

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
НЕОФІЛІН
(NEOPHYLLINE)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: theophylline; 1,3-диметилксантин;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки плоскоциліндричної форми з фаскою, білого кольору;

склад: 1 таблетка містить теофіліну (у перерахунку на 100 % речовину) – 100 мг або 300 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, тальк, магнію стеарат, 30 % дисперсія метакрилової кислоти-етил акрилат кополімеру (1:1), 30 % дисперсія амоній метакрилат кополімеру, тип А.

Форма випуску. Таблетки пролонгованої дії.

Фармакотерапевтична група. Засоби для системного застосування при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів. Ксантини. Код АТС R03D A04.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Теофілін – природна рослина сполука, алкалоїд. Механізм дії теофіліну зумовлений переважно блокуванням аденозинових рецепторів, пригніченням фосфодіестераз, підвищенням вмісту внутрішньоклітинного цАМФ, зниженням внутрішньоклітинної концентрації іонів кальцію. Внаслідок чого розслаблюється гладенька мускулатура бронхів, шлунково-кишкового тракту, жовчовивідних шляхів, матки, коронарних, церебральних і легеневих судин, зменшується периферичний судинний опір. Препарат підвищує тонус дихальної мускулатури (міжреберних м'язів та діафрагми), знижує опір легеневих судин і поліпшує оксигенацію крові, активує дихальний центр довгастого мозку, підвищує його чутливість до вуглекислого газу, поліпшує альвеолярну вентиляцію, що призводить до зниження тяжкості та частоти епізодів апное. Теофілін усуває ангіоспазм, підвищує колатеральний кровотік та насичення крові киснем, зменшує перифокальний і загальний набряк мозку, знижує лікворний і, відповідно, внутрішньочерепний тиск. Поліпшує реологічні властивості крові, зменшує тромбоутворення, гальмує агрегацію тромбоцитів (пригнічуючи фактор активації тромбоцитів і простагландин F₂альфа), нормалізує мікроциркуляцію. Виявляє протиалергічний ефект, пригнічуючи дегрануляцію опасистих клітин і знижуючи рівень медіаторів алергії (серотоніну, гістаміну, лейкотрієнів). Підсилює нирковий кровотік, виявляє діуретичну дію, зумовлену зниженням каналцевої реабсорбції, збільшує виведення води, іонів хлору, натрію.

Ефект препарату повністю розвивається через 3-4 дні від початку лікування.

Фармакокінетика. При внутрішньому прийомі теофілін повністю всмоктується у шлунково-кишковому тракті, біодоступність становить близько 90 %. При прийомі теофіліну у вигляді таблеток пролонгованої дії максимальна концентрація досягається через 6 годин. Зв'язування з білками плазми крові становить: у здорових дорослих – близько 60 %, у хворих на цироз печінки – 35 %. Проникає крізь гістогематичні бар'єри, розподіляючись у тканини. Близько 90 % теофіліну метаболізується в печінці за участі декількох ізоферментів

цитохрому P₄₅₀ до неактивних метаболітів – 1,3-диметилсечової кислоти, 1-метилсечової кислоти та 3-метилксантину. Екскретується в основному нирками у вигляді метаболітів; у незмінному вигляді виводиться у дорослих до 13 %, у дітей – до 50 % препарату. Частково виділяється з грудним молоком. Період напіввиведення теофіліну залежить від віку та наявності супутніх захворювань і становить: у дорослих пацієнтів, хворих на бронхіальну астму – 6-12 годин, у дітей старше 6 місяців – 3-4 години, у осіб, що палять – 4-5 годин, у осіб похилого віку і при серцевій недостатності, порушенні функції печінки, набряку легенів, хронічних обструктивних хворобах легенів і бронхіті – понад 24 годин, що потребує відповідної корекції інтервалу між введеннями препарату.

Терапевтичні концентрації теофіліну в крові становлять: для досягнення бронхолітичного ефекту – 10-

20 мкг/мл, для збуджуючого ефекту на дихальний центр – 5-10 мкг/мл. Токсичні концентрації – вище 20 мкг/мл.

Показання для застосування. Бронхіальна астма, астматичний статус, хронічний обструктивний бронхіт та захворювання легенів з явищами бронхообструкції, легенева гіпертензія, нічне апное.

Спосіб застосування та дози. Дозу препарату підбирають індивідуально залежно від тяжкості захворювання, маси тіла пацієнта, віку, особливостей метаболізму у осіб, що палять.

У дорослих початкова доза звичайно становить 0,3 г 1 раз на добу. Через 3 доби за відсутності серйозних побічних ефектів дозу можна підвищити до підтримуючої – 0,6 г (по 0,3 г 2 рази на добу), у випадку переважно нічних та ранкових нападів – 0,6 г одноразово ввечері.

У пацієнтів, що палять, початкова доза становить 0,3 г 1 раз на добу, яку при добрій переносимості поступово збільшують кожні 2 дні на 0,3 г до підтримуючої – 0,9-1,2 г (0,6 г ввечері, 0,3-0,6 г вранці).

У осіб з масою тіла менше 60 кг: добова доза становить 0,3 г (1 раз на добу або розподіляючи дозу: 0,2 г ввечері, 0,1 г вранці); при масі тіла менше 40 кг: початкова доза становить 0,2 г 1 раз на добу, підтримуюча – 0,4 г (по 0,2 г 2 рази на добу).

У дітей 12-16 років (при масі тіла 40-60 кг): початкова доза становить 0,3 г 1 раз на добу. Через 3 доби при добрій переносимості дозу можна збільшити до підтримуючої – 0,6 г (по 0,3 г 2 рази на добу).

У дітей 6-12 років (при масі тіла 20-40 кг): початкова доза становить 0,2 г 1 раз на добу. Через 3 доби при добрій переносимості дозу можна збільшити до підтримуючої – 0,4 г (по 0,2 г 2 рази на добу).

У дітей 3-6 років (при масі тіла до 20 кг): початкова доза становить 0,1 г 1 раз на добу. Через 3 доби при добрій переносимості дозу можна збільшити до підтримуючої – 0,2 г (по 0,1 г 2 рази на добу).

Побічна дія. З боку центральної нервової системи: головний біль, запаморочення, збудження, тремор, неспокій, безсоння, судоми;

З боку серцево-судинної системи: тахікардія, аритмія, зниження артеріального тиску;

З боку шлунково-кишкового тракту: дискомфорт і болі в епігастральній ділянці, блювання, печія, загострення холециститу, холестатичний гепатит, підвищення концентрації АЛТ, АСТ у крові;

Алергічні реакції: шкірний висип, свербіж, грипоподібний синдром, затруднення носового дихання.

Протипоказання. Гіперчутливість до компонентів препарату та похідних ксантину (кофеїн, пентоксифілін), епілепсія, виразкова хвороба шлунка або дванадцятипалої кишки у стадії загострення, глаукома, одночасний прийом олеандоміцину або еритроміцину, геморагічний інсульт, крововилив у сітківку ока, гострий інфаркт міокарда, виражений атеросклероз коронарних артерій, попередня внутрішня кровотеча, вагітність, лактація, дитячий вік до 3 років, тяжка артеріальна гіпертензія, тахіаритмія, гіпертрофічна обструктивна кардіоміопатія, гіпертиреоз.

Передозування. Симптоми у дорослих: судоми, підвищення температури тіла, порушення серцевої діяльності (тахікардія, шлуночкові аритмії, гіпотензія).

Симптоми у дітей: підвищена збудливість, порушення психіки, підвищення температури тіла, нудота, судоми, тахікардія, гіпотензія, диспноє.

Лікування. Припинення лікування препаратом, промивання шлунка, зрошування кишечника комбінацією поліетиленгліколю і солей, прийом активованого вугілля, стимуляція виведення теофіліну з організму (форсований діурез, гемосорбція, плазмасорбція, гемодіаліз, перитонеальний діаліз) і призначення симптоматичних засобів: при вираженій нудоті і блюванні – метоклопрамід або ондансетрон, при судомах – діазепам.

Особливості застосування. При тяжких захворюваннях серцево-судинної системи, печінки, вірусній інфекції, особам похилого віку дозу препарату слід зменшити та застосовувати з обережністю. У осіб, що палять, ефективність препарату може бути знижена.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При одночасному застосуванні препаратів теofilіну з симпатоміметиками і діуретичними засобами відбувається взаємне підсилення їх дії; з β -адреноблокаторами і препаратами літїю – їх дія взаємно зменшується. Фармакотерапевтичні ефекти теofilіну можуть знижуватися (внаслідок збільшення його кліренса шляхом індукції мікросомальних ферментів печінки) при одночасному застосуванні з ксантинами, карбамазепіном, дифеніном, рифампіцином, ізоніазидом, тербуталіном. Алопуринол, циметидин, ізопреналін, циклоспорин А, макролідні антибіотики (еритроміцин, олеандоміцин), лінкоміцин, пероральні контрацептиви (естрогени) і протигрипозна сироватка збільшують ризик розвитку побічних явищ теofilіну (внаслідок зменшення його кліренса), що зумовлює необхідність коригування його дози. Підвищується ризик розвитку побічних ефектів глюкокортикоїдів, мінералокортикоїдів, засобів для наркозу (підвищується ризик виникнення шлуночкових аритмій), ксантинів і засобів, що збуджують центральну нервову систему (збільшується нейротоксичність), ефедрину й ефедринвміщуючих препаратів, бета-адреноміметиків.

Умови та термін зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати в недоступному для дітей місці.
Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці; по 5 контурних чарункових упаковок у пачці.

Виробник. ЗАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Адреса. Україна, 02093, Україна, м. Київ, вул. Бориспільська 13.