Теотард



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Теофиллин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы пролонгированного действия	**1 капс.**
теофиллин	200 мг

Вспомогательные вещества: дибутилфталат, кремния диоксид коллоидный безводный, метакрилата аммония сополимер тип B, метакрилата аммония сополимер тип A, повидон, тальк.

Состав оболочки капсулы: желатин, краситель индиго кармин (E132), титана диоксид (E171), краситель хинолиновый желтый (E104).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.

Капсулы пролонгированного действия	**1 капс.**
теофиллин	350 мг

Вспомогательные вещества: дибутилфталат, кремния диоксид коллоидный безводный, метакрилата аммония сополимер тип B, метакрилата аммония сополимер тип A, повидон, тальк.

Состав оболочки капсулы: желатин, краситель индиго кармин (E132), титана диоксид (E171), краситель хинолиновый желтый (E104).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Теотард представляет собой теофиллин (производное ксантина) в виде пеллет. Теофиллин относится к ингибиторам фосфодиэстеразы, увеличивает накопление в тканях ц-АМФ, блокирует аденозиновые (пуриновые) рецепторы; снижает поступление ионов кальция через каналы клеточных мембран, уменьшает сократительную активность гладкой мускулатуры. Расслабляет мускулатуру бронхов, кровеносных сосудов (главным образом сосудов мозга, кожи и почек); оказывает периферическое вазодилатирующее действие, увеличивает почечный кровоток, обладает умеренно выраженным диуретическим эффектом. Стабилизирует мембрану тучных клеток, тормозит высвобождение медиаторов аллергических реакций. Увеличивает мукоцилиарный клиренс, стимулирует сокращение диафрагмы, улучшает функцию дыхательных и межреберных мышц, стимулирует дыхательный центр. Нормализуя дыхательную функцию, способствует насыщению крови кислородом и снижению концентрации углекислоты; стимулирует центры дыхания. Усиливает вентиляцию легких в условиях гипокалиемии. Оказывает стимулирующее влияние на деятельность сердца, обладает положительным инотропным и хронотропным действием на сердце, повышает коронарный кровоток и потребность миокарда в кислороде. Снижает тонус кровеносных сосудов (главным образом сосудов мозга, кожи и почек). Уменьшает легочное сосудистое сопротивление, понижает давление в малом круге кровообращения. Увеличивает почечный кровоток, оказывает умеренный диуретический эффект. Расширяет внепеченочные желчные пути. Тормозит аурегацию тромбоцитов (подавляет фактор активации тромбоцитов и PgE2 альфа), повышает устойчивость эритроцитов к деформации (улучшает реологические свойства крови), уменьшает тромбообразование и нормализует микроциркуляцию.

Замененное высвобождение действующего вещества из капсул пролонгированного действия обеспечивает достижение терапевтического уровня теофиллина в крови через 3-5 чв после приема и его сохранение в течение 12 ч, так что эффективные концентрации теофиллина в крови в течение суток поддерживаются при приеме препарата 2 раза в день.

Бронхолитическое действие Теотарда развивается постепенно, поэтому препарат не назначается для купирования неотложных состояний.

Фармакокинетика

После перорального приема Теотард почти полностью всасывается, биодоступность - 88-100%. Замедленное высвобождение действующего вещества из капсул пролонгированного действия препарата Теотард обеспечивает поддержание равномерного уровня теофиллина в сыворотке крови в течение 12 ч.

После одноразового приема 350 мг препарата, в течение 7 ч достигается его C_{max} в плазме, которая составляет 4.4 мкг/мл. Терапевтическая концентрация достигается через несколько дней и она составляет 8-20 мкг/мл. Связывание с белками плазмы - около 60%. Проникает через плацентарный барьер, обнаруживается в грудном молоке. Метаболизируется в печени (90%) с участием нескольких ферментов цитохрома P450 (наиболее важный CYP1A2). Основные метаболиты: 1,3-диметилмочевая кислота и 3-метилксантин.

Выведение метаболитов почками вместе с 7-13% неизмененного активного вещества (у детей - 50%).

$T_{1/2}$ у некурящих пациентов составляет 7-9 ч. У курящих людей существенно короче - 4 - 5 ч. У больных циррозом печени, сердечной недостаточностью, почечной недостаточностью и у больных алкоголизмом $T_{1/2}$ удлиняется. Общий клиренс снижен у больных с высокой лихорадкой, выраженной дыхательной недостаточностью, у пациентов с печеночной недостаточностью или хронической сердечной недостаточностью (ХСН), при вирусных инфекциях, у больных старше 55 лет.

Показания к применению:

— бронхобструктивный синдром любого генеза: бронхиальная астма, хронический обструктивный бронхит и ХОБЛ;

— легочная гипертензия, "легочное" сердце;

— ночные расстройства дыхания центрального генеза (ночное апноэ).

Относится к болезням:

- Астма
- Бронхиальная астма
- Бронхит
- Гипертензия

Противопоказания:

— эпилепсия;

— острый инфаркт миокарда, тяжелая артериальная гипер- или гипотензия, тяжелые аритмии, геморрагический инсульт, кровоизлияние в сетчатку глаза;

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, гастрит с повышенной

кислотностью, кровотечение из ЖКТ;

— детский возраст до 6 лет (для капсул 200 мг), до 12 лет (для капсул 350 мг);

— повышенная чувствительность к теофиллину (в т.ч. к другим производным ксантина - кофеину, пентоксифиллину, теобромину);

С *осторожностью*: тяжелые нарушения функции печени и почек, выраженная коронарная недостаточность (нестабильная стенокардия), распространенный атеросклероз сосудов, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, частая желудочковая экстрасистолия, ХСН, повышенная судорожная готовность, порфирия, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе, кровотечение из ЖКТ в недавнем анамнезе, неконтролируемый гипотиреоз (возможность кумуляции) или тиреотоксикоз, длительная гипертермия, гастроэзофагеальный рефлюкс, гипертрофия предстательной железы, беременность и период лактации, пожилой возраст (старше 60 лет), детский возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, после еды, запивая достаточным количеством жидкости. Капсулы пролонгированного действия нельзя открывать или разжевывать.

Дозировка препарата индивидуальна. Недопустимо превышать суточную дозу 15 мг/кг у **взрослых** в 2 приема с интервалом 12 ч, 20 мг/кг - у **детей**. Для подбора дозы препарата необходимо определять концентрацию теофиллина в сыворотке крови. Как правило, концентрация теофиллина в сыворотке крови от 10 до 15 мкг/мл обеспечивает терапевтическое действие при минимальном риске развития побочных эффектов. Если концентрация превышает 20 мкг/мл, то дозу препарата следует уменьшить. Рекомендуется проводить контроль через каждые 6-12 месяцев.

В течение первых трех дней следует принимать по одной капсуле (200-350 мг) препарата каждые 12 ч. На третий день следует оценить эффективность терапии и переносимость препарата. При недостаточной эффективности доза может быть увеличена (на 200-350 мг/сут) до получения максимального терапевтического эффекта. В случае нежелательных побочных явлений: дозу следует уменьшить. Доза зависит от характера заболевания, возраста и массы тела больного.

Утренняя и вечерняя дозы препарата могут быть различными в зависимости от времени возникновения приступов затрудненного дыхания, от клинической картины заболевания и эффективности терапии.

Теотард 200 мг назначается **детям, масса тела которых превышает 20 кг, а также и взрослым с низкой массой тела**.

Теотард 350 мг назначается **взрослым и детям, масса тела которых превышает 40 кг**. Обычная поддерживающая доза для **взрослых с массой тела выше 60 кг** - 350 мг Теотарда 2 раза/сут.

Для **некурящих взрослых с массой тела более 60 кг** начальная доза - 350 мг/сут в 1 прием вечером. Затем дозу в последующем увеличивают на 350 мг до поддерживающей (в среднем -700 мг/сут в 1 прием вечером).

Для **курящих пациентов и лиц с повышенным метаболизмом препарата** начальная доза - 350 мг, а поддерживающая может быть увеличена до 1.15 г/сут (2 таб. - вечером, 1 таб. - утром).

У **лиц с пониженным клиренсом препарата** начальная доза - 200 мг/сут, которую затем увеличивают по 200 мг через 2 дня до поддерживающей - 400 мг/сут в 1 прием вечером, а у **лиц с массой тела менее 60 кг** - 200 мг/сут.

Детям 6-12 лет назначают капсулы по 200 мг. Суточная доза для **детей 6-8 лет (при массе тела 20-30 кг) -** 400 мг, кратность назначения - 2 раза/сут; для **детей 8-12 лет (при массе тела 30-40 кг)** - 600 мг, кратность назначения - 3 раза/сут.

Детям в возрасте 12-16 лет (при массе тела 40-60 кг) назначают капсулы 350 мг. Суточная доза - 0.7-1.4 г, кратность - 2-3 раза/сут.

Действие препарата проявляется в полной мере через 3-4 дня после назначения лечения.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, тошнота, рвота, диарея, гастроэзофагеальный рефлюкс, изжога, обострение язвенной болезни, при длительном приме-снижение аппетита.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, возбуждение, тревожность, тремор, раздражительность, вертиго, бессонница.

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

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, лихорадка.

Лабораторные показатели: гипокалиемия и/или гиперкальциемия, гипергликемия и гиперурикемия, альбуминурия, гематурия.

Прочие: боль в груди, тахипноэ, ощущение «приливов» к коже лица, усиление диуреза, повышенное потоотделение.

Частота возникновения побочных явлений увеличивается, если концентрация препарата в сыворотке крови превышает 20 мкг/мл. Побочные эффекты снижаются при снижении дозы препарата.

Передозировка:

Симптомы: снижение аппетита, боли в области желудка, 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 развиться эпилептоидные припадки (особенно у детей без возникновения каких-либо предвестников), гипоксия, метаболический ацидоз, гипергликемия, гипокалиемия, снижение АД, некроз скелетных мышц, спутанность сознания, почечная недостаточность, с миоглобинурией.

Лечение: отмена препарата, промывание желудка, назначение активированного угля, слабительных лекарственных средств, промывание кишечника комбинацией полиэтиленгликоля и электролитов, форсированный диурез, гемосорбция, плазмосорбция, гемодиализ (эффективность невысока, перитонеальный диализ неэффективен), симптоматическая терапия (в т.ч. метоклопрамид, и ондансетрон - при рвоте). При возникновении судорог поддерживать проходимость дыхательных путей и проводить оксигенотерапию. Для купирования припадка - в/в диазепам, 0.1-0.3 мг/кг (но не более 10 мг). При сильной тошноте и рвоте - метоклопрамид или ондансетрон (в/в).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Теофиллин проникает через плацентарный барьер и экскретируется в грудное молоко, поэтому беременным женщинам возможно применять только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. По возможности рекомендуется более частое мониторирование (контроль) сывороточной концентрации теофиллина и коррекция дозы. В III триместре беременности не рекомендуется назначение теофиллина, т. к. может снижать сократимость матки.

Кормящим матерям рекомендуется более тщательное наблюдение за новорожденными. При появлении раздражительности и нарушении сна у новорожденного, необходимо обратиться к врачу.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Теофиллин не применяют совместно с другими производными ксантина.

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

Противодиарейные препараты и энтеросорбенты снижают всасывание теофиллина.

При одновременном применении с антибиотиками группы макролидов, линкомицином, аллопуринолом, циметидином, фторхинолонами (рекомендовано снизить дозы теофиллина на 60%), дисульфирамом, фенилбутазоном, флувоксамином, имипенемом, парацетамолом, пробенецидом, ранитидином, такрином, тиабендазолом, рекомбинантным интерфероном альфа, метотрексатом, мексилетином, нропафеноном, тиабендазолом, тиклопидином, верапамилом, изопреналином, пероральными эстрогенсодержащими контрацептивами, фенобарбиталом, пентобарбиталом, магния гидроксидом, морацизином, ритонавиром или сульфинпиразоном, рифампицином, изониазидом, карбамазепином, примидоном, сульфинпиразоном, аминоглутетимидом, фенитоином, эноксацином (рекомендовано снизить дозы теофиллина на 30%), вилоксазином и при вакцинации против гриппа интенсивность действия может увеличиваться, что может потребовать снижения дозы теофиллина.

Препарат подавляет терапевтические эффекты карбоната лития, аденозина и бета-адреноблокаторов.

Теофиллин потенцирует действие бета-адреностимуляторов, резерпина и мочегонных средств за счет увеличения клубочковой фильтрации и уменьшения канальцевой реабсорбции.

Совместим со спазмолитиками.

На фоне совместного приема с блокаторами альфа-адренорецепторов, тиазидовыми диуретиками, фуросемидом увеличивается риск развития гипокалиемия.

Особые указания и меры предосторожности:

Лицам, у которых теофиллин подвергается быстрому метаболизму (лица молодого возраста, курильщики), одноразовый прием препарата в день будет недостаточным.

Уменьшение суточной дозы требуется у больных с сердечной недостаточностью, печеночной недостаточностью (особенно цирроз печени), высокой лихорадкой, пневмонией, с вирусными инфекциями (особенно с гриппом), с гиперфункцией щитовидной железы, на фоне приема некоторых препаратов, у больных пожилого возраста.

Во время терапии Теотардом не рекомендуется принимать алкоголь или большое количество напитков или продуктов, содержащих метилксантины (кофе, чай, какао, шоколад, кока-кола и подобные ей напитки, тонизирующие напитки), т.к. потенцируется стимулирующий эффект теофиллина на центральную нервную систему.

При приеме теофиллина возможно изменение некоторых результатов лабораторных анализов: повышение содержания жирных кислот и уровня катехоламинов в моче.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

О неблагоприятном влиянии Теотарда на способность управлять автомобилем и другими механизмами не сообщалось.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью*: тяжелые нарушения функции почек.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью*: тяжелые нарушения функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью назначают препарат пациентам пожилого возраста (60 лет).

Применение в детском возрасте

Противопоказан:

— детский возраст до 6 лет (для капсул 200 мг), до 12 лет (для капсул 350 мг).

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Teotard