

## لوپرامید (Loperamide)

دسته دارویی: ضد اسهال

برند داروسازی امین: Amilopra®

شکل دارویی: قرص ۲ میلی گرمی / شربت یک میلی گرم در ۵ میلی لیتر

### نحوه عملکرد دارو

لوپرامید یک داروی سنتتیک برای درمان اسهال است. این دارو از طریق تحریک گیرنده های ((مو ۴)) در پایانه های اعصاب کولینرژیک دردستگاه گوارش، باعث کم شدن آزادی استیل کولین و در نتیجه باعث کاهش موتیلیته دستگاه گوارش و افزایش transit time روده ای می شود. این دارو بعنوان داروی ضد اسهال ۴۰ تا ۵۰ مرتبه قوی تر از مورفین بوده و خیلی کم به سیستم عصبی مرکزی نفوذ می کند (زیرا توسط ترانسپورتر P - گلیکوپروتئین که در سد خونی مغزی فراوان است بعنوان Efflux Pump عمل کرده و دارو را از سیستم عصبی مرکزی خارج و مانع تجمع آن در آنجا می شود). قسمتی از اثر ضد اسهال لوپرامید نیز مربوط به کم کردن ترشحات در دستگاه گوارش و تحت تأثیر قراردادن حرکات آب و الکترولیت از روده است.

### مشخصات فارماکوکینتیکی دارو

لوپرامید پس از مصرف از راه خوراکی خوب جذب نمی شود. ۴ ساعت پس از مصرف، غلظت پیک در خون ایجاد می شود. نیمه عمر حذف دارو ۷ تا ۱۴ ساعت است. بطوریکه اشاره شد لوپرامید به سیستم عصبی خوب نفوذ نمی کند. دارو در کبد متابولیزه می گردد. لوپرامید توسط سیستم سیتوکرم P450 (بویژه ایزوفرم های CYP<sub>2C8</sub> و CYP<sub>3A4</sub>) متابولیزه شده و N-دمتیله می شود. راه اصلی دفع دارو مدفوع و تا حدودی نیز ادرار است. دارو به مقدار کم از سد جفتی عبور کرده و نیز به مقدار کم به شیر مادر وارد می شود.

### موارد مصرف دارو

- ۱- برای کنترل اسهال حاد non-specific و بعنوان داروی کمکی در همه انواع اسهال مزمن از جمله اسهال مربوط به بیماری التهابی روده
- ۲- درد درمان اسهال مسافرتی به تنهایی یا همراه با داروهای ضد باکتری مثل کوتریموکسازول
- ۳- برای کم کردن ileostomy discharge

## مقدار و روش مصرف

دوز معمول لوپرامید ۴ میلی گرم در آغاز درمان است که ۲ میلی گرم پس از هر بار دفع مدفوع ادامه می یابد و اما نباید روزانه بیش از ۱۶ میلی گرم مصرف شود. حداکثر دوز توصیه شده برای بچه های ۲ تا ۵ ساله ، ۳ میلی گرم در روز ، برای بچه های ۶ تا ۸ ساله ، ۴ میلی گرم در روز و برای بچه های ۸ تا ۱۲ ساله ، ۶ میلی گرم در روز است. لوپرامید نباید در بچه های زیر ۲ سال مصرف شود.

## موارد منع مصرف دارو

- ۱- در بیمارانی که به لوپرامید یا سایر مواد موجود در فرمولاسیون دارو آلرژی دارند.
- ۲- در بیمارانی که شکم درد دارند( بدون اسهال).
- ۳- در بچه های زیر ۲ سال
- ۴- در بیماران مبتلا به یبوست
- ۵- در بیماران مبتلا به اسهال خونی و تب بالا
- ۶- در بیماران مبتلا به اسهال ناشی از اورگانیزم هایی که به مخاط روده نفوذ می کنند ( مثل اشیریشیا کلی ، سالمونلا، شیگلا ، کلستریدیوم دیفیسیل).

## عوارض جانبی

در برخی از بیماران مصرف لوپرامید ممکن است بعضی از عوارض زیر را ایجاد کند:  
احساس خستگی، سرگیجه، خواب آلودگی ، ایجاد مگاکولون سمی(در بیماران مبتلا به کولیت اولسراتیو)، درد شکم، یبوست، خشکی دهان، تهوع، بثورات پوستی، نفخ، سوء هاضمه.

## تداخل اثر

- ۱- مصرف توأم مهارکننده های P- گلیکوپروتئین (مثل کینیدین، ریتوناویر، کتوکونازول و وراپامیل)، اثر لوپرامید در سیستم عصبی مرکزی را افزایش می دهد.
- ۲- مصرف توأم لوپرامید با ساکوئیناویر(داروی ضد ایدز) غلظت خونی ساکوئیناویر را ۵۰٪ کاهش می دهد.

## مصرف دارو در دوران حاملگی و شیردهی

مطالعه کافی و خوب کنترل شده ای برای اثر لوپرامید در خانم های حامله وجود ندارد. لوپرامید در طول حاملگی باید موقعی مصرف شود که سودمندی آن برای مادر در برابر خطر آن برای جنین قابل توجیه باشد. مقدار کمی از دارو وارد شیر مادر می گردد و لذا در دوران شیردهی توصیه نمی شود.

## نکات آموزشی درباره این دارو

- ۱- تولرنس به اثر ضد اسهالی لوپرامید ایجاد نمی شود.
- ۲- اثر لوپرامید در درمان اسهال علامتی است. اگر علت اسهال مشخص شود در صورت لزوم باید درمان اختصاصی شروع شود.
- ۳- در بیماران مبتلابه اسهال، غالباً تخلیه آب و الکترولیت بدن ایجاد می شود که باید جایگزین گردد. مصرف لوپرامید نیاز به مایع و الکترولیت را منتفی نمی کند.
- ۴- اگر در عرض ۴۸ ساعت اسهال بند نیاید یا در مدفوع خون دیده شود و یا تب ایجاد شده و دیستانسیون شکم ایجاد شود، باید درمان قطع و شرایط به پزشک معالج گزارش گردد.
- ۵- در موقع درمان با لوپرامید، باید با احتیاط رانندگی یا اپراتوری کرد (دارو ایجاد سرگیجه و خواب آلودگی و خستگی می کند).
- ۶- در حین درمان باید مایعات کافی نوشیده شود.
- ۷- در بیماران مبتلا به نارسایی کبدی و کولیت اولسراتیو حاد، باید با احتیاط مصرف گردد.
- ۸- برای مداوای اوردوز (مصرف بیش از حد) یا تضعیف CNS، از نالوکسون (آنتاگونیست اوپیوئید) استفاده می شود.
- ۹- با توجه به اینکه کتوکونازول،  $CYP_{3A4}$  را مهار می کند، در صورت مصرف همزمان آن با لوپرامید، N-دمتیلاسیون لوپرامید شدیداً متوقف می شود.

## مصرف دوز بیش از حد و روش درمان آن

با اوردوز، احتباس ادراری، ایلئوس فلجی و تضعیف CNS (مخصوصاً در بچه ها) ایجاد می شود. استفاده از کربن فعال شده همراه آب، از جذب بیشتر لوپرامید به جریان عمومی خون جلوگیری می کند. نالوکسون می تواند بعنوان آنتی دوت (پادزهر) تزریق شود.

## شرایط نگهداری دارو

دارو دور از نور و در دمای کمتر از ۳۰ درجه سانتی گراد و دور از دسترس کودکان نگهداری شود.

## نوع بسته بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای ۱۰ عددی

شربت ۶۰ میلی لیتری