

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ЭУФИЛЛИН

Регистрационный номер: ЛС-000120

Торговое наименование: Эуфиллин

Международное непатентованное наименование: Аминофиллин

Лекарственная форма: таблетки

Состав: 1 таблетка препарата содержит *действующее вещество*: аминофиллин (эуфиллин) - 150,0 мг (в том числе теофиллина безводного - 128,6 мг, этилендиамина - 21,4 мг); *вспомогательные вещества*: крахмал картофельный - 48,4 мг, кальция стеарат - 1,6 мг.

Описание: Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета с фаской.

Фармакотерапевтическая группа: Бронходилатирующее средство - фосфодиэстеразы ингибитор.

Код ATX: [R03DA05]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Бронхолитическое средство, производное ксантина, ингибирует фосфодиэстеразу, увеличивает накопление в тканях циклического аденоzinмонофосфата, блокирует аденоzinовые (пуриновые) рецепторы; снижает поступление ионов кальция через каналы клеточных мембран, уменьшает сократительную активность гладкой мускулатуры. Расслабляет мускулатуру бронхов, увеличивает мукоцилиарный клиренс, усиливает сокращение диафрагмы, улучшает функцию дыхательных и межреберных мышц, стимулирует дыхательный центр, повышает его чувствительность к углекислому газу и улучшает альвеолярную вентиляцию, что в конечном итоге приводит к снижению тяжести и частоты эпизодов апноэ.

Нормализуя дыхательную функцию, способствует насыщению крови кислородом и снижению концентрации углекислоты. Усиливает вентиляцию легких в условиях гипокалиемии. Оказывает стимулирующее влияние на деятельность сердца, увеличивает силу и число сердечных сокращений, повышает коронарный кровоток и потребность миокарда в кислороде. Снижает тонус кровеносных сосудов (главным образом сосудов мозга, кожи и почек). Оказывает периферическое вазодилатирующее действие, уменьшает легочное сосудистое сопротивление, снижает давление в «малом» круге кровообращения. Увеличивает почечный

кровоток, оказывает умеренный диуретический эффект. Расширяет внепеченочные желчные пути.

Стабилизирует мембранные тучных клеток, тормозит высвобождение медиаторов аллергических реакций.

Тормозит агрегацию тромбоцитов (подавляет фактор активации тромбоцитов и простагландинов (PgE₂альфа), повышает устойчивость эритроцитов к деформации (улучшает реологические свойства крови), уменьшает тромбообразование и нормализует микроциркуляцию.

Обладает токолитическим действием, повышает кислотность желудочного сока. При использовании в больших дозах обладает эпилептогенным действием.

Фармакокинетика

Абсорбция. После приема внутрь быстро и полно всасывается. Биодоступность составляет 90 - 100 %. Пища снижает скорость абсорбции, не влияя на ее величину (большие объемы жидкости и белки ускоряют процесс). Чем выше принятая доза, тем ниже скорость абсорбции. Время достижения максимальной концентрации - 1 - 2 ч.

Распределение. Объем распределения находится в диапазоне 0,3 - 0,7 л/кг (30 - 70 % от «идеальной» массы тела), в среднем 0,45 л/кг. Связь с белками плазмы у взрослых - 60 %, у больных с циррозом печени - 36 %. Проникает в грудное молоко (10 % от принятой дозы), через плацентарный барьер (концентрация в сыворотке крови плода несколько выше, чем в сыворотке матери).

Метabolизм. Эуфиллин метаболизируется при физиологических значениях рН с высвобождением свободного теофиллина, который далее подвергается метаболизму в печени при участии нескольких изоферментов цитохрома Р 450. Основными метаболитами являются 1,3-диметил-мочевая кислота (около 40 %), 3-метил-ксантин (около 36 %) и 1-метил-мочевая кислота (около 17 %). Фармакологически активным из них является 3-метил-ксантин (кофеин).

Выведение. Метаболиты выводятся почками. Период полувыведения составляет у детей старше 6 месяцев - 3,7 ч; у взрослых - 8,7 ч; у "курящих" взрослых (20 - 40 сигарет в сутки) - 4 - 5 часов (после отказа от курения нормализация фармакокинетики через 3 - 4 месяца); у взрослых с хронической обструктивной болезнью легких, «легочным» сердцем, легочно-сердечной недостаточностью и при заболеваниях печени - свыше 24 ч.

Показания к применению

Бронхобструктивный синдром любого генеза: бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ), эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит, гипертензия в «малом» круге кровообращения, «легочное» сердце, ночное апноэ.

Противопоказания

Гиперчувствительность к теофиллину и/или этилендиамину, или к любому из вспомогательных веществ препарата, а так же к другим производным ксантина: кофеин, пентоксифиллин, теобромин), эпилепсия, язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в стадии обострения), гастрит с повышенной кислотностью, тяжелая коронарная недостаточность (острая фаза инфаркта миокарда, приступ стенокардии), тяжелая артериальная гипертензия, тяжелая тахиаритмия, геморрагический инсульт, кровоизлияние в сетчатку глаза, порфирия, детский возраст (до 3-х лет).

С осторожностью

Распространенный атеросклероз сосудов, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, частая желудочковая экстрасистолия, нестабильная стенокардия, повышенная судорожная готовность, печеночная и/или почечная недостаточность, кровотечение из желудочно-кишечного тракта в недавнем анамнезе, неконтролируемый гипотиреоз (возможность кумуляции) или тиреотоксикоз, длительная гипертермия, гастроэзофагеальный рефлюкс, гиперплазия предстательной железы, вирусные инфекции, хронический алкоголизм, кистозный фиброз, одновременное применение с антикоагулянтами, пожилой возраст, детский возраст (старше 3-х лет), беременность, период грудного вскармливания.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата Эуфиллин в период беременности и грудного вскармливания возможны только в случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода и ребенка. В случае необходимости применения препарата в высоких дозах грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь назначают взрослым по 150 мг на прием 3 - 4 раза в сутки после еды, при необходимости увеличение дозы с интервалом в 3 дня. Детям с 3-х лет и/или массой тела 20 - 40 кг - по 1 таблетке каждые 12 ч, детям старше 10 лет и/или массой тела более 40 кг - по 1 таблетке 3 - 4 раза в сутки. Высшие дозы эуфиллина для взрослых внутрь: разовая - 0,5 г, суточная - 1,5 г. Высшие дозы для детей: разовая - 7 мг/кг, суточная - 15 мг/кг.

Побочное действие

Нарушения со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, бессонница, возбуждение, тревожность, раздражительность, трепор, судороги, ажитация.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения, тахикардия (в т.ч. у плода при приеме в III триместре беременности), аритмии, снижение артериального давления, кардиалгия, увеличение частоты приступов стенокардии.

Нарушения со стороны пищеварительной системы: гастралгия, тошнота, рвота, гастроэзофагеальный рефлюкс, изжога, обострение язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки, диарея, при длительном приеме - снижение аппетита.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, лихорадка.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: гипергликемия, гипокалиемия, гиперкальциемия, гиперурикемия.

Прочие: боль в груди, тахипноэ, ощущение приливов крови к лицу, задержка мочи, усиление диуреза, повышенное потоотделение.

Побочные эффекты уменьшаются при снижении дозы препарата.

Передозировка

Симптомы: снижение аппетита, гастралгия, диарея, тошнота, рвота (в т.ч. с кровью), желудочно-кишечное кровотечение, тахипноэ, гиперемия кожи лица, тахикардия, желудочковые аритмии, бессонница, двигательное возбуждение, тревожность, светобоязнь, трепор, судороги. При тяжелом отравлении могут развиться эпилептоидные припадки (особенно у детей без возникновения каких-либо предвестников), гипоксия, метаболический ацидоз, гипергликемия, гипокалиемия, снижение артериального давления, некроз скелетных мышц, спутанность сознания, почечная недостаточность с миоглобинурией.

Лечение: отмена препарата, промывание желудка, назначение активированного угля, слабительных лекарственных средств, промывание кишечника комбинацией макрогола и электролитов (кишечный лаваж), форсированный диурез, гемосорбция, плазмосорбция, гемодиализ (эффективность невысока, перitoneальный диализ неэффективен), симптоматическая терапия (в т.ч. метоклопрамид и ондансетрон - при рвоте). При судорогах поддерживать проходимость дыхательных путей и проводить оксигенотерапию. Для купирования эпилептоидного припадка - внутривенно diazepam, 0,1 - 0,3 мг/кг (но не более 10 мг).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает вероятность развития побочных эффектов глюкокортикоидов, минералокортикоидов (гипернатриемия), средств для общей анестезии (возрастает риск воз-

никновения желудочковых аритмий), ксантинов и средств, возбуждающих центральную нервную систему (увеличивает нейротоксичность), бета-адреномиметиков.

Противодиарейные препараты и энтеросорбенты снижают всасывание аминофиллина.

Рифампицин, фенобарбитал, фенитоин, изониазид, карbamазепин, сульфинпиразон, аминоглутетимид, пероральные эстрогенсодержащие контрацептивы и морацизин, являясь индукторами микросомального окисления, повышают клиренс аминофиллина, что может потребовать увеличение его дозы.

В комбинации с ритонавиром, аминоглутетимидом, лекарственными средствами, содержащими гиперицин (препараты зверобоя продырявленного) наблюдается снижение активности аминофиллина, что может потребовать увеличения применяемых доз препарата.

При совместном применении с антибиотиками группы макролидов (особенно эритромицином, тролеандомицином, кларитромицином, джозамицином, спирамицином), линкомицином, хинолонами, фторхинолонами (особенно ципрофлоксацином, пефлоксацином), имипинемом (особенно со стороны центральной нервной системы - судороги), анатагонистами кальция (верапамилом, дилтиаземом), пропранололом, аллопуринолом, циметидином, изопреналином, эноксацином, небольшими дозами этанола, дисульфирамом, рекомбинантным а-интерфероном, пэгинтерфероном, рофекоксибом, пентоксифиллином, фенипропаноламином, ацикловиром, ранитидином, фебуксостатом, флувоксамином, метотрексатом, мексилетином, пропафеноном, тиабендазолом, тиклопидином и при вакцинации против гриппа интенсивность действия аминофиллина может увеличиваться, что может потребовать снижения его дозы.

Усиливает действие бета-адреномиметиков и диуретиков (в т.ч. за счет увеличения клубочковой фильтрации), снижает эффективность препаратов лития и бета-адреноблокаторов.

Совместим со спазмолитиками, не применяют совместно с другими производными ксантина. С осторожностью назначают одновременно с антикоагулянтами из-за опасности развития кровотечений.

Особые указания

Соблюдать осторожность при употреблении больших количеств кофеинсодержащих продуктов или напитков в период лечения; при приеме препарата на фоне лихорадки и острых вирусных инфекций, у пожилых пациентов и пациентов с заболеваниями сердца, печени, гипотиреозом, обострениями легочных заболеваний - ввиду снижения клиренса теофиллина (во избежание интоксикации может потребоваться снижение дозы препарата); у пациентов с гипертиреозом и кистозным фиброзом - ввиду увеличения клиренса теофиллина (необходимо проводить мониторинг концентрации теофиллина в плазме крови у таких пациентов);

у пациентов с пептической язвой (теофиллин увеличивает желудочную секрецию); с нарушениями ритма сердца (утяжеление аритмий на фоне приема препарата); с наличием судорог в анамнезе (увеличение частоты и продолжительности судорожных приступов); с гиперплазией предстательной железы (риск задержки мочеиспускания); с тяжелой артериальной гипертензией; хроническим алкоголизмом; особо тщательное наблюдение необходимо осуществлять за пациентами с тяжелым течением астмы, требующим парентерального введения эуфиллина (рекомендуется проведение мониторинга концентрации теофиллина в плазме крови у таких пациентов).

Возможное влияние лекарственного препарата для медицинского применения на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и механизмами.

Форма выпуска

Таблетки по 150 мг. По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой для упаковки.

3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Срок годности

2 года. Не использовать препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 30 °C .

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование, адрес производителя лекарственного препарата и адрес места производства/Наименование организации, принимающей претензии от потребителей

АО «Органика», Россия, 654034, Кемеровская область, г. Новокузнецк, шоссе Кузнецкое, д. 3, тел. (3843) 994-222, факс: 994-200, www.organica-nk.ru.

Технический директор
АО «Органика»

Ф.В. Гусс

