

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

LOPERAMID WZF, 2 mg, tabletki

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki zawiera 2 mg loperamidu chlorowodoru (*Loperamidi hydrochloridum*).

**Substancja pomocnicza o znanym działaniu:** każda tabletki zawiera 100 mg laktozy jednowodnej.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

### 3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki

Tabletki barwy białej lub prawie białej, dwustronnie płaskie, ze ściętym obrzeżem

### 4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

#### 4.1 Wskazania do stosowania

Loperamid WZF jest wskazany w objawowym leczeniu ostrej i przewlekłej biegunki.

U pacjentów z wytworzoną przetoką jelita krętego Loperamid WZF może być stosowany w celu zmniejszenia liczby i objętości stolców oraz zwiększenia ich konsystencji.

Loperamid WZF jest wskazany do stosowania u dorosłych i dzieci w wieku 6 lat i powyżej.

#### 4.2 Dawkowanie i sposób podawania

##### Dawkowanie

##### Dorośli i dzieci w wieku 6 lat i powyżej

*Ostra biegunka:* początkowa dawka - 2 tabletki (4 mg) dla dorosłych i 1 tabletki (2 mg) dla dzieci; a następnie 1 tabletki (2 mg) po każdym kolejnym wolnym stolcu.

*Przewlekła biegunka:* początkowa dawka wynosi 2 tabletki (4 mg) na dobę dla dorosłych i 1 tabletki (2 mg) na dobę dla dzieci; tę początkową dawkę należy zmodyfikować aż do momentu uzyskania od 1 do 2 normalnych stolców na dobę, co zazwyczaj osiąga się poprzez stosowanie dawki podtrzymującej wynoszącej od 1 do 6 tabletek (od 2 do 12 mg) na dobę.

Dawka maksymalna w ostrej i przewlekłej biegunce wynosi 8 tabletek (16 mg) na dobę dla dorosłych; u dzieci dawka produktu musi być dostosowana do masy ciała (3 tabletki/20 kg mc./dobę).

##### Osoby w podeszłym wieku

U osób w podeszłym wieku nie jest konieczna modyfikacja dawkowania.

##### Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek

U pacjentów z zaburzeniami czynności nerek nie jest konieczna modyfikacja dawkowania.

#### Pacjenci z zaburzeniami czynności wątroby

Pomimo, że brak jest danych dotyczących farmakokinetyki leku u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby, w tej grupie pacjentów Loperamid WZF należy stosować ostrożnie z powodu zmniejszenia metabolizmu związanego z efektem pierwszego przejścia przez wątrobę (patrz punkt 4.4).

### **4.3 Przeciwwskazania**

- Nadwrażliwość na loperamidu chlorowoderek lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Loperamid WZF nie jest przeznaczony do leczenia dzieci w wieku poniżej 6 lat.
- Produktu Loperamid WZF nie należy stosować jako leczenia zasadniczego:
  - u pacjentów z ostrą czerwonką, która charakteryzuje się obecnością krwi w kale i wysoką gorączką;
  - u pacjentów z ostrym rzutem wrzodziejącego zapalenia jelita grubego;
  - u pacjentów z bakteryjnym zapaleniem jelita cienkiego i okrężnicy spowodowanym chorobotwórczymi bakteriami z rodzaju *Salmonella*, *Shigella* i *Campylobacter*;
  - u pacjentów z rzekomobłoniastym zapaleniem jelit, związanym z podawaniem antybiotyków o szerokim spektrum działania.

Ogólnie, produktu Loperamid WZF nie należy stosować w przypadkach, w których powinno się unikać zwolnienia perystaltyki jelit, z powodu możliwego ryzyka wystąpienia ciężkich powikłań, w tym niedrożności jelit, okrężnicy olbrzymiej (*megacolon*) i toksycznego rozszerzenia okrężnicy (*megacolon toxicum*). Leczenie produktem Loperamid WZF należy natychmiast przerwać w przypadku wystąpienia zaparcia, wzdęcia brzucha lub niedrożności jelit.

Leczenie biegunki produktem Loperamid WZF jest leczeniem wyłącznie objawowym. W każdym przypadku, w którym możliwe jest ustalenie etiologii, gdy jest to uzasadnione (lub wskazane) należy zastosować leczenie przyczynowe.

### **4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania**

U pacjentów z biegunką, zwłaszcza u dzieci, może dojść do utraty płynów i elektrolitów. W tych przypadkach postępowaniem z wyboru jest uzupełnianie odpowiednich ilości płynów i elektrolitów.

Ponieważ długotrwała biegunka może być objawem poważniejszych chorób, nie należy stosować loperamidu długotrwale, dopóki przyczyna biegunki nie zostanie ustalona. Jeżeli po podaniu leku w ostrej biegunce, w ciągu 48 godzin nie obserwuje się poprawy stanu klinicznego pacjenta, podawanie produktu Loperamid WZF należy przerwać i pacjent powinien skonsultować się z lekarzem.

Produkt należy stosować ostrożnie u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby, ponieważ może to powodować względne przedawkowanie, prowadzące do działania toksycznego na ośrodkowy układ nerwowy. Pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby należy uważnie obserwować, czy nie występują u nich objawy toksyczności ze strony ośrodkowego układu nerwowego.

U pacjentów z AIDS leczonych z powodu biegunki loperamidem, należy przerwać podawanie produktu przy pierwszych objawach wzdęcia brzucha. Istnieją pojedyncze doniesienia o przypadkach wystąpienia toksycznego rozszerzeniu okrężnicy podczas stosowania loperamidu u pacjentów z AIDS z zakaźnym zapaleniem okrężnicy wywołanym zarówno przez bakterie jak i wirusy.

Ponieważ większość leku jest metabolizowana w wątrobie, a metabolity lub lek w postaci niezmienionej są wydalane z kałem, nie ma konieczności modyfikacji dawkowania u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek.

Ze względu na zawartość laktozy, produkt nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy typu Lappa lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

#### **4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji**

Dane niekliniczne wskazują, że loperamid jest substratem glikoproteiny P. Jednoczesne podawanie loperamidu w pojedynczej dawce 16 mg z chinidyną lub rytonawirem, które są inhibitorami P-glikoproteiny, powodowało 2-3 krotne zwiększenie stężenia loperamidu w osoczu. Kliniczne znaczenie tych farmakokinetycznych interakcji inhibitorów P-glikoproteiny z loperamidem, podawanym w zalecanych dawkach (od 2 mg do 16 mg na dobę) nie jest znane.

#### **4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację**

##### Ciąża

Mimo, że nic nie wskazuje na to, aby loperamid wykazywał działanie teratogenne lub embriotoksyczne, należy dokładnie rozważyć przewidywane korzyści terapeutyczne względem potencjalnego ryzyka związanego z podaniem produktu Loperamid WZF kobietom w ciąży, szczególnie w pierwszym trymestrze.

##### Karmienie piersią

Małe ilości loperamidu są wydzielane z mlekiem kobiecym, dlatego nie zaleca się stosowania produktu w okresie karmienia piersią.

#### **4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn**

W zespole objawów w przebiegu biegunki leczonej produktem Loperamid WZF mogą pojawić się: zmęczenie, zawroty głowy lub senność. Dlatego też wskazane jest zachowanie ostrożności podczas prowadzenia pojazdów lub obsługiwanie maszyn.

#### **4.8 Działania niepożądane**

Wiele zdarzeń niepożądanych związanych ze stosowaniem loperamidu są częstymi objawami zespołów biegunkowych (dyskomfort i ból w jamie brzusznej, nudności, wymioty, suchość w jamie ustnej, zmęczenie, senność, zawroty głowy, zaparcie, wzdęcia z oddawaniem wiatrów). Często objawy te trudno jest odróżnić od działań niepożądanych stosowanego leku.

Poniżej przedstawiono działania niepożądane związane ze stosowaniem loperamidu: [bardzo rzadko (<1/10 000)].

##### Zaburzenia psychiczne

Bardzo rzadko: senność.

##### Zaburzenia układu nerwowego

Bardzo rzadko: zawroty głowy.

##### Zaburzenia żołądka i jelit

Bardzo rzadko: ból brzucha, niedrożność jelit, wzdęcia brzucha, nudności, zaparcia, wymioty, rozszerzenie okrężnicy (*megacolon*), w tym toksyczne rozszerzenie okrężnicy (*megacolon toxicum*), wzdęcia z oddawaniem wiatrów i niestrawność.

#### Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Bardzo rzadko: wysypka, pokrzywka i świąd.

Pojedyncze przypadki obrzęku naczynioruchowego, wysypki pęcherzowej, w tym zespołu Stevensa i Johnsona, rumienia wielopostaciowego i martwicy toksyczno-rozplywnej naskórka.

#### Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Bardzo rzadko: pojedyncze przypadki zatrzymania moczu.

#### Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Bardzo rzadko: pojedyncze przypadki reakcji alergicznych, niekiedy ciężkie reakcje nadwrażliwości, w tym wstrząs anafilaktyczny i reakcje przypominające anafilaksję.

### **4.9 Przedawkowanie**

#### Objawy

W przypadku przedawkowania (także przedawkowania względnego związanego z zaburzeniem czynności wątroby) mogą wystąpić następujące objawy: zahamowanie czynności ośrodkowego układu nerwowego (osłupienie, zaburzenia koordynacji ruchowej, senność, zwężenie źrenic, nadmierne napięcie mięśniowe i depresja oddechowa), zatrzymanie moczu i niedrożność jelit. Dzieci mogą być bardziej wrażliwe niż dorośli na toksyczne działanie leku na ośrodkowy układ nerwowy.

#### Leczenie

W przypadku wystąpienia objawów przedawkowania jako antidotum można podać nalokson. Ponieważ czas działania produktu Loperamid WZF jest dłuższy niż naloksonu (1 do 3 godzin) może być wskazane powtórne podanie naloksonu. Dlatego też pacjent powinien pozostawać pod ścisłą kontrolą lekarską przynajmniej przez 48 godzin w celu wykrycia ewentualnego zahamowania czynności ośrodkowego układu nerwowego.

## **5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE**

### **5.1 Właściwości farmakodynamiczne**

Grupa farmakoterapeutyczna: lek przeciwbiegunkowy.

Kod ATC: A07DA03

Loperamid wiąże się z receptorem opioidowym komórek ściany jelita, hamując propulsywną perystaltykę i wydłużając czas pasażu jelitowego. Loperamid zwiększa spoczynkowe napięcie zwieracza odbytu, jednocześnie zmniejszając natychmiastową potrzebę wypróżnienia (parcie na stolec).

Początek działania przeciwbiegunkowego obserwuje się w ciągu jednej godziny od podania pojedynczej dawki 4 mg. Kliniczne badania z zastosowaniem innych leków przeciwbiegunkowych potwierdziły, że działanie loperamidu rozpoczyna się wyjątkowo szybko.

### **5.2 Właściwości farmakokinetyczne**

Loperamid dobrze wchłania się z jelit, lecz jest niemal całkowicie wychwytywany i metabolizowany przez wątrobę, gdzie zachodzi jego sprzęganie i wydalanie z żółcią.

Okres półtrwania loperamidu u człowieka wynosi od 9 do 14 godzin (średnio 10,8 godziny).

Badania nad dystrybucją u szczurów wykazały duże powinowactwo loperamidu do komórek ścian jelita z preferencyjnym wiązaniem się z receptorami podłużnej warstwy mięśniowej.

Eliminacja zachodzi głównie na drodze oksydacyjnej N-demetylacji, która jest najważniejszym szlakiem metabolicznym loperamidu. Loperamid w postaci niezmienionej i jego metabolity wydalane są głównie z kałem.

### **5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie**

Badania dotyczące toksyczności loperamidu prowadzone przez okres do 12 miesięcy na psach i przez okres 18 miesięcy na szczurach nie wykazały jakiegokolwiek toksycznego wpływu z wyjątkiem niewielkiego zmniejszenia masy ciała i spożycia pokarmu podczas stosowania dawek dobowych odpowiednio: 30 razy i 240 razy większych niż maksymalna dawka stosowana u człowieka.

Wyniki badań przeprowadzonych w warunkach *in vivo* i *in vitro* wykazały, że loperamid nie jest genotoksyczny. Nie zaobserwowano działania rakotwórczego loperamidu. W badaniach wpływu na reprodukcję przeprowadzonych na szczurach, bardzo duże dawki loperamidu - 240 razy większe niż maksymalna dawka stosowana u człowieka, zaburzały płodność i zmniejszały przeżycie płodu w związku z działaniem toksycznym na organizm matki. Mniejsze dawki nie miały wpływu na zdrowie matki i płodu oraz nie zaburzały rozwoju około- i pourodzeniowego.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1 Wykaz substancji pomocniczych**

Laktoza jednowodna  
Skrobia kukurydziana  
Powidon K-25  
Kwas stearynowy

### **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3 Okres ważności**

3 lata

### **6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania**

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

### **6.5 Rodzaj i zawartość opakowania**

30 tabletek (w 2 blistrach Al/PVC po 15 tabletek) w tekturowym pudełku.  
15 tabletek (w 1 blisterze Al/PVC) w tekturowym pudełku.

### **6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania**

Brak szczególnych wymagań.

## **7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Warszawskie Zakłady Farmaceutyczne Polfa S.A.  
ul. Karolkowa 22/24; 01-207 Warszawa

## **8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Pozwolenie nr R/0382

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU /DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 13.05.1993 r.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 25.07.2012 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**