

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
Юніконтин
(Unicontin)

Склад:

діюча речовина: theophylline;

1 таблетка містить теофіліну 400 мг або 600 мг;

допоміжні речовини: повідон, гідроксіетилцелюлоза, спирт цетостеариловий, тальк, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки пролонгованої дії.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів. Теофілін.

Код АТС R03D A04.

Клінічні характеристики.

Показання. Лікування та профілактика бронхоспазму, пов'язаного з астмою та хронічними обструктивними захворюваннями легень.

Протипоказання. Підвищена чутливість до будь-якого інгредієнта препарату, а також до ксантинових препаратів (наприклад, до кофеїну, теоброміну, пентоксифіліну), гострий період інфаркту міокарда, тахіаритмія, гіпертрофічна обструктивна кардіоміопатія, виражена артеріальна гіпертензія, епілепсія, гіпертиреоз, виразкова хвороба шлунка та дванадцятипалої кишки, тяжкі порушення функції печінки, порфірія. Діти до 12 років.

Спосіб застосування та дози. Дозу встановлюють індивідуально, залежно від особливостей метаболізму, віку та маси тіла. Юніконтин у таблетках по 400/600 мг слід приймати раз на день вранці або ввечері. Препарат рекомендують приймати під час вживання їжі. Пацієнти повинні бути поінформовані, що в разі, якщо вони почали приймати препарат під час їжі або натщесерце, в подальшому необхідно дотримуватись такого режиму приймання препарату.

При прийомі Юніконтину таблетки потрібно ковтати цілими, не розжовуючи їх. Таблетку Юніконтину по 600 мг можна розділити по розподільчій рисці.

Початкові дози та подальший підбір дози препарату (як безводного теофіліну)

A. Пацієнти з нормальним нирковим кліренсом.

Періоди зміни дозування препарату		Діти < 45кг (12-15 років)	Діти > 45кг та дорослі (16-60 років)
1	Початкова доза	12-14мг/кг/день з максимальною добовою дозою не більше 300 мг	300мг-400мг /день перорально
2	Через 3 дні при нормальній переносимості препарату підвищують дозу до:	16мг/кг/день з максимальною добовою дозою не більше 400 мг	400мг-600мг /день перорально
3	Ще через 3 дні при нормальній переносимості препарату і у разі необхідності підвищують дозу до:	20мг/кг/день з максимальною добовою дозою не більше 600 мг	При необхідності призначення препарату в дозі > 600мг дозу необхідно підбирати під контролем концентрації препарату в крові

В. Пацієнти з погіршеним нирковим кліренсом, пацієнти похилого віку (>60 років) та пацієнти, у яких неможливо провести моніторинг сироваткових концентрацій теофіліну.

У пацієнтів віком 12-15 років з ризиком погіршення ниркового кліренсу або при відсутності можливості моніторингу сироваткових концентрацій теофіліну доза препарату не повинна перевищувати 16мг/кг/день з максимальною добовою дозою не більше 400мг.

У підлітків віком ≥ 16 років та дорослих, включно з пацієнтами похилого віку з ризиком погіршення ниркового кліренсу теофіліну або за відсутності можливості моніторингу сироваткових концентрацій теофіліну добова доза препарату не повинна перевищувати 400 мг.

Підбір дозування препарату на основі сироваткових концентрацій теофіліну

Пікові сироваткові концентрації препарату	Підбір дозування
<9.9мкг/мл	При відсутності ефекту від застосування препарату і його переносимості слід збільшити дозу на 25%. Через три дні після цього з метою визначення можливості подальшої корекції дози проводиться повторне визначення сироваткових концентрацій препарату.
10-14.9мкг/мл	При отриманні ефекту від приймання препарату та його переносимості слід продовжити застосування поточної дози з повторним визначенням сироваткових концентрацій препарату через кожні 6-12 місяців.* При відсутності ефекту від прийому препарату та його переносимості слід додати до схеми лікування інші лікарські засоби.
15-19.9мкг/мл	Потрібно розглянути можливість зменшення дози Юніконтину на 10% з метою підвищення безпечності препарату навіть при його переносимості

20-24.9мкг/мл	Необхідно зменшити дозу препарату на 25% навіть за відсутності будь яких побічних ефектів. Через три дні після цього з метою визначення можливості подальшої корекції дози проводиться повторне визначення сироваткових концентрацій препарату.
25-30мкг/мл	Необхідно пропустити наступну дозу препарату та зменшити наступні дози на 25% навіть за відсутності будь яких побічних ефектів. Через три дні після цього з метою визначення можливості подальшої корекції дози проводиться повторне визначення сироваткових концентрацій препарату. За наявності симптомів передозування слід вжити відповідних лікувальних заходів.
>30мкг/мл	Загальне передозування. При подальшому призначенні теофіліну дозу необхідно знизити щонайменше на 50 %, провести повторне визначення сироваткових концентрацій препарату через три дні з метою визначення можливості подальшої корекції дози.

*Зменшення дози та/або моніторинг сироваткової концентрації теофіліну показані за наявності побічних ефектів, фізіологічних порушеннях, здатних знизити кліренс теофіліну.

Побічні реакції. На початку лікування можуть спостерігатися помірні тимчасові побічні ефекти.

З боку травного тракту: печія, нудота, блювання, біль у животі, діарея;

з боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття, тахікардія;

з боку центральної нервової системи: запаморочення, головний біль, неспокій, підвищена збудливість, дратівливість, безсоння;

алергічні реакції: шкірний висип, еритема, ексфолювативний дерматит.

Якщо концентрація теофіліну в сироватці перевищує терапевтичну концентрацію (у гіперчутливих пацієнтів навіть раніше), можуть виникати такі побічні ефекти:

з боку травного тракту: повторне блювання;

з боку серцево-судинної системи: різке зниження артеріального тиску, порушення серцевого ритму (тахіаритмія);

з боку центральної нервової системи: порушення сну, тремор, марення, конвульсії, судоми;

інші побічні реакції: алопеція, збільшення об'єму виділення сечі, підвищення температури тіла.

Під час лікування теофіліном концентрація калію в сироватці може знизитись (гіпокаліємія), а концентрація кальцію, креатиніну, цукру і солей сечової кислоти може збільшитись (гіперкальціємія, гіперглікемія, гіперурикемія).

Передозування. Передозування спостерігається, якщо концентрація теофіліну в сироватці перевищує 110 мкмоль/л.

Клінічні ознаки передозування включають тремор, нудоту, блювання, болі у животі, діарею, марення, в особливо тяжких випадках – також порушення серцевого ритму (тахіаритмія), різке зниження артеріального тиску і судоми. Тахіаритмія і судоми можуть виникнути раптово, без попереджувальних ознак, типових для незначного передозування (наприклад нудоти і блювання). У більшості випадків достатньо зменшити дозу або тимчасово припинити застосування препарату.

Після прийому надмірної кількості препарату можуть спостерігатися гіпотензія, неспокій, тремор, марення, судоми і тяжчі порушення серцевого ритму. У таких випадках треба негайно визначити концентрацію теофіліну в сироватці крові і відповідним чином зменшити дозу препарату.

Лікування інтоксикації: промивання шлунка і застосування активованого вугілля.

Треба контролювати стан пацієнта, особливо артеріальний тиск, серцевий ритм, дихання і концентрацію теофіліну і калію в сироватці крові. У тяжких випадках можна прискорити виведення

теофіліну за допомогою гемосорбції або гемодіалізу. У випадку гіпокаліємії необхідна термінова внутрішньовенна інфузія розчину калію хлориду, моніторинг калію в плазмі крові.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Теофілін проникає крізь плаценту і виділяється з грудним молоком. Вагітні можуть приймати препарат тільки в тому разі, якщо позитивний ефект для матері переважає ризик для плода. У вагітних треба частіше визначати концентрацію теофіліну в сироватці і відповідним чином коригувати дозу. Треба уникати застосування теофіліну наприкінці періоду вагітності, тому що він може пригнічувати скорочення матки.

Жінки, які годують груддю, повинні пильнувати появу реакції гіперчутливості до теофіліну в немовляти, збудження або проблеми зі сном і звертатися до лікаря за консультацією з метою прийняття рішення про припинення грудного годування або про відміну препарату для матері.

Діти. Безпечність та ефективність застосування у дітей до 12 років не з'ясовані.

Особливості застосування. Препарат слід з обережністю призначати і тільки за гострої потреби хворим на нестабільну стенокардію, при захворюваннях серця, тахіаритмічних порушеннях серцевого ритму, хворим на артеріальну гіпертензію, з порушенням функції нирок і печінки, порфірією, а також пацієнтам з виразковою хворобою в анамнезі і пацієнтам старше 60 років.

Дозу теофіліну треба зменшувати пацієнтам із серцевою недостатністю, порушенням функції печінки (особливо хворим на цироз печінки), із зниженою концентрацією кисню в крові (гіпоксемія), хворим на пневмонію, з вірусними інфекційними захворюваннями (особливо при захворюванні на грип). Теофілін може змінювати деякі лабораторні показники: збільшувати кількість жирних кислот і рівень катехоламінів у сечі. Потрібно проводити моніторинг сироваткових концентрацій теофіліну (кожні 6-12 місяців) навіть у пацієнтів без будь-якої симптоматики. Не слід продовжувати застосування препарату в дозі, що не переноситься пацієнтом. Прийом препарату з їжею посилює його абсорбцію.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Деякі побічні ефекти (наприклад, запаморочення) можуть впливати на здатність керувати автомобілем та іншими механічними засобами. Необхідно уникати керування автомобілем і роботи з небезпечними механічними засобами при вищевказаних симптомах.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Під час лікування не слід вживати алкогольні напої, велику кількість їжі і напоїв, що містять метилксантин (кава, чай, какао, шоколад, кока-кола), споріднені з теофіліном препарати (кофеїн, теобромін, пентоксифілін), тому що ці речовини можуть посилити стимулюючу дію теофіліну на центральну нервову систему.

Дія теофіліну може посилитися при одночасному застосуванні алопуринолу, циметидину, дисульфіраму, фенілбутазону, флувоксаміну, фторохінолонів, фуросеміду, іміпенему, інтерферону альфа, ізоніазиду, антагоністів кальцію, лінкоміцину, макролідів, мексилетину, парацетамолу, пентоксифіліну, пероральних контрацептивів, пробенециду, пропafenону, пропранололу, ранітидину, такрину, тіабендазолу, тиклопідину, вілоксазину або вакцини проти грипу. У пацієнтів, які паралельно з теофіліном приймають один або кілька із зазначених вище препаратів, треба контролювати концентрацію теофіліну в сироватці і зменшити дозу, якщо це необхідно.

При одночасному прийомі ципрофлоксацину дозу теофіліну треба зменшити як мінімум на 60 %, а при одночасному прийомі еноксацину – на 30 %.

Ефект теофіліну може зменшитись при одночасному прийомі протиепілептичних засобів (наприклад фенітоїну, карбамазепіну, примідону), барбітуратів (особливо фенобарбіталу і пентобарбіталу), ізопротеренолу, магнію гідроксиду, морацизину, рифампіцину, ритонавіру або сульфінпіразону. Ефект теофіліну може бути меншим також у курців. У пацієнтів, які одночасно з теофіліном приймають один або кілька із зазначених вище препаратів, треба контролювати концентрацію теофіліну в сироватці і збільшити дозу, якщо це є необхідним.

Теофілін може посилити ефект агоністів бета-рецепторів, діуретиків і резерпіну. Теофілін може

зменшити ефективність аденозину, літію карбонату і антагоністів бета-рецепторів.

Треба уникати паралельного застосування теофіліну і антагоністів бета-рецепторів, тому що теофілін може втратити свою ефективність. Наркоз галотаном може спричинити серйозні порушення серцевого ритму у пацієнтів, які приймають теофілін.

Під час лікування теофіліном може виникнути гіпокаліємія, особливо при комбінованому лікуванні агоністами альфа-рецепторів, тіазидними діуретиками, фуросемідом, кортикоїдами, а також при гіпоксемії; тому рекомендується періодично перевіряти рівень калію у сироватці крові.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Теофілін – бронхолітичний засіб групи метилксантинів. Виявляє стимулюючу дію на ЦНС, міокард та скелетні м'язи, спричиняє розслаблення гладких м'язів, а також проявляє помірну діуретичну дію. Механізм дії теофіліну базується на здатності його інгібувати фермент фосфодіестеразу. Теофілін впливає також на гладкі м'язи коронарних артерій, кровоносних судин м'язів і нирок, розслаблює м'язи матки, кардіоезофагеального сфінктера та жовчних протоків. Теофілін сприяє збільшенню фракції витиснення крові з правого шлуночка, збільшенню серцевого викиду, зниженню опору у легеневих кровоносних судинах і зменшенню легеневої гіпертензії. Теофілін стимулює центр дихання, збільшує скорочення м'язів діафрагми і дихальних м'язів, посилює діурез, збільшує секрецію катехоламінів з надниркових залоз. Найбільший терапевтичний ефект досягається при концентраціях 5-20 мкг/мл у плазмі крові. Саме при таких сироваткових концентраціях досягається оптимальне співвідношення ефективності та токсичності препарату.

Фармакокінетика. Фармакокінетика теофіліну широко варіює у одних і тих же пацієнтів та не залежить від демографічних показників. Крім того, деякі супутні захворювання та препарати здатні впливати на фармакокінетику теофіліну. Тому рекомендується постійно контролювати сироваткові концентрації теофіліну у тяжко хворих пацієнтів (з інтервалом 24 години) та періодично контролювати сироваткові рівні препарату (з інтервалом 6-12 місяців) у пацієнтів, які отримують тривалі курси терапії теофіліном.

Теофілін повністю всмоктується із шлунково-кишкового тракту. Стаціонарні концентрації встановлюються протягом 2 - 3 днів регулярного вживання. Теофілін розподіляється в усі органи і рідини організму; метаболізується в печінці. Один з його метаболітів (3-метилксантин) також має бронхорозширюючу дію. Теофілін і його метаболіти виводяться нирками.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

по 400 мг: білі, круглі, плоскі, зі скошеними краями таблетки з розподільчою рисою з однієї сторони, з гравіюванням логотипу „ММ” у крузі на одній стороні та „U/400” на другій;

по 600 мг: білі, довгастої форми, двоопуклі таблетки з гравіюванням логотипу „ММ” у крузі на одній стороні та „U/600” на другій, з розподільчою рисою з однієї сторони.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі до 25 °С, у сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 10 блістерів у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Моді-Мундіфарма Pvt. Лтд.

Місцезнаходження. Модіпурам – 250 110, У.П. Індія.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com