

Loperamide STELLA

1. Tên thuốc

Loperamide STELLA

2. Các dấu hiệu lưu ý và khuyến cáo khi dùng thuốc

Đề xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

3. Thành phần công thức thuốc

Thành phần hoạt chất:

Loperamide hydrochloride 2 mg

Thành phần tá dược:

Lactose monohydrat, tinh bột ngô, talc, magnesi stearat.

4. Dạng bào chế

Viên nang cứng.

Viên nang cứng số 4, đầu nang màu xanh lục in logo "M" màu trắng, thân nang màu xám, chứa bột thuốc màu trắng.

5. Chỉ định

Loperamide được chỉ định trong việc kiểm soát và làm giảm triệu chứng tiêu chảy cấp không đặc trưng và tiêu chảy mạn do bệnh viêm ruột.

Loperamide cũng được chỉ định để làm giảm thể tích chất thải sau thủ thuật mở thông hồi tràng, trực tràng.

6. Cách dùng, liều dùng

Cách dùng

Loperamide STELLA được dùng bằng đường uống. Bệnh nhân nên được bù nước và chất điện giải thích hợp khi cần.

Liều dùng

Tiêu chảy cấp

Người lớn: Liều khuyến cáo khởi đầu là 4 mg tiếp theo 2 mg sau mỗi lần đi tiêu lỏng. Liều hàng ngày không được quá 16 mg. Thường thấy có tiến triển lâm sàng trong vòng 48 giờ.

Trẻ em:

+ Liều khuyến cáo ngày đầu tiên:

Tuổi (Cân nặng)

6 - 8 tuổi (20 - 30 kg)

8 - 12 tuổi (> 30 kg)

Liều lượng (24 giờ đầu)

2 mg x 2 lần/ngày

2 mg x 3 lần/ngày

+ Liều khuyến cáo hàng ngày tiếp theo:

1 mg/10 kg, chỉ dùng sau khi đi tiêu lỏng. Tổng liều hàng ngày không nên vượt quá liều khuyến cáo cho ngày đầu tiên.

Tiêu chảy mạn

Người lớn: Liều khuyến cáo khởi đầu là 4 mg tiếp theo 2 mg sau mỗi lần đi tiêu lỏng cho đến khi kiểm soát được tiêu chảy, sau đó nên giảm liều loperamide tùy nhu cầu của mỗi cá nhân. Khi đã xác định được liều tối ưu hàng ngày, có thể dùng liều này một lần hoặc chia nhiều lần.

Liều duy trì hàng ngày trung bình trong các nghiên cứu lâm sàng là 4 - 8 mg. Hiếm khi vượt quá liều 16 mg. Hầu như không kiểm soát được các triệu chứng ở liều cao hơn nếu không cải thiện về mặt lâm sàng sau khi điều trị với liều 16 mg/ngày trong ít nhất 10 ngày. Có thể tiếp tục dùng loperamide nếu tiêu chảy không được kiểm soát thỏa đáng bằng chế độ ăn uống hoặc điều trị đặc hiệu.

Trẻ em: Liều chưa được xác định.

7. Chống chỉ định

Quá mẫn với bất kỳ thành phần nào của thuốc

Bệnh nhân đau bụng mà không có tiêu chảy.

Trẻ em dưới 2 tuổi.

Trướng bụng.

Loperamide tránh dùng đầu tiên ở bệnh nhân ly cấp, viêm loét đại tràng chảy máu giai đoạn cấp, viêm đại tràng giả mạc, viêm đại tràng do vi khuẩn như *Salmonella*, *Shigella* và *Campylobacter*.

Viêm loét đại tràng cấp tính, viêm đại tràng giả mạc (có thể gây phình to đại tràng nhiễm độc) do sử dụng kháng sinh.

8. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc

Điều trị tiêu chảy bằng loperamide là điều trị triệu chứng. Cần tìm nguyên nhân (nếu có) và xử trí thích hợp.

Mất dịch và chất điện giải thường xảy ra ở những bệnh nhân bị tiêu chảy. Trong những trường hợp này, việc bù nước và chất điện giải rất quan trọng. Việc dùng loperamide không gây cản trở nhu cầu bù nước và chất điện giải.

Ở một số bệnh nhân viêm loét đại tràng cấp và viêm đại tràng giả mạc liên quan đến việc dùng các thuốc kháng sinh phổ rộng, các thuốc ức chế nhu động ruột hoặc trì hoãn thời gian lưu thông qua ruột đã được báo cáo là gây phình to đại tràng nhiễm độc.

Nên ngưng dùng loperamide ngay nếu xảy ra trướng bụng, táo bón hoặc tắc ruột.

Nên dùng loperamide đặc biệt thận trọng ở trẻ em do có sự thay đổi đáp ứng nhiều hơn ở nhóm tuổi này. Sự mất nước, đặc biệt ở trẻ nhỏ, có thể ảnh hưởng hơn nữa sự thay đổi đáp ứng đối với loperamide.

Trong tiêu chảy cấp, nếu không cải thiện về mặt lâm sàng trong 48 giờ, nên ngưng dùng loperamide.

Không nên dùng kéo dài. Chỉ dùng để điều trị triệu chứng trong các đợt cấp của tiêu chảy do hội chứng ruột kích thích.

Những bệnh nhân suy chức năng gan nên được theo dõi chặt chẽ các dấu hiệu độc thần kinh trung ương do chuyển hóa lần đầu qua gan cao rõ rệt.

Bệnh nhân nên tham khảo ý kiến của bác sĩ nếu tiêu chảy không cải thiện sau 2 ngày dùng thuốc hoặc nếu bệnh nhân thấy có máu trong phân hoặc sốt.

Loperamide STELLA có chứa lactose. Không nên dùng thuốc này cho bệnh nhân có các vấn đề về di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu hụt enzym lactase toàn phần hay kém hấp thu glucose-galactose.

9. Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú

Phụ nữ có thai

Chưa có đủ các nghiên cứu trên phụ nữ có thai. Không nên dùng cho phụ nữ có thai.

Phụ nữ cho con bú

Không nên dùng cho phụ nữ cho con bú.

10. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc

Mệt mỏi, chóng mặt hay đau đầu có thể xảy ra khi dùng thuốc này để điều trị tiêu chảy. Do đó, nên thận trọng khi dùng thuốc trong khi đang lái xe hoặc vận hành máy móc.

11. Tương tác, tương kỵ của thuốc

Tương tác của thuốc

Tăng độc tính: Những thuốc ức chế hệ thần kinh trung ương, các phenothiazin, các thuốc chống trầm cảm loại 3 vòng có thể gây tăng tác dụng không mong muốn của loperamide.

- Loperamide là một chất nền P-glycoprotein. Dùng đồng thời loperamide (liều duy nhất 16 mg) với quinidin hoặc ritonavir, hai chất ức chế P-glycoprotein, làm tăng nồng độ của loperamide trong huyết tương 2 - 3 lần. Sự liên quan lâm sàng của tương tác dược động này với các thuốc ức chế P-glycoprotein, khi loperamide được dùng ở liều khuyến cáo, không được biết.
- Dùng đồng thời loperamide (liều duy nhất 4 mg) và itraconazol, chất ức chế CYP3A4 và P-glycoprotein, dẫn đến tăng nồng độ của loperamide trong huyết tương 3 - 4 lần. Một nghiên cứu tương tự với gemfibrozil, chất ức chế CYP2C8, làm tăng nồng độ loperamide xấp xỉ 2 lần. Dùng đồng thời itraconazol và gemfibrozil dẫn đến tăng nồng độ đỉnh của loperamide trong huyết tương 4 lần và tăng tổng nồng độ loperamide trong huyết tương 13 lần.
- Dùng đồng thời loperamide (liều duy nhất 16 mg) và ketoconazol, chất ức chế CYP3A4 và P-glycoprotein, dẫn đến tăng nồng độ của loperamide trong huyết tương 5 lần.
- Dùng đồng thời với desmopressin đường uống dẫn đến tăng nồng độ desmopressin trong huyết tương 2 lần, do nhu động ruột chậm lại.
- Các thuốc có tính chất dược lý tương tự có thể làm tăng tác dụng của loperamide và các thuốc chuyển hóa nhanh qua đường tiêu hóa có thể làm giảm tác dụng của loperamide.

Tương kỵ của thuốc

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

12. Tác dụng không mong muốn của thuốc

Tác dụng không mong muốn được báo cáo khi dùng loperamide hydrochloride trong thử nghiệm lâm sàng (bệnh tiêu chảy cấp tính, mạn tính và sau khi lưu hành).

Thường gặp ($1/100 \leq ADR < 1/10$)

- **Thần kinh:** Đau đầu, chóng mặt.
- **Tiêu hóa:** Táo bón, buồn nôn, đầy hơi.

Ít gặp ($1/1000 \leq ADR < 1/100$)

- **Thần kinh:** Buồn ngủ.
- **Tiêu hóa:** Đau bụng, khó chịu ở bụng, khô miệng, đau vùng thượng vị, nôn, khó tiêu.
- **Da và mô dưới da:** Ban.

Hiếm gặp ($1/10000 \leq ADR < 1/1000$)

- **Miễn dịch:** Phản ứng quá mẫn, phản ứng phản vệ (bao gồm sốc phản vệ), phản ứng dạng phản vệ.
- **Thần kinh:** Mất ý thức, sững sờ, giảm ý thức, tăng trương lực cơ, mất phối hợp vận động.
- **Mắt:** Co đồng tử.
- **Tiêu hóa:** Tắc ruột (bao gồm liệt ruột), phình to đại tràng (bao gồm phình to đại tràng nhiễm độc), đầy bụng.
- **Da và mô dưới da:** Bóng nước (bao gồm hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc và hồng ban đa dạng), phù mạch, mày đay, ngứa.
- **Thận và tiết niệu:** Bí tiểu.
- **Toàn thân:** Mệt mỏi.

13. Quá liều và cách xử trí

- Trong các trường hợp quá liều, có thể xảy ra liệt ruột và ức chế thần kinh trung ương. Ảnh hưởng trên thần kinh trung ương ở trẻ em nặng hơn ở người lớn. Các nghiên cứu lâm sàng đã chứng minh việc dùng hỗn dịch than hoạt tính ngay sau khi uống loperamide hydrochloride có thể làm giảm 9 lần lượng thuốc được hấp thu vào hệ tuần hoàn. Nếu nôn xảy ra tự phát trong lúc uống thuốc, nên uống hỗn dịch chứa khoảng 100 gam than hoạt tính ngay khi còn có thể duy trì dịch.
- Nếu không bị nôn, nên tiến hành rửa dạ dày sau khi uống 100 gam hỗn dịch than hoạt tính qua ống thông dạ dày. Trong trường hợp quá liều, bệnh nhân nên được theo dõi các dấu hiệu ức chế thần kinh trung ương trong ít nhất 24 giờ. Nếu quan sát thấy có sự ức chế thần kinh trung ương, có thể dùng naloxon. Nếu đáp ứng tốt với naloxon, phải theo dõi cẩn thận các dấu hiệu sống trong ít nhất 24 giờ sau khi dùng liều naloxon cuối do có sự tái phát các triệu chứng quá liều thuốc.

Do tác động kéo dài của loperamide và khoảng thời gian tác động ngắn của naloxon (1 - 3 giờ), nên theo dõi chặt chẽ bệnh nhân và điều trị lặp lại với naloxon như chỉ định. Vì có một lượng thuốc khá nhỏ được bài tiết vào nước tiểu, việc tăng bài niệu gượng ép không mang lại hiệu quả đối với trường hợp quá liều loperamide.

- Trong các nghiên cứu lâm sàng, người lớn uống liều 20 mg x 3 lần trong vòng 24 giờ sẽ bị buồn nôn sau khi dùng liều thứ 2 và nôn sau khi dùng liều thứ 3. Trong các nghiên cứu nhằm mục đích khảo sát nguy cơ về tác dụng không mong muốn, chủ ý dùng liều duy nhất lên đến 60 mg loperamide hydrochloride cho những người khỏe mạnh kết quả không có tác dụng không mong muốn đáng kể nào.

14. Đặc tính dược lực học

Nhóm dược lý: Thuốc ức chế nhu động ruột.

Mã ATC: A07DA03.

Loperamide làm trì hoãn nhu động ruột thông qua tác động trực tiếp trên các đầu mút dây thần kinh và/hoặc các hạch trong vách của thành ruột. Thuốc tác động bằng cách cản trở cơ chế cholinergic và noncholinergic liên quan đến phản xạ nhu động, làm giảm hoạt động của các cơ vòng và cơ dọc ở thành ruột. Tuy nhiên, một số thông tin cho rằng thuốc có thể tác động, giống như diphenoxylat và morphin, bằng cách làm tăng sự co bóp của hệ thống cơ vòng ở ruột, vì vậy làm gia tăng sự phân đoạn và làm chậm nhu động đẩy tới ruột.

Loperamide kéo dài thời gian lưu thông các chất qua ruột và do đó làm giảm thể tích phân, làm tăng độ nhớt và tỷ trọng khối của phân, giảm bớt sự mất dịch và chất điện giải. Là thuốc chống tiêu chảy, loperamide được ghi nhận là thuốc đặc hiệu hơn, tác động dài hơn và có hiệu lực mạnh hơn 2 - 3 lần dựa trên cân nặng so với diphenoxylat. Chưa ghi nhận có sự dung nạp đối với tác động chống tiêu chảy của loperamide.

15. Đặc tính dược động học

Khoảng 40% liều dùng của loperamide được hấp thu qua đường tiêu hóa chịu sự chuyển hóa lần đầu ở gan và bài tiết ra phân theo đường mật dưới dạng liên hợp không có hoạt tính; sự bài tiết qua nước tiểu không đáng kể. Một lượng nhỏ thuốc nguyên vẹn vào hệ tuần hoàn. Thời gian bán thải được ghi nhận khoảng 10 giờ.

16. Quy cách đóng gói

Ví 10 viên. Hộp 5 ví.

17. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc

17.1. Điều kiện bảo quản

Bảo quản trong bao bì kín, nơi khô. Nhiệt độ không quá 30°C.

17.2. Hạn dùng

60 tháng kể từ ngày sản xuất.

17.3. Tiêu chuẩn chất lượng

TCCS.

18. Tên, địa chỉ của cơ sở sản xuất thuốc

