Торговое наименование: Лоперамид

Международное непатентованное наименование (МИН): лоперамид

Лекарственная форма: капсулы

Лоперамид, связываясь с опиоидными рецепторами в стенке кишечника, подавляет высвобождение ацетилхолина и простагландинов, замедляя таким образом перистальтику и увеличивая время прохождения содержимого по кишечнику. Повышает тонус анального сфинктера, уменьшая тем самым недержание каловых масс и позывы к дефекации.

В результате клинического исследования были получены данные о том, что противодиарейный эффект наступает в течение одного часа после приема однократной дозы (4 мг).

Показания к применению

* Симптоматическое лечение острой и хронической диареи различного генеза (в том числе аллергического, эмоционального, лекарственного, лучевого; при изменении режима питания и качественного состава пищи; при нарушении метаболизма и всасывания).
* В качестве вспомогательного лекарственного средства при диарее инфекционного генеза.
* Регуляция стула у пациентов с илеостомой.

Противопоказания

* Гиперчувствительность к лоперамиду и/или любому из вспомогательных веществ препарата. Детский возраст до 6 лет.
* Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, rлюкозо-rалактозная мальабсорбция. Беременность, период грудного вскармливания.
* В качестве основной терапии:
* у пациентов с острой дизентерией, которая характеризуется стулом с примесью крови и высокой температурой;
* у пациентов с язвенным колитом в стадии обострения;
* у пациентов с бактериальным энтероколитом, вызванным патогенными микроорганизмами, в том числе Salmonella, Shigella и Campylobacter;
* у пациентов с псевдомембранозным колитом, связанным с терапией антибиотиками широкого спектра действия.
* В случаях, когда замедление перистальтики нежелательно из-за возможного риска развития серьезных осложнений, в том числе кишечной непроходимости, мегаколона и токсического мегаколона. Лоперамид необходимо немедленно отменить при появлении запора, вздутия живота или кишечной непроходимости.

С осторожностью

Лоперамид следует применять с осторожностью у пациентов с нарушением функции печени вследствие замедленного пресистемного метаболизма.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Лоперамид не рекомендуется применять во время беременности и в период грудного вскармливания.

В случае диареи во время беременности или в период грудного вскармливания необходима консультация с лечащим врачом для назначения соответствующего лечения.

Способ применения и дозы

Внутрь, капсулы проглатывать, не разжевывая, запивая 100 мл воды.

Режим дозирования

Взрослым при острой и хронической диарее назначают в начальной дозе 2 капсулы (4 мг); затем по 1 капсуле (2 мг) после каждого акта дефекации (в случае жидкого стула); максимальная суточная доза- 6 капсул (12 мг).

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

При лечении пожилых пациентов корректировка дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

При лечении пациентов с нарушением функции почек корректировка дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

Хотя фармакокинетические данные у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют, у таких пациентов лоперамид следует применять с осторожностью вследствие замедленного

пресистемного метаболизма (см. раздел «Особые указания»)

Дети

Детям старше 6 лет при острой диарее назначают в начальной дозе 1 капсулу (2 мг), затем по 1 капсуле после каждого акта дефекации (в случае жидкого стула); максимальная суточная доза

- 6 капсул (12 мг). Не применять препарат у детей до 6 лет.

При нормализации стула или отсутствии стула более 12 часов лечение препаратом следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

По данным доклинических исследований лoперамид является субстратом P-гликопротеина.

При одновременном применении лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и хинидина или ритонавира, являющихся ингибиторами Р-гликопротеина, концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 2-3 раза. Клиническое значение описанного фармакокинетического взаимодействия с ингибиторами Р-гликопротеина при применении лоперамида в рекомендованных дозах неизвестно.

Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 4 мг) и итраконазола, ингибитора изофермента СУР3А4 и Р-гликопротеина, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови в 3-4 раза. В этом же исследовании применение ингибитора изофермента СУР2С8, гемфиброзила, привело к увеличению концентрации лоперамида в плазме крови приблизительно в 2 раза. При применении комбинации итраконазола и гемфиброзила максимальная концентрация лоперамида в плазме крови увеличилась в 4 раза, а общая концентрация - в 13 раз. Это повышение не было связано с влиянием на ЦНС, что оценивалось по психомоторным тестам (т. е. субъективной оценке сонливости и тесту замены цифровых символов).

Одновременное применение лоперамида (однократно в дозе 16 мг) и кетоконазола, ингибитора изофермента СУР3А4 и Р-гликопротеина, привело к пятикратному повышению концентрации лоперамида в плазме крови. Это повышение не было связано с увеличением фармакодинамического действия, оцененного по величине зрачка.

При одновременном пероральном приеме десмопрессина концентрация десмопрессина в плазме крови увеличилась в 3 раза, вероятно, из-за замедления моторики желудочно-кишечного тракта.

Ожидается, что препараты со схожими фармакологическими свойствами могут усиливать действие лоперамида, а препараты, увеличивающие скорость прохождения через желудочно­ кишечный тракт, могут уменьшать действие лоперамида.

Если Вы применяете вышеперечисленные или другие лекарственные препараты (в том числе безрецептурные) перед применением препарата Лоперамид проконсультируйтесь с врачом.

Особые указания

Лоперамид применяется только для симптоматического лечения диареи. В случае установления причины диареи, необходимо проводить соответствующую терапию.

У пациентов с диареей, особенно у детей, может иметь место потеря жидкости и электролитов. В таких случаях необходимо проводить соответствующую заместительную терапию (восполнение жидкости и электролитов).

При отсутствии эффекта после 2 суток лечения необходимо прекратить прием прeпapaтa,

уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи.

Пациенты с синдромом приобретенного иммунодефицита (СПИД), принимающие лоперамид для лечения диареи, должны прекратить прием препарата при первых признаках вздутия живота, а также признаках кишечной непроходимости. Поступали единичные сообщения о запоре с повышенным риском развития токсического мегаколона у пациентов с диагнозом СПИД и инфекционным колитом вирусной и бактериальной этиологии, которым проводилась терапия лоперамидом.

Лоперамид необходимо применять с осторожностью у пациентов с печеночной недостаточностью, так как это может привести к токсическому поражению ЦНС вследствие относительной передозировки.

Злоупотребление или неправильное применение лоперамида в качестве заменителя опиоидов описывали у лиц с опиоидной зависимостью (см. раздел «Передозировка»).

Сообщалось об удлинении интервала QT и развитии желудочковой аритмии, включая тахикардию по типу «пируэт», в связи с передозировкой лоперамида, в некоторых случаях со смертельным исходом.

Лоперамид не следует применять в течение длительного периода времени без наблюдения врача, пациенты не должны превышать рекомендуемую дозу и/или рекомендуемую продолжительность лечения.

Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности - не выбрасывайте его в сточные воды и на улицу. Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения лоперамидом следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как лоперамид может вызывать головокружение и другие НР, которые могут влиять на указанные способности.