

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА  
**ЭУФИЛЛИН**

**Регистрационный номер:**

**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:** средства для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; другие средства системного действия для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; ксантины.

**Код АТХ:** R03DA05.

**Фармакологические свойства**

***Фармакодинамика***

Эуфиллин – бронхолитическое средство, производное ксантина; ингибирует фосфодиэстеразу, увеличивает накопление в тканях циклического аденозинмонофосфата, блокирует аденозиновые (пуриновые) рецепторы; снижает поступление ионов кальция через каналы клеточных мембран, уменьшает сократительную активность гладкой мускулатуры.

Расслабляет мускулатуру бронхов, увеличивает мукоцилиарный клиренс, стимулирует 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. 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 венодилатирующее действие, уменьшает легочное сосудистое сопротивление, снижает давление в «малом» круге кровообращения. Увеличивает почечный кровоток, оказывает умеренный диуретический эффект. Расширяет внепеченочные желчные пути. Тормозит агрегацию тромбоцитов (подавляет фактор активации тромбоцитов и P<sub>g</sub>E<sub>2</sub> альфа), 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 – 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.

#### *Распределение*

Время достижения  $C_{max}$  – 1 – 2 ч.  $V_d$  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 пациентов 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).

Бронходилатирующие свойства аминофиллин проявляет в концентрациях 10 – 20 мкг/мл. Концентрация свыше 20 мг/мл является токсической. Возбуждающий эффект на дыхательный центр реализуется при более низком содержании препарата в крови 5 – 10 мкг/мл.

#### *Метаболизм*

Метаболизируется при физиологических значениях рН с высвобождением свободного теофиллина, который далее подвергается метаболизму в печени при участии нескольких изоферментов цитохрома P450. В результате образуются 1,3-диметилмочевая кислота (45 – 55 %), которая обладает фармакологической активностью, но уступает теофиллину в 1 – 5 раз.

Кофеин является активным метаболитом и образуется в небольших количествах. У детей старше 3 лет и у взрослых (в отличие от детей более младшего возраста) феномен кумуляции кофеина отсутствует.

#### *Выведение*

Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) у детей старше 6 месяцев – 3,7 ч; у взрослых – 8,7 ч; у «курильщиков» (20 – 40 сигарет в сутки) – 4 – 5 ч (после отказа от курения нормализация фармакокинетики через 3 – 4 месяца); у взрослых с хронической обструктивной болезнью легких, «легочным» сердцем и легочно-сердечной недостаточностью – свыше 24 ч.

Метаболиты выводятся почками.

### **Показания к применению**

Бронхообструктивный 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 аминофиллину или любому из вспомогательных веществ препарата;
- эпилепсия;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в стадии обострения);
- гастрит с повышенной кислотностью;
- артериальная гипер- или гипотензия тяжелого течения;
- тахикардия;
- геморрагический инсульт;
- кровоизлияние в сетчатку глаза;
- детский возраст (до 3 лет).

### **С осторожностью**

Тяжелая коронарная недостаточность (острая фаза инфаркта миокарда, стенокардия), распространенный атеросклероз сосудов, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, частая желудочковая экстрасистолия, повышенная судорожная готовность, печеночная и/или почечная недостаточность, язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в анамнезе), кровотечение из желудочно-кишечного тракта в недавнем анамнезе, неконтролируемый гипотиреоз (возможность кумуляции) или тиреотоксикоз, длительная гипертермия, гастроэзофагеальный рефлюкс, гиперплазия предстательной железы, беременность, период лактации, пожилой возраст, детский возраст. Назначают одновременно с антикоагулянтами.

### **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, взрослым препарат Эуфиллин следует назначать по 150 мг на прием 1 – 3 раза в день после еды. Детям внутрь следует назначать из расчета 7 – 10 мг/кг в сутки в 4 приема. Длительность курса лечения – от нескольких дней до нескольких месяцев, в зависимости от течения заболевания и переносимости препарата.

Высшие дозы препарата Эуфиллин 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 иммунной системы:* кожная сыпь, зуд, лихорадка.

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

*Нарушения со стороны сердца:* ощущение сердцебиения, тахикардия (в т.ч. у плода при приеме в III триместре беременности), аритмии, кардиалгия, увеличение частоты приступов стенокардии.

*Нарушения со стороны сосудов:* снижение артериального давления.

*Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:* тахипноэ.

*Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:* гастралгия, тошнота, рвота, гастроэзофагеальный рефлюкс, изжога, обострение язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки, диарея, при длительном приеме – снижение аппетита.

*Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:* задержка мочи, усиление диуреза.

*Общие нарушения и реакции в месте введения:* боль в груди, ощущение приливов крови к лицу, повышенное потоотделение.

*Лабораторные и инструментальные данные:* гипергликемия, гипокалиемия, гиперкальциемия, гиперурикемия.

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, тремор, судороги. При тяжелом отравлении могут развиваться 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, перитонеальный диализ неэффективен), симптоматическая терапия (в т.ч. метоклопрамид и ондансетрон – при рвоте). При судорогах поддерживать проходимость дыхательных путей и проводить кислородотерапию. Для купирования эпилептоидного припадка – внутривенно диазепам, 0,1 – 0,3 мг/кг (но не более 10 мг).

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Повышает вероятность развития побочных эффектов глюкокортикостероидов, минералокортикостероидов (гипернатриемия), средств для общей анестезии (возрастает риск возникновения желудочковых аритмий), ксантинов и средств, возбуждающих центральную нервную систему (увеличивает нейротоксичность), бета-адреномиметиков.

Противодиарейные препараты и энтеросорбенты снижают всасывание аминофиллина.

Рифампицин, фенobarбитал, фенитоин, изониазид, карбамазепин, сульфипиразон, аминоглутетимид, пероральные эстрогенсодержащие контрацептивы и морацизин, являясь индукторами микросомального окисления, повышают клиренс аминофиллина, что может потребовать увеличения его дозы.

В комбинации с ритонавиром, аминоглутетимидом, лекарственными средствами, содержащими гиперацин (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, пefлоксацином), имипинемом (особенно со стороны центральной нервной системы – судороги), антагонистами кальция (верапамиллом, дилтиаземом), пропранололом, аллопуринолом, циметидином, изопреналином, эноксацином, небольшими дозами этанола, дисульфирамом, рекомбинантным  $\alpha$ -интерфероном, пэгинтерфероном, рофекоксибом, пентоксифиллином, фенипропаноламином, ацикловиром, ранитидином, фебуксостатом, флувоксамином, метотрексатом, мексилетином, пропafenоном, 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 кофеин-содержащих продуктов или напитков.

### **Влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами, механизмами**

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

### **Форма выпуска**

Таблетки, 150 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

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

### **Условия хранения**

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

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Срок годности**

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

### **Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

### **Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии потребителя**

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»), Российская Федерация, 654034, Кемеровская обл. - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3, тел. (3843) 994-222, факс: 994-200, root@organica.su.