

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**ЭУФИЛЛИН**

**Регистрационный номер:**

**Торговое наименование:** Эуфиллин

**Международное непатентованное наименование:** Аминофиллин

**Лекарственная форма** Таблетки

**Состав на одну таблетку**

*Действующее вещество:* аминофиллин (эуфиллин) – 150,0 мг.

*Вспомогательные вещества:* крахмал картофельный – 48,5 мг, кальция стеарат – 1,5 мг.

**Описание**

Таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, плоскоцилиндрические.

**Фармакотерапевтическая группа**

Бронходилатирующее средство

**Код АТХ [R03DA05]**

**Фармакологические свойства**

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

Расслабляет мускулатуру бронхов, 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 повышает потребность миокарда в кислороде. Снижает тонус кровеносных сосудов (главным образом, сосудов мозга, кожи и почек). Оказывает периферическое венодилатирующее действие, уменьшает легочное сосудистое сопротивление, понижает давление в «малом» круге кровообращения. Увеличивает почечный кровоток, оказывает умеренный диуретический эффект. Расширяет внепеченочные желчные пути.

Стабилизирует мембраны тучных клеток, тормозит высвобождение медиаторов аллергических реакций.

Тормозит агрегацию тромбоцитов (подавляет фактор активации тромбоцитов и простагландин E<sub>2</sub> (P<sub>g</sub>E<sub>2</sub>), 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.***

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. Время достижения максимальной концентрации – 1-2 часа. Объем распределения 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 больных 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.

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

У детей старше 3 лет и у взрослых (в отличие от детей более младшего возраста) феномен кумуляции кофеина отсутствует. Период полувыведения его у детей старше 6 месяцев – 3,7 часов, у взрослых 8,7 часов, у курящих (20-40 сигарет в сутки) - 4-5 часов (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 часов. Метаболиты выводятся почками.

#### **ПОКАЗАНИЯ**

Бронхообструктивный синдром любого генеза; бронхиальная астма (препарат выбора у больных с астмой физического напряжения и как дополнительное средство при других формах), хроническая обструктивная болезнь легких (хронический обструктивный бронхит, эмфизема легких), гипертензия в малом круге кровообращения, «легочное» сердце, ночное апноэ.

## **ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ**

Повышенная чувствительность к препарату (в т.ч. к другим производным ксантина: кофеин, пентоксифиллин, теобромин), эпилепсия, язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в стадии обострения), гастрит с повышенной кислотностью, тяжелая артериальная гипер- и гипотензия, тахиаритмии, геморрагический инсульт, кровоизлияние в сетчатку глаза, детский возраст (до 3 лет).

## **С ОСТОРОЖНОСТЬЮ**

Ишемическая болезнь сердца (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), желудочно-кишечное кровотечение в недавнем анамнезе, неконтролируемый гипотиреоз (возможность кумуляции) или тиреотоксикоз, длительная гипертермия, гастроэзофагеальный рефлюкс, аденома предстательной железы, беременность, период лактации, пожилой возраст, детский возраст.

## **ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ**

Применение препарата в период беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает риск для плода.

При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

## **СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ**

Дозу следует подбирать в соответствии с индивидуальными особенностями каждого больного, с учетом клинического ответа и стабильной концентрации эуфиллина в сыворотке крови.

Внутрь, взрослым следует назначать по 150 мг 3-4 раза в день после еды.

Детям старше 3 лет внутрь следует назначать из расчета 7-10 мг/кг в сутки в 4 приема.

Высшие дозы эуфиллина для взрослых: разовая 500 мг; суточная – 1500 мг.

Высшие дозы для детей старше 3 лет: разовая – 7 мг/кг, суточная – 15 мг/кг.

Длительность курса лечения – от нескольких дней до нескольких месяцев, в зависимости от течения заболевания и переносимости препарата.

Для уменьшения токсических эффектов следует назначать в минимальных эффективных дозах.

## **ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ**

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, бессонница, возбуждение, тревожность, раздражительность, тремор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, тахикардия (в том числе у плода при приеме беременной в III триместре), аритмии, кардиалгия, снижение артериального давления, увеличение частоты приступов стенокардии.

Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, тошнота, рвота, гастроэзофагеальный рефлюкс, изжога, обострение язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки, диарея, при длительном приеме – снижение аппетита.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, лихорадка.

Прочие: боль в груди, тахипноэ, ощущение «приливов» к лицу, альбуминурия, гематурия, гипогликемия, усиление диуреза, повышенное потоотделение.

## **ПЕРЕДОЗИРОВКА**

Симптомы: снижение аппетита, гастралгия, диарея, тошнота, рвота (в том числе с кровью), желудочно-кишечное кровотечение, тахипноэ, гиперемия кожи лица, тахикардия, желудочковые аритмии, бессонница, двигательное возбуждение, тревожность, светобоязнь, тремор, судороги. При тяжелом отравлении могут развиваться эпилептиформные припадки (особенно у детей без возникновения 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, форсированный диурез, гемосорбция, плазмасорбция, гемодиализ (эффективность не велика, перитонеальный диализ не эффективен), симптоматическая терапия (в том числе метоклопрамид и ондансетрон – при рвоте). При возникновении судорог поддерживать проходимость дыхательных путей и проводить оксигенотерапию. Для купирования припадков введение внутривенно диазепама в дозе 0,1-0,3 мг/кг (не более 10 мг). При сильной тошноте и рвоте - метоклопрамид и ондансетрон (внутривенно).

## **ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ**

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

Противодиарейные препараты и энтеросорбенты снижают всасывание аминофиллина.

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

При одновременном применении с антибиотиками группы макролидов, линкомицином, аллопуринолом, циметидином, изопреналином, эноксацином, небольшими дозами этанола, дисульфирамом, фторхинолонами, рекомбинантным интерфероном альфа, метотрексатом, мексилетином, пропafenоном, тиабендазолом, тиклопидином, верапамилом и при вакцинации против гриппа интенсивность действия аминофиллина может увеличиваться, что может потребовать снижения его дозы.

Увеличивает действие бета-адреностимуляторов и диуретиков (в том числе 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.

### **ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ**

Соблюдать осторожность при употреблении больших количеств кофеинсодержащих продуктов и напитков в период лечения.

### **ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ, МЕХАНИЗМАМИ**

В период лечения препаратом необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

### **ФОРМА ВЫПУСКА**

Таблетки 150 мг.

По 10, 15 или 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

### **УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ**

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **СРОК ГОДНОСТИ**

5 лет. Не использовать по истечении срока годности.

### **УСЛОВИЯ ОТПУСКА**

Отпускают по рецепту.

**Наименование и адрес производителя/организация, принимающая претензии**

ОАО «Фармстандарт-Лексредства», 305022, Россия, г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18,  
тел./факс: (4712) 34-03-13, [www.pharmstd.ru](http://www.pharmstd.ru)

Представитель

ОАО «Фармстандарт-Лексредства»