

Лактитол (Экспортал®) – эффективное и безопасное слабительное

И.В. ВОСКОБОЙНИКОВА,
В.К. КОЛХИР,
О.Н. МИНУШКИН
ЗАО «ФПК ФармВИЛАР»,
УНМЦ УД Президента РФ,
Москва

В настоящее время за рубежом широко применяются слабительные средства, действующим веществом которых является лактитол – Importal (Novartis, Франция), Novolax (Israel Pharmaceutical Products Maabarot Ltd., Израиль) и др. Как показывает опыт их многолетнего применения, эти препараты характеризуются мягким действием, высоким уровнем безопасности, отсутствием значительных негативных реакций.

Препараты лактитола относятся к группе осмотических слабительных. По механизму действия они отличаются от других осмотических слабительных (за исключением препаратов на основе лактулозы) тем, что осмотическими свойствами обладает не само действующее вещество этих препаратов – лактитол, а продукты его метаболизма в толстой кишке определенными

видами бактерий, расщепляющих сахара до уксусной, пропионовой и масляной кислот.

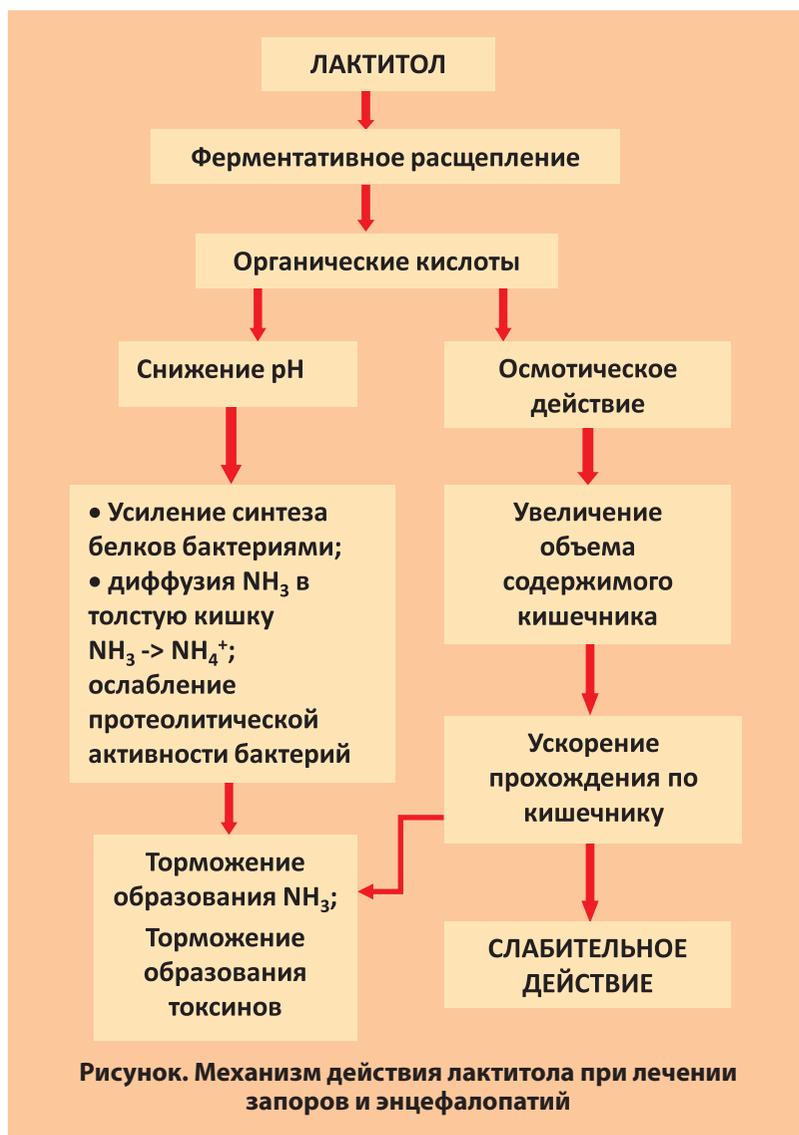
В тонком кишечнике лактитол не подвергается существенному ферментативному расщеплению и не всасывается. После попадания в толстый кишечник лактитол расщепляется местными бактериями с образованием короткоцепочечных жирных кислот, углекислого газа и воды. Эти вещества повышают осмотическое давление (поскольку они не всасываются) и делают содержимое кишечника более вязким (за счет удерживания воды). Поскольку лактитол представляет собой источник энергии для бактерий толстого кишечника, расщепляющих сахара, то при его применении масса бактерий увеличивается, увеличивается и масса содержимого кишечника, что оказывает положительное влияние на его опорожнение (см. рисунок) (1, 2, 3).

В России препарат Экспортал® – слабительное средство на основе лактитола – выпускается только одним производителем – фирмой ЗАО «ФПК ФармВИЛАР». Препарат зарегистрирован под названием Экспортал® и производится в двух лекарственных формах: в готовой дозированной лекарственной форме – саше (*sachets* – пакетики) для применения у взрослых и у детей разного возраста и в емкостях, содержащих 200 г или 500 г порошка, для стационаров.

Лактитол моногидрат представляет собой негигроскопичный, но хорошо растворимый в воде кристаллический порошок. Дозированная лекарственная форма лактитола в пакетиках имеет целый ряд достоинств. Она содержит только фармацевтическую субстанцию, не содержит вспомогательных или других дополнительных веществ, не требует измерений при дозировании препарата, полностью исключает контакт действующей субстанции с руками человека и с мерной посудой, прекрасно хранится в течение длительного времени, удобна в применении (отдельное саше можно взять с собой для приема на работе и т. п.). Для растворения препарата пациент сам может выбрать наиболее приемлемый для него напиток, что имеет немаловажное значение при необходимости принимать препарат длительно.

Данные проведенных клинических исследований свидетельствуют о том, что лактитол можно

Данные проведенных клинических исследований свидетельствуют о том, что лактитол (Экспортал®) можно характеризовать как мягкое и безопасное слабительное средство. Он эффективен при хронических запорах различной этиологии, функциональных запорах, а также как средство, ускоряющее восстановление функции дефекации и облегчающее дефекацию после операций на анальном сфинктере. При продолжительном применении и многократном повторном лечении лактитол не вызывает привыкания, поэтому не требуется коррекция его дозы в сторону увеличения. При наступлении стабильного слабительного эффекта после нескольких дней применения лактитола возможно снижение его дозы.



характеризовать как мягкое и безопасное слабительное средство. Он эффективен при хронических запорах различной этиологии, функциональных запорах, а также как средство, ускоряющее восстановление функции дефекации и облегчающее дефекацию после операций на анальном сфинктере. При продолжительном применении и многократном повторном лечении лактитол не вызывает привыкания, поэтому не требуется коррекция его дозы в сторону увеличения. При наступлении стабильного слабительного эффекта после нескольких дней применения лактитола возможно сниже-

ние его дозы.

Негативным эффектом лактитола при передозировке (35 г в сутки и более) является диарея, легко устранимая снижением его дозы, без применения каких-либо специальных противодействующих средств. При изучении эффективности лактитола у некоторых больных с хроническими запорами, в начале лечения он может вызывать небольшое «бурление» в животе, метеоризм. Эти явления, как правило, проходят при продолжении лечения. Как свидетельствуют результаты сравнительного клинического изучения слабительного действия лактито-

ла и лактулозы, эффект лактитола более стабилен: в зависимости от контингента больных он либо не уступал лактулозе, либо был более эффективен. По восприятию пациентами, лактитол превосходит лактулозу (4-11).

Было проведено сравнительное изучение влияния лактитола порошка и лактулозы порошка в суточной дозе 10 г, а также лактулозы сиропа (10 мл в сутки) и плацебо на транспортную функцию кишечника у госпитализированных больных. Установлено, что все исследовавшиеся слабительные средства примерно одинаково ускоряют продвижение капсулы в кишечнике, в наибольшей степени повышалась скорость ее продвижения в проксимальном отделе толстого кишечника (11).

При исследовании слабительного действия лактитола у беременных женщин было показано, что у 80% женщин дозы препарата 20 г в сутки достаточно для обеспечения стула один раз в день. У всех женщин беременность завершилась нормально (7).

Установлено, что лактитол не влияет на выведение кальция с мочой и метаболизм костной ткани по показателям концентрации паратгормона, остеокальцина и щелочной фосфатазы. В использованной дозе он не оказывал также влияния на концентрацию неорганического фосфата и кальция в плазме крови (13).

Лактитол имеет очень низкую калорийность (2 ккал/г), не влияет на уровень глюкозы в крови и, в отличие от препаратов на основе лактулозы, может без ограничений применяться у больных диабетом. В инструкциях по применению всех выпускающихся в настоящее время препаратов лактитола (Экспортал® и его зарубежные аналоги) нет противопоказаний или ограничений к их применению при диабете.

Установлено, что лактитол обладает также пребиотическими свойствами: избирательно стимулирует рост сахарорасщепляющих бактерий, благоприятно влияющих на здоровье человека

В России препарат Экспортал® – слабительное средство на основе лактитола – выпускается только одним производителем – фирмой ЗАО «ФПК ФармВИЛАР». Препарат зарегистрирован под названием Экспортал® и производится в двух лекарственных формах: в готовой дозированной лекарственной форме – саше (sachets – пакетики) для применения у взрослых и у детей разного возраста и в емкостях, содержащих 200 г или 500 г порошка, для стационаров.

и животных, – *Lactobacillus* spp, *Lactobacillus bifidus*, *Lactobacillus acidophilus*, *Bifidobacteria*, угнетает рост протеолитических бактерий родов *Enterobacteria* и *Enterococci*, подавляет адгезию кишечной палочки (*E. coli*) к эпителиальным клеткам. В дозе 20 г в день лактитол достоверно повышал количество лакто- и бифидобактерий и существенно снижал содержание ароматических веществ и потенциально канцерогенных энзимов в толстом кишечнике (14-16).

При сравнительном изучении влияния лактитола и лактулозы на пробиотические (полезные для человека и животных) бактерии и условно патогенные и патогенные бактерии было установлено, что

действие лактитола более избирательно. В частности, он, в отличие от лактулозы, не расщепляется кишечной палочкой (*E. coli*) и расщепляется значительно меньшим количеством штаммов стафилококка (*St. aureus*) и клостридий (*Cl. perfringens*) (17).

С избирательным влиянием на микрофлору кишечника связан и другой эффект лактитола – антиаммониемическое действие. В связи с этим лактитол применяется как лекарственный препарат для лечения печеночной энцефалопатии, формируемой через нарушение детоксикационной функции печени и прямым сбросом токсических агентов при развитии portalной гипертензии.

Лактитол действует по нескольким механизмам. В частности, он является источником энергии для бактерий толстого кишечника, расщепляющих сахара. Благодаря этому количество таких бактерий увеличивается, и они угнетают рост бактерий, расщепляющих белки, деятельность которых приводит к образованию аммиака и эндотоксинов. При расщеплении лактитола образуются короткоцепочечные жирные кислоты, которые снижают pH в толстом кишечнике. В этих условиях аммиак превращается в ион аммония NH_4^+ , который хуже всасывается, и благодаря этому симптомы ослабляются (см. рисунок) (18-21). Для лечения печеночной энцефалопатии лактитол назначают в 1,5-3 раза более высоких суточных дозах, чем для лечения запоров (22-27).

Таким образом, препараты на основе лактитола (в России – препарат Экспортал®) можно и нужно рекомендовать врачам для широкого применения в лечебной практике у детей и взрослых в качестве эффективного и безопасного лекарственного слабительного средства. 

Литература

- Salminen S., Deighton M.A., Lactic Acid Bacteria: Microbiology and Functional Aspects, S. Salminen, A. von Wright (ed.), New York. 1998. P.211-231.
- Salminen S., Robertroid M. et al. Lactic Acid Bacteria: Microbiology and Functional Aspects, S. Salminen, A. von Wright (ed.), New York. 1998. P.343-358.
- Ballongue J., Schumann C., Quignon P., Scand. // J. Gastroent. 1997; 32: 41-45.
- Vanderdonck J. et al. // J. Clin. and Exper. Gerontology. 1990; 12(3), 171-189.
- Vanderdonck J., Ravelli G.P., Acta Therapeutica. 1993; 19, 295-307.
- Doffoel M. et al. Clinical investigation of the long-term tolerability (6 months) of lactitol for the treatment of functional constipation in elderly patients // Medicine et Chirurgie Digestives. 1990, 19(4): 260-261.
- Walder M. et al. Dose-response curve and preliminary clinical study of a laxative, lactitol // Schweiz.Med. Wschr. 1988; 118: 1925-1927.
- Ravelli G.P. Acta Therapeutica. 1995; 21, 243-245.
- Heitland W., Mauerberger H., Schweiz. Rundschau Med. 1988; 77 (18), 493-495.
- Sacchetta A. et al. Acceptability, efficacy and tolerability of lactitol Syrup in chronic or hospitalization – related constipation // European Bulletin of Drug Research. 2000; 8, 12: 1-6.
- Pontes F.A., Silva A.T., Cruz A.Z. Colonic transit times and the effects of lactulose or lactitol in hospitalized patients // European Journal of Gastroenterology and Hepatology. 1995; 7: 441-445.
- Cope R. et al. Study comparing lactitol with paraffin oil immediately after anal surgery in one hundred and ten patients // Ann. Chir. 1996; 50, 7: 570-576.
- Egger B. et al. Effect of one month of lactitol treatment on calcium metabolism in man // Eur. J. Clin. Pharmacol. 1989; 37: 205-207.
- Kneifel W., Rajal A. and Kulbe D. In vitro growth behavior of probiotic bacteria in culture media with carbohydrates of probiotic importance // Microbial Ecology in Health and Disease. 2000; 12: 27-34.
- Watanabe M., Takayuki O., Hirata Y. et al. Effect of lactitol on intestinal bacteria // Bifidus. 1995; 9: 19-26.
- Mesters P.H.J. and Brokx S.-LACTITOL: a functional prebiotic (обзор) / Материалы Фирмы PURAC biochem bv, Gorinchem, The Netherlands.
- Kitler M.E. Lactitol and lactulose. An in vitro and in vivo comparison of their effects on the human intestinal flora // Drug Invest. 1992; 4 (1): 73-82.
- Lebek G. and Luginbühl M. Effect of lactulose and lactitol on human intestinal flora / In: Hepatic encephalopathy. Management with lactulose and related carbohydrates. Editors: H.O. Conn and J. Bircher, Medi-Press, Michigan. 1989, P.245-266.
- Scevola D., Bottari G., Franchini A. et al., Mal G. Inf. Parasit. 1993; 45 (7-8): 906-918.
- Scevola D., Bottari G., Oberto L. et al. Intestinal bacterial toxins and alcohol liver damage: effects of lactitol, a synthetic disaccharide // La Clinica Dietologica. 1993; 20, 5: 297-314.
- Tarao K. et al. On changes of the faecal bacterial flora by administration of lactitol in liver cirrhosis patients // J. Jap. Soc. Gastroenterology. 1995; 92, 7: 1037-1050.
- Bircher J. et al. First use of lactitol in the treatment of Portal – Systemic encephalopathy // Schweiz. Med. Wschr. 1982; 112: 1306-1307.
- Morgan M. Lactitol for the treatment of hepatic encephalopathy / In: Hepatic encephalopathy. Management with lactulose and related carbohydrates. Editors: H.O. Conn and J. Bircher, Medi-Press, Michigan. 1989. P.271-282.
- Lanthier P.L. and Morgan M.Y. Lactitol in the treatment of chronic hepatic encephalopathy: an open comparison with lactulose // Gut. 1985; 26: 415-420.
- Morgan M.Y. and Hawley K.E. Lactitol in the treatment of chronic hepatic encephalopathy: an open comparison with lactulose // Gut. 1985; 26: 415-420.
- Morgan M.Y. and Hawley K.E. Lactitol vs. Lactulose in the treatment of acute hepatic encephalopathy in cirrhotic patients: A double – blind, randomized trial // Hepatology. 1987; 7(6): 1278-1284.
- Shibasaki-Koichi et al. Effects of long-term administration of lactitol or lactulose in cirrhotic patients with chronic hepatic encephalopathy // Ther. Res. 2001; 22(4): 899-907.

СЛАБИТЕЛЬНОЕ СРЕДСТВО

Экспортал®

Саше №20, контейнер пластиковый 200 г

Область применения Экспортала®:

- слабительное, применяется при запорах различной этиологии, относится к группе осмотических, обладает пребиотическими свойствами, нормализуя микрофлору желудочно-кишечного тракта;
- препятствует всасыванию ионов аммония NH_4^+ , применяется для лечения печеночной энцефалопатии или системной энцефалопатии портального происхождения;
- при диабете не повышает уровня глюкозы в крови, так как не расщепляется и не всасывается в тонком кишечнике;
- может применяться у лиц, контролирующих массу тела, так как имеет очень низкую калорийность (2 Ккал/л).

Удобство применения Экспортала®:

- не развивается привыкания - можно поддерживать постоянную эффективную дозу препарата;
- легко растворим в любой жидкости, например, в соке, кофе или чае, представляет собой сладкое вещество;
- не вызывает кариеса, не оказывает вредного воздействия на зубы, так как не снижает pH в полости рта.

Способ применения и дозы:

При запорах

Дети 1-6 лет - 2,5 - 5 г (1/2 - 1 чайная ложка порошка) в сутки.

Дети 6-12 лет - 5 - 10 г (1-2 чайных ложки порошка) в сутки.

Дети 12-16 лет - 10 - 20 г (1-2 пакетика или 2-4 чайных ложки порошка) в сутки.

Взрослые - 20 г (2 пакетика или 4 чайных ложки порошка) в сутки.

Препарат должен вызывать стул один раз в сутки. После наступления стабильного слабительного эффекта его дозу можно снизить. В ряде случаев для получения необходимого эффекта достаточно бывает половины рекомендованной суточной дозы.

При печеночной энцефалопатии, печеночной прекоме и коме, гипераммониемии

Доза препарата должна быть подобрана индивидуально для каждого пациента, в зависимости от степени выраженности заболевания и индивидуальной реакции на препарат. Начальная суточная доза обычно составляет 0,5-0,7 г на 1 кг массы тела. Эту дозу разделяют на три разовые дозы. Принимают во время еды. Должна быть подобрана доза, вызывающая два «мягких» стула в сутки.

