

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ТЕОТАРД
(ТЕОТАРД)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: theophyllinum;

основні фізико-хімічні властивості: капсули, заповнені білими гранулами; корпус капсули прозорий, зеленого кольору; кришечка капсули непрозора, зеленого кольору;

склад: 1 капсула містить 200 мг або 350 мг теофіліну;

допоміжні речовини: повідон, тальк, амонію метакрилату сополімер тип А, амонію метакрилату сополімер тип Б, кремнію діоксид колоїдний безводний, дибутилфталат.

Форма випуску. Капсули пролонгованої дії.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Теофілін - засіб, який розширює бронхи. Розслаблюючи гладкі м'язи бронхів, він збільшує потік повітря через бронхи і таким чином поліпшує дихання. Оскільки теофілін поліпшує транспорт бронхіального слизу (війковий епітеліальний кліренс) завдяки збільшенню секреції слизу і сурфактанту, він поліпшує відхаркування. Протизапальна дія теофіліну полягає у гальмуванні проліферації Т-лімфоцитів, пригніченні секреції цитокінів (наприклад, інтерлейкіну-2, фактора некрозу пухлини), активності еозинофілів, макрофагів і опасистих клітин. Ці ефекти призводять до послаблення запалення слизової оболонки бронхів.

Теофілін впливає також на гладкі м'язи коронарних артерій, кровоносних судин м'язів і нирок, розслаблює м'язи матки, кардіоезофагеального сфінктера та жовчних проток. Теофілін сприяє збільшенню фракції зігнання крові з правого шлуночка, збільшенню серцевого викиду, зниженню опору у легених 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.

Фармакокінетика. Препарат виготовляється за спеціальною технологічною схемою. Капсули містять гранули, з яких поступово вивільнюється теофілін для запобігання різкому підвищенню або зменшенню його концентрації.

Теофілін повністю всмоктується з шлунково-кишкового тракту. Найвищі концентрації в крові досягаються приблизно через 7 годин після прийому, а стаціонарні концентрації – протягом 2 - 3 днів регулярного вживання. Теофілін розподіляється в усі органи і рідини організму; він метаболізується в печінці. Один з його метаболітів (3-метилксантин) також має бронхорозширюючу дію. Теофілін і його метаболіти виводяться через нирки.

Період напіввиведення теофіліну у людей, які не палять, становить 7 – 9 годин. У людей, які палять, а також у дітей цей час зменшується, а у людей з порушенням функції печінки і із серцевою недостатністю – збільшується.

Показання для застосування. Всі види астми у дітей і дорослих, хронічні обструктивні захворювання легень, емфізема легень, легенева гіпертензія при хронічному “легеневому серці”, центральні порушення дихання під час сну (нічне пароксизмальне апное).

Спосіб застосування та дози. Дозу встановлюють індивідуально, залежно від віку, маси тіла і особливостей метаболізму.

Звичайна доза для дорослих і підлітків з масою тіла більше 40 кг становить 350 мг теофіліну двічі на добу.

Звичайна доза для дітей старше 6 років і з масою тіла більше 20 кг, для підлітків становить 200 мг теофіліну двічі на добу.

Пацієнти з нічною астмою або порушеним диханням під час сну можуть приймати разову дозу Теотарду на ніч. У середньому достатньою є добова доза від 400 до 700 мг Теотарду. Рекомендується першу дозу Теотарду приймати ввечері, на ніч. Препарат приймають після їди, з великою кількістю води. Капсули треба ковтати цілими, не розжовуючи їх.

Ефективність лікування і переносимість теофіліну треба визначити на третій день лікування. При задовільній ефективності лікування продовжують з використанням встановленої дози, а при незадовільній ефективності дозу збільшують. При появі побічних ефектів дозу зменшують.

Дози теофіліну визначають на основі клінічного ефекту, концентрації теофіліну в сироватці крові і можливих побічних ефектів. Бажана терапевтична концентрація теофіліну в сироватці крові – від 55 до 110 мкмоль/л (10 - 20 мг/л).

Терапевтичні концентрації теофіліну в сироватці визначають у лабораторії. Точні значення концентрації теофіліну одержують, беручи кров для аналізу через 4 години після застосування ранкової дози у пацієнта, який приймає Теотард двічі на добу, і через 12 годин після вечірньої дози у пацієнта, який приймає одноразово добову дозу Теотарду. Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання.

Побічна дія. На початку лікування можуть спостерігатися помірні і тимчасові побічні ефекти, такі як головний біль, підвищена збудливість, дратівливість, запаморочення, безсоння, сильне серцебиття і/або неприємне відчуття серцебиття (тріпотіння), біль у животі, нудота, блювання, діарея і алергічні реакції.

Якщо концентрація теофіліну в сироватці перевищує терапевтичну концентрацію (у гіперчутливих пацієнтів навіть раніше), можуть виникати такі побічні ефекти: порушення сну, більший об'єм виділення сечі, повторне блювання, тремор, підвищення температури тіла, марення, порушення серцевого ритму (тахіаритмія), різке зниження артеріального тиску і м'язові судоми.

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).

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. Діти до 6 років або з масою тіла менше 20 кг.

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

Клінічні ознаки передозування включають тремор, нудоту, блювання, діарею, марення, в особливо тяжких випадках – також порушення серцевого ритму (тахіаритмія), різке зниження артеріального тиску і судоми м'язів. 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 Теотарду.

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

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 гемоперфузії або гемодіалізу.

Особливості застосування. Теотард слід з обережністю призначати і тільки за гострої потреби хворим на нестабільну стенокардію, при захворюванні серця, коли спостерігаються тахіаритмічні порушення 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), з пониженою 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.

Вагітність і лактація.

Теофілін проходить 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.

Вплив на здатність керувати автомобілем та іншими механічними засобами.

Деякі побічні ефекти (наприклад, запаморочення) можуть впливати на здатність керувати автомобілем та іншими механічними засобами. Пацієнтам необхідно порадити, щоб вони не сідали за кермо і не працювали з небезпечними механічними засобами, доки не переконаються у тому, що вони нормально реагують на лікування.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Під час лікування Теотардом не слід вживати алкогольні напої, велику кількість їжі і напоїв, які 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, імipенему, 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 з 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 з 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.

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 С в недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Капсули по 200 мг або 350 мг №40 (10x4) в блістерах, у картонній коробці.

Виробник. КРКА, д.д., Ново место спільно з Klinge Pharma GmbH, Мюнхен, Німеччина.

Адреса. Шмар'єшка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія.