

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

THEORPLUS 100

ТЕОПЛУС 100

### 2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 таблетка с удължено освобождаване съдържа

Theophylline monohydrate изразен в

Theophylline anhydrate.....100,00 mg

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки с удължено освобождаване

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1 Показания

Бронходилататор за лечение или профилактика на:

- Бронхиална астма с пароксизмална диспнея;
- Хронична обструктивна белодробна болест.

#### 4.2 Дозировка и начин на приложение

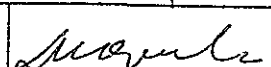
Дозировката се адаптира към индивидуалната чувствителност според ефикасността и нежеланите ефекти.

#### (1) При деца:

- При деца над 3 годишна възраст се препоръчва средната дозировка 10-16 mg/kg/ден, разпределена на два приема: сутрин и вечер.

Това съответства, като насока, на следните количества:

| Телесно тегло | Брой таблетки<br>дозирани<br>100 mg/24 часа | Телесно тегло | Брой таблетки<br>дозирани<br>100 mg/24 часа |
|---------------|---------------------------------------------|---------------|---------------------------------------------|
| <9 kg         | 1                                           | 29 до 33 kg   | 5                                           |
| 9 до 13 kg    | 2                                           | 33 до 37 kg   | 5,5                                         |
| 13 до 17 kg   | 2,5                                         | 37 до 41 kg   | 6                                           |
| 17 до 21 kg   | 3                                           | 41 до 45 kg   | 7                                           |
| 21 до 25 kg   | 3,5                                         | 45 до 49 kg   | 7,5                                         |
| 25 до 29 kg   | 4,5                                         |               |                                             |

|                                                                |                                                                                      |
|----------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|
| МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО                               |                                                                                      |
| Приложение към<br>разрешение за употреба № 11-9621 / 20.08.04, |                                                                                      |
| 660 / 13.07.04                                                 |  |



- Дозировката от 100 mg е специално адаптирана за приложение при деца, но при дневна доза над 300 mg/kg/ден, могат да бъдат използвани таблетките от 300 mg.
- Прогресивно адаптиране на дозировката от 50 на 100 mg се осъществява в зависимост от поносимостта и наблюдавания терапевтичен резултат (чрез изследване на теофилинемията).
- При евентуална необходимост от по-висока доза, да не се надхвърля 20 mg/kg/ден. В такъв случай, е необходим контрол на теофилинемията.

(2) *При пациенти на диализа:*

- Теофилин се диализира. Може да се наложи промяна в дозировката поради повишеното елиминиране при диализа.
- Хемодиализата значително намалява полуживота на теофилин при пациенти, които приемат теофилин перорално през 6 часа. Препоръчва се приложението на 150% от обикновената доза веднъж, преди всяка хемодиализа. Между отделни диализи, терапията се провежда по обичайната схема. При пациенти, получаващи теофилин с удължено освобождаване (на 12 часа), преди диализата трябва да се приложи 125% от обичайната доза.

#### 4.3 Противопоказания

- Деца под 3 години;
- Непоносимост към теофилин;
- Поради риск от лекарствени взаимодействия не се препоръчва комбинирането на Theoplus 100 с Enoxacin, Erythromycin, Viloxazine, Troleandomycin, Cimetidine, ензимни индуктори (Phenobarbital, Carbamazepine, Phenytoine, Rifampicine).

#### 4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

##### Предупреждения

- Да се използва с голяма предпазливост при малки деца, които са изключително чувствителни към действието на ксантините;
- Поради големите вариации в метаболизма на теофилин при отделни индивиди, е необходимо дозите да се адаптират в зависимост от нежеланите реакции и (или) от кръвните концентрации (вижте дозировка и начин на приложение).
- Предозиране може да се получи от неправилна дозировка, от повтарящи се приеми на твърде кратки интервали или от потенцирането от други лекарства (вижте лекарствени взаимодействия).

##### Предпазни мерки при употреба

Да се използва внимателно в случаи на:

- Сърдечна недостатъчност (при нужда да се намалят дозите);
- Коронарна недостатъчност;



- Затлъстяване (дозировката да се адаптира според идеалното тегло);
- Хипертиреоидизъм;
- Чернодробна недостатъчност (при нужда да се намалят дозите);
- Анамнеза за кома;
- Гастродуоденална язва.

Експериментални данни при животни са доказали, че теофилин има стимулиращ ефект върху стомашната секреция, следователно приложението му при пациенти с активна гастродуоденална язва трябва да бъде с повишено внимание.

#### 4.5 Лекарствени и други взаимодействия

##### Противопоказани комбинации

- Enoxacin – предозиране на теофилин поради значителното намаляване на неговия метаболизъм.

##### Да се избягват следните комбинации

- Erythromycin, Troleandomycin – може да повиши кръвните концентрации на теофилин;
- Viloxazine – увеличаване на теофилин с риск от предозиране.

##### Комбинации, изискващи предпазни мерки

- Cimetidine – може да се увеличи кръвната концентрация на теофилин; в случай на едновременно приложение, да се намали дозировката на теофилин;
- Ензимни индуктори (Phenobarbital, Carbamazepine, Phenythoine, Rifampicine) – те могат да намалят плазмената концентрация и активността на теофилин.

#### 4.6 Бременност и кърмене

В случай на приложение при бременни в края на бременността, при новороденото има вероятност да се наблюдава тахикардия и/или превъзбуда.

Преди приложението на Theoplus при бременни е уместно да се вземе под внимание съотношението полза/риск.

Въпреки че много малки количества теофилин се отделят в майчината кърма, се препоръчва също така да се вземе под внимание съотношението полза/риск преди приложението на Theoplus при кърмещи.

#### 4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

Различни при отделните пациенти, предимно:

- Гадене, повръщане, епигастрални болки;



- Главоболие, превъзбуденост, безсъние;
- Тахикардия.

Тези ефекти могат да бъдат първите симптоми на предозиране.

Появата на конвулсии е признак на сигурна интоксикация, особено при деца.

#### 4.9 Предозиране

*Симптоми:*

- При деца: неспокойствие, логорея, неадекватност, повтарящи се повръщания, хипертермия, тахикардия, камерно трептене, гърчове, хипотензия, дихателни нарушения, хипервентилация, последвана от подтискане на дишането, рядко улцерации на храносмилателния тракт с хеморагии;
- При възрастни: гърчове, хипертермия и спиране на сърдечната дейност.

*Лечение:* стомашна промивка, реанимация в специализирано отделение.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

Фармакотерапевтична група

АТС клас: R03DA

#### 5.1 Фармакодинамични свойства

*Антиастматичен, бронходилататор:*

- Бронходилататор, оказва ефекта си чрез релаксация на бронхиалните гладки мускули,
- Ин витро: инхибира дегранулация на мастоцитите.

*Освен това действа като:*

- Централен стимулатор: дихателен аналептик, психостимулант, при високи дози води до конвулсии;
- Стимулира сърдечната дейност: предизвиква коронародилатация, увеличава кислородните нужди на миокарда;
- Оказва релаксиращ ефект върху гладките мускули;
- Има диуретично действие.

#### 5.2 Фармакокинетични свойства

- Много добра абсорбция след перорално приложение;
- Хепатален метаболизъм (90% от приложената доза);
- При деца, метаболизмът на теофилин е по-бърз отколкото при възрастните. По отношение на скоростта на метаболизма има значителни вариации между отделните индивиди;
- Плазмен полуживот от 6 до 8 часа при възрастни, понижен при деца и пушачи, повишен при различни патологични състояния;



- Ефикасни плазмени концентрации: 10 до 15  $\mu\text{g/ml}$  (да не се превишава 20  $\mu\text{g/ml}$ ). Елиминирането става главно по бъбречен път;
- Theoplus се характеризира с оригинална патентована галенична форма: хидрофилна полимерна матрица, която осигурява равномерно освобождаване на активното вещество в продължение на 12 часа (кинетика от нулев ред);
- Освобождаването на теофилин от хидрофилната матрица на Theoplus е изцяло независимо от промените на рН в гастроинтестиналния тракт и не се влияе от приетата храна;
- Това равномерно освобождаване, прибавено към тотална бионаличност, позволява на Theoplus да осигури оптимална стабилност на кръвните концентрации 24 часа само чрез два приема на ден;
- Терапевтичните концентрации на равновесие се постигат бързо, обикновено още на втория ден;
- Таблетките на Theoplus са делими, което позволява опростена адаптация на дозировката чрез половин таблетка, избягвайки всякакъв риск от грешка, свързан с многократни приеми на медикамента.

### 5.3 Данни за предклинична безопасност

Литературните данни показват много добра толерантност спрямо теофилин. Проучванията за хронична токсичност, проведени предимно при кучета и плъхове, не показаха токсични ефекти на продукта. Проучванията за мутагенност и за потенциална канцерогенност се оказаха отрицателни.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1 Списък на помощните вещества и техните количества

|                                                                 |         |
|-----------------------------------------------------------------|---------|
| High viscosity hydroxypropylmethyl cellulose (15.000 Pa.s)..... | 40,0 mg |
| Lactose.....                                                    | 20,0 mg |
| Magnesium stearate.....                                         | 1,7 mg  |
| Colloidal silica.....                                           | 0,8 mg  |

### 6.2 Физико-химични несъвместимости

Няма известна несъвместимост

### 6.3 Срок на годност

5 години

### 6.4 Специални условия за съхранение

Да се съхранява при температура под 25 °C.



#### 6.5 Данни за опаковката

Първична опаковка: блистер съставен от алуминиев лист и от термообработваема лента в PVC;

Вторична опаковка: картонена кутия;

Количество в една опаковка: 30 таблетки с удължено освобождаване в 3 блистера.

#### 6.6 Препоръки при употреба

Да не се дъвче при приемане

#### 7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО НА УПОТРЕБА

PIERRE FABRE MEDICAMENT  
45, Place Abel Gance  
92654 Boulogne

#### 8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ЗЛАХМ

Регистриран с протокол N° 512 от 02.10.1992

#### 9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

N° NL 13587 от 26.03.1984 във Франция

#### 10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Август 1999

