

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Лоперамида гидрохлорид (4 — гидрокси-N, N — диметил-, -дифенил-1 — пиперидинбутанамид моногидрохлорид) — антидиарейное средство, угнетающее перистальтику. Связывается с опиоидными рецепторами кишечника, ингибирует высвобождение ацетилхолина и простагландина E2а, благодаря чему замедляет перистальтику кишечника и продвижение его содержимого, способствует абсорбции воды и электролитов. Оказывает антисекреторное действие. В отличие от других опиоидных агонистов лоперамид связывает кальмодулин — белок, регулирующий кишечный транспорт ионов. Препарат повышает тонус анального сфинктера. Лоперамид лишен морфиноподобного действия на ЦНС, свойственного другим опиоидным агонистам.

Максимальная концентрация в плазме крови определяется через 4 ч после приема внутрь; период полувыведения — 17–40 ч. Около 5% принятого перорально лоперамида выводится с мочой в виде метаболитов, 25% — с калом, 70% препарата снова всасывается в кишечнике, после чего около 30% препарата в неизменном виде вновь выделяется в кишечник, а около 40% метаболизируется в печени и в виде конъюгатов выводится с желчью. При нормальной функции печени уровень лоперамида в плазме крови и моче низкий, при печеночной недостаточности возможно повышение концентрации препарата в плазме крови.

ПОКАЗАНИЯ

острая и хроническая диарея различного генеза (аллергическая, психоэмоциональная, лекарственная, обусловленная рентгеновским облучением, изменением режима питания и качественного состава пищи, нарушениями метаболизма и абсорбции, а также несептической формой синдрома раздраженной толстой кишки, язвенным колитом); регуляция стула у больных с илеостомой.

ПРИМЕНЕНИЕ

при острой диарее у взрослых и детей в возрасте старше 5 лет начальная доза составляет 4 и 2 мг соответственно, затем по 1 таблетке (2 мг) после каждой дефекации в случае жидкого стула. При хронической диарее начальная доза для взрослых составляет 4 мг, для детей — 2 мг ежедневно, поддерживающая доза — 2 мг 1–2 раза в сутки. Максимальная суточная доза при острой и хронической диарее — не более 16 мг для взрослых и 6–8 мг на 20 кг массы тела для детей. После нормализации стула или при отсутствии дефекации в течение 12 ч прием препарата прекращают.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

возраст до 5 лет, запор, заболевания с задержкой перистальтики (паралитический илеус), острый язвенный колит, псевдомембранозный колит, I триместр беременности, период кормления грудью, повышенная чувствительность к препарату.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

реакции гиперчувствительности (кожная сыпь), чувство дискомфорта, боль в нижней части живота, метеоризм (возникают, как правило, при длительном применении препарата); редко — повышенная утомляемость, апатия, головная боль, сонливость или бессонница, головокружение, ощущение сухости во рту, тошнота и рвота, задержка дефекации, крайне редко — кишечная непроходимость.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

при передозировке назначают специфический антидот опиатов — налоксон (0,4 мг/мл в/в многократно с 2–3 — минутными интервалами); клиническое наблюдение в течение 48 ч.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

в сухом, защищенном от света месте.