарея: бастапқы доза –тәулігіне ересектер үшін
2 таблетка (4 мг) және балалар үшін 1 таблетка (2 мг);
әрі қарай нәжіс сұйық болған жағдайда әрбір дефекация
актісінен кейін 1 таблеткадан (2 мг) қабылдайды.
Созылмалы диарея: бастапқы доза – тәулігіне ересектер үшін
2 таблетка (4 мг) және балалар үшін 1 таблетка (2 мг); бұл
доза әрі қарай нәжіс жиілігі тәулігіне 1-2 ретті құрауы үшін,
әдеттедей жеке түзетіледі, бұған тәулігіне 1 таблеткадан
6 таблеткаға дейінгі демеуші доза кезінде жетеді.
Ең жоғары тәуліктік доза. Жедел және созылмалы диареяда
ересектерде – 8 таблетка (16 мг); балаларда ең төмен тәуліктік
доза дене салмағына қарай есептеледі (нәрестенің дене
салмағының 20 кг-на шаққанда 3 таблетка – 8 таблеткаға
дейін (16 мг)).

Егде жастағы емделушілер: Дозаны түзетудің қажеті жоқ.
Бүйрек қызметі бұзылған емделушілер: Дозаны түзетудің
қажеті жоқ.

Бауыр қызметінің жеткіліксіздігі бар емделушілер:

Бауыр қызметі бұзылған емделушілерде арнайы
фармакокинетикалық зерттеулер жүргізілген жоқ. Бауыр қызметі
бұзылған емделушілерге, бауыр арқылы «алғаш» өту кезінде
метаболизмінің төмендеуіне байланысты, абайлап қолданған жөн.

ҚОЛДАНЫЛУЫ ЖӨНІНДЕ НҰСҚАУЛАР

Соруға арналған таблеткалар нәзік болатындықтан, бүлдіріп
алмау үшін оларды фольга сыртында қыспаған жөн.

Блистерден таблетканы алу үшін мыналар қажет:

- фольганың жиегінен ұстап, оны түгел таблетка салынған
ұшығынан алыңыз;
- астыңғы жағынан ақырын басып, таблетканы қаптамасынан
шығарып алыңыз.



Жағымсыз әсерлері

Клиникалық зерттеу деректері бойынша

Жедел диареяда Имодиумд® қабылдаған емделушілердің
≥ 1%-да байқалған жағымсыз реакциялар: бас ауыру, іш қату,
газ түзілудің ұлғаюы, жүректің айнуы, құсу.
Жедел диареяда Имодиумд® қабылдаған емделушілердің
< 1%-да байқалған жағымсыз реакциялар: бас айналу,
ұйқышылдық, бас ауыру, ауыз ішінің құрғауы, іштің ауыруы,
іш қату, жүректің айнуы, құсу, іштің жайсыздығы және
желденуі, іштің жоғарғы бөліктерінің ауыруы, бөртпе.

Созылмалы диареяда Имодиумд® қабылдаған емделушілердің
≥ 1%-да байқалған жағымсыз реакциялар: бас айналу,
газ түзілудің ұлғаюы, іш қату, жүректің айнуы.

Созылмалы диареяда Имодиумд® қабылдаған емделушілердің
< 1%-да байқалған жағымсыз реакциялар: бас ауыру, іштің
ауыруы, ауыз ішінің құрғауы, іш тұсында жайсыздық, диспепсия.

**Жағымсыз құбылыстар жөнінде кездейсоқ мәлімдеме деректері
бойынша**

Өте сирек:

- жоғары сезімталдық реакциялары, анафилактикалық
реакциялар, анафилактикалық шокты және анафилактоидтық
реакцияларды қоса есептегенде.
- үйлесімділіктің бұзылуы, сананың тежелуі, гипертонус,
естен тану, ұйқышылдық, ступор
- миоз
- ішек бітелісі, соның ішінде ішектің салданған бітелісі,
мегаколон, уыттану ағымды вариантын қоса есептегенде,
глоссодиния
- ангионевротикалық ісіну, буллезді бөртпе, Стивенс-Джонсон
синдромы қоса есептегенде, мультиформалы эритема
және уытты эпидермальді некролиз,бөртпе, есекжем
- несептің іркілуі
- қажығыштық

Кейбір жағдайларда лоперамидті қабылдаумен және аталған
симптомдардың пайда болуы арасындағы себеп-салдарлық
байланысты анықтау айтарлықтай қиын. Сондай-ақ клиникалық
зерттеулерде жағымсыз реакциялардың пайда болуы кінәлі
клиникалық практикада пайда болу жиілігін көрсетпеуі мүмкін.

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- лоперамидке және/немесе препараттың басқа да
компоненттеріне асқын сезімталдық
- жедел дизентерия, ол қан аралас нәжіспен немесе
температураның көтерілуімен сипатталады, және басқа да

АІЖ жұқпалары (соның ішінде Salmonella, Shigella and
Campylobacter-ден болған)

- ішек бітелісі (соның ішінде қажет болғанда
перистальтикасының тежелуіне жол бермеу), дивертикулез,
ойық жаралы жедел колит немесе жалған жарғақшалы
энтероколит (антибиотиктерді қабылдаудан болған диарея)
- жүктіліктің алғашқы триместрі және лактация кезеңі

- 12 жасқа дейінгі балалар

Имодиумд® ішек бітелісі, мегаколон немесе уытты мегаколон
сияқты ауыр асқынулар қаупі туындауы мүмкін болатындықтан,
ішектің перистальтикасы баяулаған жағдайда қолданбаған
дұрыс. Іш қату, іштің желденуі немесе ішек бітелісі пайда
болған жағдайда Имодиумд® дереу тоқтату қажет.

Сақтықпен:

- бауыр қызметінің жеткіліксіздігінде

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Клиникаға дейінгі зерттеу деректері бойынша, лоперамид
Р-гликопротеиннің субстраты болып табылады.
Р-гликопротеин тежегіштері болып табылатын лоперамидті
(бір реттік 16 мг дозада) және хинидинді немесе ритонавирді,
бір мезгілде қолданғанда лоперамидтің плазмадағы
концентрациясы 2 – 3 есеге артады. Лоперамидті белгіленген
дозаларда қолданғанда Р-гликопротеин тежегіштерімен
фармакокинетикалық өзара әрекеттесуінің сипатталған
клиникалық маңызы белгісіз.

Лоперамидті (бір реттік 4 мг дозада) және итраконазолды,
CYP3A4 және Р-гликопротеин тежегіштерін бір мезгілде қолдану
лоперамидтің плазмалық концентрациясының 3 – 4 есе артуына
әкеледі. Осы зерттеулерде CYP2C8 тежегішін, гемфиброзилды
қолдану лоперамидтің плазмадағы концентрациясының
шамамен 2 есе артуына әкелді. Итраконазолды және
гемфиброзилды біріктіру қан плазмасында лоперамидтің ең
жоғары шектегі концентрациясын 4 есе арттырды және қан
плазмасында жалпы экспозицияны 13 есе ұлғайтты. Бұл
жоғарылау психомоторлы тесттері (ұйқышылдықты
субъективті бағалау және сандық символдарды алмастыру
тестісі) бойынша қызметіне баға берілген орталық жүйке
жүйесіне (ОЖЖ) әсерімен астасқан жоқ.
Лоперамидті (бір реттік 16 мг дозада) және кетоназолды,
CYP3A4 және Р-гликопротеин тежегіштерін бір мезгілде
қолдану қан плазмасында лоперамид концентрациясының
бес есе жоғарылауына әкелді. Бұл жоғарылау қарашықтың
шамасына байланысты баға берілген фармакодинамикалық
әсерінің артуымен байланысты болған жоқ.

Десмопрессинді ішке бір мезгілде қолданғанда қан
плазмасындағы десмопрессин концентрациясы 3 есе артты,
бұл асқазан-ішек жолының моторикасының баяулауына
байланысты болуы мүмкін.

Фармакологиялық қасиеттері бойынша ұқсас препараттар
лоперамидтің әсерін күшейтуі, ал асқазан-ішек жолы арқылы
өту жылдамдығын арттыратын препараттар лоперамидтің
әсерін азайтуы мүмкін деп күтіледі.

Айрықша нұсқаулар

Диареяны лоперамидпен емдеу симптоматикалық сипатта
ғана болатындықтан, егер мүмкіндік болса, диареяның
себептерін жоюға бағытталған емді де жүргізу қажет.
Диареясы ауыр емделушілерде, әсіресе балаларда,
сұйықтықтың және электролиттердің жоғалуы орын алуы
мүмкін. Мұндай жағдайларда орнын алмастыратын тиісті ем
жүргізу қажет (сұйықтық пен электролиттерді қабылдау).

48 сағат ішінде клиникалық жақсару байқалмаған жағдайда
Имодиум® қабылдауды тоқтату қажет. Емделушілер дәрігерге
қаралғаны жөн.

ЖИТС-ке шалдыққан, Имодиум® қабылдап жүрген емделушілер
іштің желденуінің алғашқы белгілері байқалғанда емдеуді
тоқтатуы тиіс. ЖИТС-ке шалдыққан және шығу тегі вирустық
және бактериялық жұқпалы колиті бар, осыған байланысты
болғандықтан лоперамидпен емделген емделушілерде уытты
мегаколон қаупінің жоғарылап, ішек бітелісінің болғаны
жөнінде жөделген мәлімдемелер түскен.

Бауыр қызметінің жеткіліксіздігі бар емделушілерде
фармакокинетикалық деректер жоқ болса да, мұндай
науқастарда Имодиумд® бауыр арқылы алғаш өткен кезде
метаболизмінің төмен болуына байланысты, абайлап қолданған
жөн. Бауыр қызметі бұзылған науқастар ОЖЖ уытты
зақымдану белгілерін дер кезінде анықтау үшін мұқият
бақылауда болуы тиіс. Бауыр қызметінің ауыр бұзылулары
бар емделушілерде Имодиумд® дәрігердің бақылауымен
ғана қолданған жөн.

Егер дәрілік зат жарамсыз немесе жарамдылық мерзімі өткен
болса – оны ағынды суға және көшеге тастамаңыз! Дәрілік
затты пәкетке салыңыз да, қалдық жинайтын контейнерге
тастаңыз. Бұл шаралар қоршаған ортаны қорғауға жәрдемдеседі!
Жүктілік және лактация кезеңі

Қазіргі таңда лоперамидті тератогендік немесе эмбриоуыттық
әсері жөнінде деректер жоқ. Жүктілік кезеңінде Имодиумд®
әсіресе алғашқы триместрде, егер ана үшін болжамды пайдасы
ұрық үшін қаупінен басым болса ғана, тағайындауға болады.
Лоперамидтің аздаған мөлшері әйелдерде емшек сүтіне өтуі
мүмкін, сондықтан Имодиумд® бала емізу кезеңінде
қабылдау ұсынылмайды.

**Дәрілік заттың көлікті немесе қауіпті механизмдерді
басқару қабілетіне өкілал ету ерекшеліктері**

Диареяны лоперамидпен емдеген кезде шаршағыштық,
бас айналу немесе ұйқышылдық пайда болуы мүмкін.
Осы симптомдар болған кезде автомобильді басқаруды
және механизмдермен жұмыс жасауды тоқтата тұрған жөн.

Артық дозалануы

Симптомдары: Артық дозаланғанда (соның ішінде бауыр
қызметінің бұзылуы салдарынан салыстырмалы артық
дозалануда) ОЖЖ тежелу белгілері (ступор, үйлесімділіктің
бұзылуы, ұйқышылдық, миоз, бұлшықет гипертонусы,
тыныстың тарылуы), несептің іркілуі және ішек бітелісі пайда
болуы мүмкін. Балалар ОЖЖ қатысты әсерлерге, ересектерге
қарағанда өте сезімтал болуы мүмкін.

Емдеу: Артық дозалану симптомдары пайда болғанда у қайтарғы
ретінде налоксонды пайдалануға болады. Лоперамидтің әсер
өту ұзақтығы налоксонға қарағанда көбірек (1 – 3 сағат)
болғандықтан, налоксонды қайталап қолдану қажет етілуі
мүмкін. Демек, ОЖЖ тежелу белгілерін дер кезінде анықтау
үшін, емделушінің жағдайын кем дегенде 48 сағат бойы
мұқият бақылау қажет.

Шығарылу түрі және қаптамасы

Поливинилхлоридті үлбірден және баспалы алюминий
фольгадан жасалған пішінді ұяшықты қаптамаға 6 немесе10
таблеткадан салынған.

Пішінді ұяшықты 1 қаптама қолданылуы жөнінде мемлекеттік
және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон пәшкеге
салынған.

Сақтау шарттары

Құрғақ жерде, 25°С-ден аспайтын температурада сақтау керек.
Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек.
Түпнұсқалық қаптамасында сақтау керек.

Сақтау мерзімі

3 жыл
Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

Дәріханадан босатылу шарттары

Рецептісіз

Өндіруші

Каталент ЮК Суиндон Зайдис Лимитед, Франкланд Роуд,
Благров, Суиндон, Уилтшир SN58RU, Уылындығы

Тіркеу куәлігі иесінің атауы және елі

«Джонсон & Джонсон» ЖШҚ, Ресей, 121614, Мәскеу қ-сы,
Крылатская к-сі, үй 17, 2 құрылыс,
тел. (495) 726-55-55

Қаптаушы ұйымның атауы және елі

«Янссен-Силаг С.п.А.», Италия

**Тұтынушылардан өнім (тауар) сапасы жөнінде
шағымдарды Қазақстан Республикасы аумағында
қабылдайтын ұйымның мекенжайы**

«TV-Pharma» ЖШС, Алматы қ-сы, ы/а Жетісу 3, үй 1, пәт.7
Тел/факс: (727) 376-8082

Электрон.поштасы: Valera.tv.pharma@gmail.com