

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ЛОПЕРАМИД
(LOPERAMIDE)

Общая характеристика:

международное и химическое названия: *loperamide;*

4-[4-(4-хлорфенил)-4-гидроксипиперидино]-N,N-диметил-2,2-дифенилбутирамида гидрохлорид;

основные физико-химические свойства: таблетки белого цвета, с плоской поверхностью, с фаской;

состав: 1 таблетка содержит лоперамида гидрохлорида 0,002 г (2 мг);

вспомогательные вещества: гранулак-70, крахмал картофельный, кальция стеарат.

Форма выпуска. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, угнетающие перистальтику (антиперистальтические).
Код АТС: А07D А03.

Фармакологические свойства. *Фармакодинамика.* Лоперамид обладает противодиарейной активностью. Взаимодействует с опиатными рецепторами продольных и кольцевых мышц стенки кишечника и ингибирует высвобождение ацетилхолина и простагландина. Замедляет перистальтику кишечника и увеличивает время прохождения кишечного содержимого. Препарат повышает тонус анального сфинктера, способствует удержанию каловых масс и урежению позывов к дефекации. Благодаря высокому сродству к стенке кишечника и высокой степени биотрансформации при "первом прохождении" через печень, лоперамид практически не попадает в системный кровоток. Не проникает через гематоэнцефалический барьер и не оказывает морфиноподобное действие на центральную нервную систему, свойственное другим опиатоподобным агонистам.

Фармакокинетика. Действие наступает быстро (через 1 час после приема таблеток внутрь 85 % лоперамида обнаруживается в желудочно-кишечном тракте, 5 % - в печени) и длится 4 - 6 часов. Максимальная концентрация лоперамида в плазме крови определяется через 4 часа. Связывание с белками плазмы крови - 97 %.

Выводится в основном в виде конъюгатов с желчью и фекалиями. Период полувыведения в среднем составляет 12 часов. В объеме 5 % лоперамида выводится с мочой в форме метаболитов, 25 % - с калом, 70 % его снова всасывается в кишечнике. После всасывания в объеме 30 % лоперамид вновь выводится в кишечник, в объеме 40 % метаболизируется в печени и в форме конъюгатов выделяется с желчью. При нормальной функции печени уровни лоперамида в плазме крови и в моче низкие, при нарушениях функции печени возможно увеличение доз препарата.

Показания к применению. Симптоматическое лечение острой и хронической диареи различного генеза; как вспомогательное средство при диарее инфекционной природы; при несептической форме синдрома раздражения толстой кишки; при язвенном колите; после наложения илеостомы (с целью уменьшения частоты и объема стула, а также для придания твердости его консистенции).

Способ применения и дозы. Лоперамид назначают внутрь.

При острой диарее назначают детям: от 2 до 5 лет - по 1 мг 3 раза в день, от 6 до 8 лет - по 2 мг 2 раза в день, от 9 до 12 лет - по 2 мг 3 раза в день. На 2-й день лечения, если понос длится, препарат назначают в дозе 2 мг после каждого акта дефекации, но не превышая максимальную суточную дозу, которая составляет 6 мг на 20 кг массы тела.

При острой диарее для взрослых начальная доза составляет 4 мг, затем по 2 мг после каждого опорожнения кишечника постепенно снижая дозу в зависимости от индивидуальных особенностей больного и характера заболевания. Установленную оптимальную дозу назначают однократно или в несколько приемов. Средняя суточная поддерживающая доза составляет 4 - 8 мг. Максимальная суточная доза - 16 мг. Терапевтический эффект, как правило, развивается в течение 48 часов.

При хронической диарее начальная доза для взрослых составляет 4 мг, затем устанавливают поддерживающую дозу, обеспечивающую частоту стула нормальной консистенции 1 - 2 раза в сутки (2 - 12 мг в сутки).

Побочное действие. Наблюдается, как правило, только при длительном приеме препарата. Возможны: головная боль, боль и дискомфорт в эпигастрии, сухость во рту, аллергические реакции в виде кожных проявлений, боль или чувство дискомфорта в нижней части живота; редко - сонливость или нарушение сна, головокружение, спазмы кишечника, тошнота, рвота, запор; в единичных случаях - кишечная непроходимость.

Противопоказания. Кишечная непроходимость; острый язвенный колит и псевдомембранозный колит, возникшие вследствие применения антибиотиков широкого спектра действия; беременность (первый триместр); лактация; детский возраст до 2 лет, повышенная чувствительность к препарату.

Передозировка. *Симптомы:* угнетение ЦНС (ступор, нарушение координации, сонливость, миоз, мышечная гипертония, угнетение дыхания), кишечная непроходимость.

Лечение: при передозировке препарата сразу вводят активированный уголь и промывают желудок. В качестве антидота применяют налоксон (внутривенно в дозе 0,4 мг/мл с 2 - 3 минутными интервалами, многократно). Усиленное наблюдение необходимо в течение 48 часов. При необходимости поддерживают функцию дыхания.

Особенности применения. Во время лечения диареи (особенно у детей) необходимо восполнять потерю жидкости и электролитов и соблюдать диету. Для длительного применения в педиатрической практике терапевтические дозы не установлены.

При отсутствии эффекта препарата в течение 2 суток, необходимо уточнить диагноз и исключить инфекционный генез диареи. Если известна причина заболевания, необходимо применение этиотропных средств (препарат не заменяет антибактериального лечения при инфекционных заболеваниях).

Применение препарата можно повторить, если соблюдение диеты или специфическое лечение не устраняет поноса.

После нормализации стула или при отсутствии его в течение 12 часов прием препарата прекращают.

С осторожностью препарат назначают больным с нарушениями функций печени, при обезвоживании, в пожилом возрасте (риск потери жидкости и электролитов).

В случае возникновения слабости, усталости, сонливости или головокружения не рекомендуется управлять автомобилем или работать с техникой.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами. Опиоидные анальгетики повышают риск развития тяжелого запора.

Условия и срок хранения. Хранить в сухом защищенном от света месте.

Срок хранения - 4 года.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска. По рецепту.

Упаковка. По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке, 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Производитель. ОАО "Киевмедпрепарат".

Адрес. 01032, Украина, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.