

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Стоперан 2 mg капсули, твърди
Stoperan 2 mg capsules, hard

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една твърда капсула съдържа:

Лоперамидов хидрохлорид (*Loperamide hydrochloride*) 2 mg

Помощни вещества с известно действие: лактоза монохидрат и др.
За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Капсули, твърди.

Твърда желатинова капсула със синьо капаче и сиво тяло, съдържаща бял прах.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Стоперан е показан за симптоматично лечение на остро и хронично разстройство (диария).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни и деца на възраст над 12 години:

Остра диария

Начална доза - 2 капсули (4 mg), а след това по 1 капсула (2 mg) след всяко диарийно изхождане.

Лекарственият продукт не трябва да се използва в дози по-високи от 8 капсули (16 mg) дневно.

Хронична диария

Начална доза - 1 капсула (2 mg) два пъти дневно; когато е необходимо, дозата може да бъде повишена до 4-6 капсули (8-12 mg) дневно.

Педиатрична популация

При деца дозата трябва да бъде съобразена с телесното тегло (3 капсули на 20 kg телесно тегло).



Деца на възраст 9 до 12 години:

Остра диария

1 капсула (2 mg) след всяко диарийно изхождане.

Лекарственият продукт не трябва да се използва в дози по-високи от 3 капсули (6 mg) дневно.

Хронична диария

1 капсула (2 mg) след всяко диарийно изхождане. Лекарственият продукт не трябва да се използва в дози по-високи от 3 капсули (6 mg) дневно.

Деца на възраст 6 до 8 години:

Остра диария

1 капсула (2 mg) след всяко диарийно изхождане. Лекарственият продукт не трябва да се използва в дози по-високи от 3 капсули (6 mg) дневно.

Хронична диария

1 капсула (2 mg) след всяко диарийно изхождане. Лекарственият продукт не трябва да се използва в дози по-високи от 2 капсули (4 mg) дневно.

Стоперан не трябва да се прилага при деца на възраст под 6 години.

Пациенти в старческа възраст

Не е необходимо коригиране на дозата при пациенти в старческа възраст.

Пациенти с бъбречно увреждане

Не е необходимо коригиране на дозата при пациенти с бъбречно увреждане.

Пациенти с чернодробно увреждане

Няма данни относно фармакокинетиката на Стоперан при пациенти с чернодробно увреждане. Независимо от това, лекарството трябва да се прилага с внимание, поради намаления метаболизъм при първо преминаване (вж. точка 4.4.).

Диарията може да отзвучи още след първия прием. В този случай трябва да се преустанови приемът на лекарствения продукт.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.6
- Състояния, при които не е желателно забавяне на перисталтиката поради потенциален риск от тежки усложнения, включително чревна обструкция, мегаколон или токсичен мегаколон (*megacolon toxicum*).
Лечението със Стоперан трябва незабавно да се преустанови в случай на констипация, флатуленция или чревна обструкция.
- Чревна обструкция



- Остър улцерозен колит, остър хеморагичен колит, псевдомембранозен колит, особено ако е свързан с прием на широкоспектърни антибиотици
- Остра дизентерия с наличие на кръв в изпражненията и повишена телесна температура
- Бактериален ентероколит, предизвикан от *Salmonella*, *Shigella* и *Compylobacter* патогенни микроорганизми

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Лечението на диария със Стоперан е само симптоматично.

В случаите, при които може да се определи причинителят и е оправдано (или показано) провеждането на етиологично лечение, трябва да се приложи такава терапия.

При пациенти с диария, особено при деца, може да възникнат дехидратация и недостиг на електролити. Поради това, по време на диария всеки дефицит на вода и минерални соли трябва да се коригира.

Приемът на този лекарствен продукт трябва незабавно да се преустанови в случай на констипация, флатуленция, начална чревна обструкция или отсъствие на клинично подобрене за 48 часа при пациенти с остра диария.

При пациенти със СПИН, лекувани със Стоперан във връзка с диария, приемът на продукта трябва да се преустанови при най-ранни симптоми на подуване на корема. Има данни за изолирани случаи на токсичен мегаколон при пациенти, болни от СПИН, с инфекциозен колит, причинен от вируси или бактериални патогени, при които е провеждано лечение с лоперамидов хидрохлорид.

Няма данни относно фармакокинетиката на Стоперан при пациенти с чернодробно увреждане. Независимо от това, продуктът трябва да се прилага внимателно при такива пациенти поради намаления метаболизъм при първо преминаване. Пациентите с чернодробно увреждане трябва да бъдат внимателно следени за поява на токсични ефекти върху централната нервна система.

Не се изисква коригиране на дозата при пациенти с бъбречно заболяване, тъй като голяма част от продукта се метаболизира и неговите метаболити или непроменена част от него се екскретират с фекалиите.

Поради съдържанието на лактоза монохидрат, пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Lapp лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

При пациенти с висока температура и кръв в изпражненията трябва да се установи причината за диарията, преди да се пристъпи към прием на лоперамид.

Има съобщения за сърдечносъдови събития, включващи удължаване на QT-интервала и QRS-комплекса, *Torsades de Pointes*, във връзка с предозиране. Някои от случаите са имали летален изход (вж. точка 4.9). Предозирането може да демаскира съществуващ синдром на Brugada. Пациентите не трябва да надвишават препоръчителната доза и/или препоръчителната продължителност на лечение.



4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Неклиничните данни показват, че лоперамидът е Р-гликопротеинов субстрат. Едновременното приложение на лоперамид (еднократна доза от 16 mg) с хинидин или ритонавир, които са Р-гликопротеинови инхибитори, води до 2-3кратно повишаване на плазмените нива на лоперамид. Клиничното значение на фармакокинетичните взаимодействия на Р-гликопротеин и лоперамид, когато лоперамид е приложен в предписаните дози (2 mg до максимум 16 mg дневно) е неизвестно.

4.6 Бременност, кърмене и фертилитет

Няма установени данни за тератогенни ефекти на лоперамид. Въпреки това, не се препоръчва прилагането на този лекарствен продукт през първите три месеца на бременността, докато през второто или третото тримесечие може да се използва само в случаите, когато, по лекарска преценка, ползата превишава потенциалния риск за майката или плода.

Лоперамид се екскретира в малки количества в кърмата. По тази причина, употребата на Стоперан в периода на кърмене не се препоръчва.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Симптомите, които може да възникнат по време на лечението на диарията със Стоперан включват: умора, виене на свят или сънливост. По тази причина този лекарствен продукт трябва да се прилага с повишено внимание при шофиране или работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Посочените по-долу нежелани лекарствени реакции, свързани с употребата на лоперамид са групирани по системо-органен клас и честота на възникване. Съгласно честотата, нежеланите лекарствени реакции са класифицирани както следва:

Много чести ($\geq 1/10$)
Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)
Нечести ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$)
Редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$)
Много редки ($< 1/10\,000$)
С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка)

Нарушения на нервната система

Много редки: главоболие и виене на свят, умора.

Психични нарушения

Много редки: сънливост.

Стомашно-чревни нарушения



Много редки: коремни болки; флатуленция; запек; гадене и повръщане; чревна обструкция; мегаколон, включително токсичен мегаколон (*megacolon toxicum*) (вж. точка 4.4.); флатуленция с освобождаване на газове и диспепсия; сухота в устата.
С неизвестна честота: остър панкреатит.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Много редки: обрив, уртикария и сърбеж.

Изолирани случаи на съдов оток; булозни ерупции, включително синдром на Стивънс-Джонсън; еритема мултиформе и токсична епидермална некролиза.

Нарушения на имунната система

Изолирани случаи на алергични реакции; понякога тежки реакции на свръхчувствителност, включително анафилактичен шок и анафилактоидни реакции.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Изолирани случаи на задържане на урина.

Много от нежеланите лекарствени реакции, свързани с употребата на лоперамид са чести симптоми на диарийен синдром (коремен дискомфорт и болка, гадене, повръщане, сухота в устата, умора, сънливост, виене на свят, констипация, флатуленция с освобождаване на газове). Често е трудно различаването на тези симптоми от нежеланите лекарствени реакции на приложеното лекарство.

Съобщаване на подозирани лекарствени реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да се продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез Изпълнителната агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев“ № 8, 1303 София, тел.: +359 2 8903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Симптоми

В случай на предозиране (също относително предозиране, свързано с чернодробно увреждане), може да появят констипация, чревна обструкция, задържане на урината и симптоми на потискане на централната нервна система (повишен мускулен тонус, ступор, обърканост, сънливост, смущения в нервно-мускулната координация, миоза, апнея, потискане на дишането).

При хора, които са предозирали лоперамид, са наблюдавани сърдечносъдови събития, като удължаване на QT-интервала и QRS-комплекса, *Torsades de Pointes*, други сериозни вентрикуларни аритмии, спиране на сърдечната дейност и синкоп (вж. точка 4.4).

Съобщени са и случаи с летален изход. Предозирането може да демаскира съществуващ синдром на Brugada.

Педиатрична популация

Деца са по-чувствителни към токсичните ефекти на лекарството върху централната нервна система.



Лечение при предозиране

В случай на симптоми на предозиране, като антидот се използва налоксон. Тъй като продължителността на действие на лоперамида е по-голяма от тази на налоксона (1 до 3 часа), пациентът трябва да е под наблюдение най-малко 48 часа. При поява на симптоми на потискане на централната нервна система, дозата на налоксон трябва да се повтори.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: лекарства, потискащи перисталтиката, АТС код: А 07 DA 03

Механизъм на действие

Лоперамидът се свързва с места на опиоиден рецептор в чревната стена, което води до потискане освобождаването на ацетилхолин от нервните окончания и интрамуралните ганглии, като по този начин се инхибира чревната перисталтика.

Фармакодинамични ефекти

Лоперамидът удължава времето на преминаване през чревния тракт, намалява честотата на изхожданията и количеството на фекалиите, повишава тонуса на аналния сфинктер. Поради повишената резорбцията на вода в дебелото черво се променя консистенцията на фекалиите. Намалява се отделянето на вода и електролити.

Клинична ефикасност

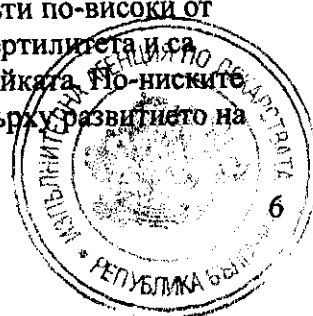
Терапевтичният ефект на лоперамид започва 1-3 часа след приема.

5.2 Фармакокинетични свойства

Полуживотът на лоперамид при хора е от 9 до 14 часа, средно 11 часа. При проведените проучвания при плъхове е установен висок афинитет на лоперамид към чревната стена, предимно вследствие на свързване с рецепторите на надлъжния мускулен слой. Лекарственият продукт се излъчва предимно чрез окислително N-деметиране, което представлява основния път на метаболизъм на лоперамид. Непромененият лоперамид и неговите метаболити се елиминират главно чрез фекалиите.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Проучвания на токсичността на лоперамид при кучета с продължителност до 12 месеца и при плъхове с продължителност до 18 месеца не показват токсични ефекти (с изключение на леко намаляване на телесното тегло и приема на храна) при прилагане на дневни дози съответно 30 и 240 пъти по-високи от максималните дози, използвани при хора. При проучвания *in vivo* и *in vitro* не е открита генотоксичност на лоперамид. Не са наблюдавани канцерогенни ефекти на лоперамид. При проучвания, отнасящи се до ефекта върху репродуктивността при плъхове много високи дози лоперамид (240 пъти по-високи от максималната доза, използвана при хора) са оказали влияние върху фертилитета и са намалили преживяемостта на плода поради токсични ефекти върху майката. По-ниските дози не оказват влияние върху плода и здравето на майката, както и върху развитието на плода преди и след раждането.



При предклиничните проучвания са наблюдавани ефекти само при прилагане на дози, значително превишаващи дозите при максимална експозиция с използване на клинични дози при хора, което показва малката значимост на тези наблюдения по отношение на клиничната безопасност на този продукт.

Неклиничната *in vitro* и *in vivo* оценка на лоперамид не показва значими електрофизиологични ефекти върху сърцето в терапевтично приложимия обхват на концентрации и при значителни, кратни на този обхват, стойности (до 47-кратни). Обаче при свръхвисоки концентрации, свързани с предозиране (вж. точка 4.4), лоперамид има електрофизиологично действие върху сърцето, състоящо се в инхибиране на калиевите (hERG) и натриевите потоци и аритмии.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат
Царевично нишесте
Талк
Магнезиев стеарат

Състав на желатиновата капсула:

Желатин
Еритрозин (Е 127)
Патент синьо (Е 131)
Титанов диоксид (Е 171)
Хинолиново жълто (Е 104).

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

8 капсули в един PVC/PVDC/Al блистер, поставен в картонена опаковка заедно с листовка с информация за пациента.



6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Неприложимо

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

US Pharmacia Sp. z o.o.
Ziębicka 40, 50-507 Wrocław
Полша

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20070038

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 12 април 2007 г.
Дата на последно подновяване: 08 януари 2013 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

04/2022

