

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ТЕОПЕК**  
**(ТНЕОРАЕС)**

**Склад.**

*Діюча речовина:* theophylline;

1 таблетка містить теофіліну 300 мг;

*допоміжні речовини:* композиційний полімерний носій, кальцію стеарат.

**Лікарська форма.** Таблетки.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби для системного застосування при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів. Ксантини. Теофілін.

Код АТС R03D A04.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

Бронхіальна астма;

хронічні обструктивні захворювання легень (хронічний обструктивний бронхіт, емфізема легень);

інші захворювання легень з явищами бронхообструкції;

легенева гіпертензія;

апное уві сні.

**Протипоказання.**

Підвищена чутливість до компонентів препарату та/або похідних ксантину (кофеїн, пентоксифілін, амінофілін, теобромін, теофілілату холін);

епілепсія та інші судомні стани;

гострий інфаркт міокарда, тяжка гіпертонічна хвороба, порушення серцевого ритму, обструктивна гіпертрофічна кардіоміопатія;

виразкова хвороба шлунка та дванадцятипалої кишки;

гіпертиреоз;

тяжкі порушення функції печінки;

дитячий вік до 6 років.

**Спосіб застосування та дози.**

Теопек приймають внутрішньо за 30 – 60 хв до їди або через 2 год після їди, запиваючи склянкою води. Таблетку можна розділити навпіл, але не можна подрібнювати, розжовувати або розчиняти у воді. В деяких випадках, для зменшення подразнювального впливу на слизову оболонку шлунка, препарат потрібно приймати під час або одразу після прийому їжі.

Режим дозування встановлюється індивідуально в залежності від віку, маси тіла та особливостей метаболізму.

Початкова добова доза для дорослих та дітей з масою тіла більше 45 кг становить 300 мг (1 таблетка 1 раз на добу). Через 3 дні прийому препарату добову дозу підвищують до 450 мг (1½ таблетки), ще через 3 дні лікування, при необхідності, добову дозу можна підвищити до 600 мг (по 1 таблетці 2 рази на добу). Підвищення доз можливе тільки за умови доброї переносимості.

У дітей віком від 6 до 12 років з масою тіла 20 – 45 кг добова доза становить 150 мг (½ таблетки 1 раз на добу). Через 3 дні прийому препарату добову дозу підвищують до 300 мг (по ½ таблетки 2 рази на добу), ще через 3 дні лікування добова доза може бути збільшена до 450 – 600 мг (по 1½ таблетці 1 раз на добу або по 1 таблетці 2 рази на добу). Підвищення доз можливе тільки за умови доброї переносимості.

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

Подальше підвищення доз рекомендується проводити на підставі вимірювання концентрації теофіліну в сироватці крові.

У пацієнтів, які палять, добова доза може бути поступово збільшена до 900 – 1050 мг (3 – 3½ таблетки).

### ***Побічні ефекти.***

- Зі сторони шлунково-кишкового тракту:* печія, анорексія, нудота, блювання, біль у животі, діарея;
- зі сторони серцево-судинної системи:* відчуття серцебиття, тахікардія, зниження артеріального тиску, порушення серцевого ритму;
- зі сторони центральної нервової системи:* запаморочення, головний біль, неспокій, збудження, порушення сну, тремор, судоми;
- алергічні реакції:* шкірний висип, еритема, ексфолюативний дерматит.

### ***Передозування.***

*Симптоми.* Блювання, що повторюється, збудження, тахікардія, зниження артеріального тиску, порушення серцевого ритму, слабкість у м'язах, судоми, підвищення температури тіла, порушення електролітного складу крові (гіпокаліємія, гіпофосфатемія, гіперкальціємія, гіпомагніємія), гіперглікемія, метаболічний ацидоз, рабдоміоліз, гостра ниркова недостатність.

*Лікування.* Припинення застосування препарату, промивання шлунка, внутрішньо – активоване вугілля, осмотичні проносні засоби, гемодіаліз. Контроль рівня теофіліну в сироватці крові, моніторування ЕКГ та функції нирок. При судомному синдромі показано застосування діазепаму, при гіпокаліємії – препаратів калію. У пацієнтів, які не страждають на бронхіальну астму, при появі вираженої тахікардії можливе застосування неселективних бета-адреноблокаторів.

### ***Застосування у період вагітності або годування груддю.***

Застосування Теопеку в період вагітності можливе тільки у випадку, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода.

При необхідності застосування препарату у жінок, які годують груддю, вигодовування рекомендується припинити.

### ***Діти.***

Препарат не застосовується у дітей віком до 6 років.

### ***Особливості застосування.***

Теопек необхідно з обережністю призначати пацієнтам літнього віку, хворим на серцеву недостатність та інші серцево-судинні захворювання, пацієнтам із порушенням функцій печінки та нирок, хворим на алкоголізм, гіпотиреоз, із підвищеною температурою тіла, хворим на гострі вірусні інфекції, пневмонію, порфірію, з ознаками гіпопротеїнемії. Дієта з низьким вмістом білків та високим вмістом вуглеводів знижує кліренс теофіліну, дієта з високим вмістом білків та низьким вмістом вуглеводів підвищує кліренс теофіліну. При застосуванні теофіліну слід утримуватись від вживання їжі та напоїв, які містять кофеїн, оскільки при цьому зростає ризик розвитку побічних реакцій.

Ризик розвитку побічних реакцій значно зростає при підвищенні сироваткової концентрації теофіліну більше 20 мкг/мл (110 мкмоль/л). Для контролю за безпекою застосування препарату необхідне проведення лікарського моніторингу.

Метаболізм теофіліну у пацієнтів, які палять, більш інтенсивний, ніж у пацієнтів, які не палять, що проявляється у зменшенні періоду напіввиведення препарату до 4 – 5 год і потребує призначення препарату в більш високих дозах.

### ***Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.***

Теопек не впливає на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими

механізмами.

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

*Антибактеріальні, протигрибкові, противірусні препарати.*

Макроліди (окрім азитроміцину), хінолонові антибіотики, тетрацикліни, лінкоміцин, кетоконазол, флуконазол, гризеофульвін, піпемідинова кислота знижують кліренс теофіліну, в результаті чого підвищується ризик розвитку побічних реакцій;

рифампіцин, ізоніазид підвищують кліренс теофіліну;

ритонавір знижує концентрацію теофіліну в сироватці крові;

ацикловір може пригнічувати метаболізм теофіліну;

інтерферон знижує кліренс теофіліну.

*Засоби, що впливають на серцево-судинну систему.*

Пропранолол, тиклопідин, еналапріл, верапаміл, ділтіазем, ніфедипін, мексилетин знижують кліренс теофіліну, в результаті чого підвищується ризик розвитку побічних реакцій;

при застосуванні адреноміметиків підвищується ризик розвитку тахіаритмії;

сумісне застосування бета-адреноблокаторів із Теопеком зменшує бронходилатуючу дію теофіліну та може спричинити бронхоспазм;

теофілін знижує ефективність антигіпертензивних лікарських засобів.

*Інші лікарські засоби.*

Алопуринол, гормональні контрацептиви, дисульфірам, метотрексат, циметидин, ранітидин, ланзопразол, цетиризин, пірантел, тіобендазол знижують кліренс теофіліну та підвищують ризик розвитку побічних реакцій на теофілін;

антациди можуть уповільнювати всмоктування теофіліну;

при сумісному застосуванні з кортикостероїдами підвищується ризик розвитку побічних реакцій;

теофілін підсилює ефект сечогінних засобів;

теофілін знижує терапевтичний ефект препаратів літію, векуронію броміду, піпекуронію броміду;

теофілін підсилює гіпоглікемічну дію гліклазиду;

фенобарбітал, фенітоїн, карбамазепин, сульфінпіразон підвищують кліренс теофіліну;

теофілін може призводити до порушень серцевого ритму при застосуванні галотанового наркозу.

Токсичність теофіліну збільшується при одночасному застосуванні інших препаратів ксантинового ряду.

### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Механізм дії теофіліну полягає в неселективному інгібуванні фосфодіестерази. Інгібування фосфодіестерази III типу призводить до підвищення концентрації цАМФ в міофібрилах великих, середніх бронхів та бронхіол, внутрішньоклітинного перерозподілу іонів кальцію зі зниженням їх концентрації в цитозолі. Інгібування фосфодіестерази IV типу призводить до пригнічення функції опасистих клітин, еозинофілів, Т-лімфоцитів.

У терапевтичних концентраціях теофілін блокує аденозинові бронхоконстрикторні рецептори A1, та меншою мірою – бронходилатаційні рецептори A2. Теофілін знижує співвідношення A1/A2 та є ефективним антагоністом аденозинових рецепторів у концентраціях, що в 20 – 100 разів менші від тих, що необхідні для інгібування фосфодіестерази.

Стимулююча дія на дихальний центр призводить до посилення вентиляції легень за рахунок підвищення скорочувальної здатності міжреберних м'язів та діафрагми.

Теофілін, розширюючи легеневі судини, знижує тиск у малому колі кровообігу (знижує транзиторну гіпертензію в малому колі кровообігу під час нападу бронхіальної астми), покращує насосну функцію правого та лівого шлуночків серця.

Теофілін підвищує синтез та секрецію ендогенних катехоламінів, чинить діуретичну дію за рахунок підвищення ниркового кровообігу та клубочкової фільтрації. Чинить стимулюючу дію на ЦНС.

*Фармакокінетика.*

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

Теопек має пролонговану дію. При дворазовому застосуванні препарату терапевтична концентрація у крові підтримується впродовж доби. Терапевтична концентрація в сироватці крові становить 10 – 20 мкг/мл (55 – 110 нмоль/л).

Біодоступність теофіліну становить близько 90 %. Проникає крізь гістогематологічні бар'єри. Час досягнення максимальної концентрації у крові – 3 – 6 год.  $T_{1/2}$  теофіліну у пацієнтів, які не палять, становить 6 – 12 год, у пацієнтів, які палять – 4 – 5 год. Метаболізується у печінці ізоферментами цитохрому P450 до 1,3-диметилсечової кислоти, 1-метилсечової кислоти, 3-метилксантину. Метаболіти виводяться переважно із сечею. Кліренс теофіліну знижується у літніх пацієнтів, пацієнтів із порушенням функції печінки, хворих на серцеву недостатність. У курців кліренс теофіліну підвищується.

**Фармацевтичні характеристики.**

**Основні фізико-хімічні властивості:** таблетки круглої форми, білого кольору, з плоскою поверхнею зі скошеними краями і рискою. Допускаються вкраплення жовтуватого кольору.

**Термін придатності.** 5 років.

**Умови зберігання.** Зберігати в сухому, захищеному від світла, недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

**Упаковка.** По 10 таблеток у блістері, по 5 блістерів у пачці.

**Категорія відпуску.**

За рецептом.

**Виробник.**

ЗАТ НВЦ “Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод”.

**Місцезнаходження.**

Україна, 03134, м. Київ, вул. Миру, 17.