

ЭУФИЛЛИН раствор для инъекций 2,4% 5мл N10

Kategoriya

Nafas olish tizimi

Ishlab chiqarilish joyi:

- O'zbekiston

Farmakoterapevtik guruh:

- Бронхолитическое средство

Faol modda:

- Аминофиллин

Qadoqda soni:

- 10

Ishlab chiqaruvchi:

- Jurabek Laboratories OT MChJ

ATX kodi:

- R03DA05



Mahsulot haqida tafsilotlar

1. Tarkibi va ishlab chiqarilish shakli

Дори шакли: вена ичига юбориш учун эритма

Таркиби

фаол модда: аминофиллин – 24 мг;

ёрдамчи модда: инъекция учун сув – 1 мл.

2. Dori shakli

10 мл ли ампулаларда.

3. Farmakodinamikasi

Фармакодинамикаси

Фармакологик таъсири – бронхлитик, спазмолитик, токолитик ва ўртача диуретик.

Эуфиллин аралашма бўлиб, 80% теофиллиндан(1,3-диметилксантин) ва 20% этилендиаминдан (1,2-этилендиамин) иборат. Этилендиамин спазмолитик (спазмларни йўқ қилувчи) фаолликни кучайтиради ва дори воситасининг эришига ёрдам беради. Препаратнинг таъсири биринчи навбатда унинг таркибида теофиллин мавжудлиги билан боғлиқ.

Теофиллин яққол бронхларни кенгайтирувчи таъсир кўрсатади. Теофиллиннинг таъсир механизми теофиллинни аденозин рецепторларини блоклаш, фосфодиэстераза ферментини носелектив ингибиция қилиши ва шу билан бирга тўқималарда циклик 3', 5'-АМФ (цАМФ) концентрациясини орттириш, хужайра мембраналарининг “секин” каналлари орқали кальций ионларини транспортини камайтириш ва уни хужайраичи захирасидан чиқишини камайтириши билан боғлиқ.

Бронх мушакларини бўшаштиради, нафас марказини рағбатлантиради ва альвеоляр вентиляцияни яхшилади, қонни кислород билан тўйинишида ва углерод оксиди концентрациясини камийтиришда иштирок этасди, бу натижада апноэ эпизодларини тез-тезлиги ва оғирлигини камайишига олиб келади. Гипогликемия шароитида ўпка вентиляциясини кучайтиради.

Теофиллин силлиқ мушакларда ПГ таъсирини камайтиради, семиз хужайралардан гистамин ва лейкотриен ажралишини камайтиради, мукоцилиар клиренсни оширади, диафрагма қисқаришини рағбатлантиради ва нафас ва қовурғалараро мушаклар функциясини яхшилади.

Юрак фаолиятига рағбатлантирувчи таъсир кўрсатади, юрак қисқаришлар сонини тез-тезлиги ва кучини оширади, коронар оқим ва миокардни кислородга бўлган эҳтиёжини оширади. қон -томирлар тонусини пасайтиради (асосан бош мия, тери ва буйраклар томири). Периферик томир кенгайтирувчи таъсир кўрсатади, ўпка қон томир қаршилигини пасайтиради, “кичик” қон айланиш доирасида босимни пасайтиради. Буйракда қон оқимини оширади, буйрак усти безида адреналин ажралишини кучайтиради. Ўртача диуретик таъсир кўрсатади. Жигардан ташқари ўт йўллари кенгайтиради. Тромбоцитлар агрегациясини тормозлайди (тромбоцитлар ва Е2 альфа простагландин фаоллигини секинлаштиради), эритроцитларни деформацияга чидамлилигини оширади (қоннинг реологик хусусиятларини яхшилади), тромб хосил бўлишини камайтиради ва микроциркуляцияни нормаллаштиради. Токолитик таъсирга эга, меъда шираси кислоталигини оширади. Юқори дозаларда қўлланганда эпилептоген таъсирга эга.

4. **Farmakokinetikasi**

Препаратнинг биокиришаолишлиги - 90-100%.

Вена ичига юборилганда энг юқори концентрацияга (7мкг/мл) 15 мин кейин эришилади.

Тақсимланиш ҳажми 300-700 мл/кг(“идеал” тана вазнидан 30-70 %) диапазонда бўлади, ўртача 450 мл/кг.

Катталарда плазма оқсиллари билан боғланиши - 60%, янги туғилган чақалоқларда- 36%, жигар циррози бўлган пациентларда -36%. Она сутига

(қабул қилинган дозадан 10%) йўлдош тўсиғи орқали ўтади (ҳомиланинг қон зардобидаги концентрацияси онанинг қон зардобидаги концентрациясига нисбатан бир мунча юқори).

Бронхларни кенгайтириш хусусияти 10-20 мкг/мл концентрацияларида намоён бўлади. 20 мг/мл дан юқори концентрацияси токсик ҳисобланади. Нафас олиш марказига қўзғатувчи таъсири қонда препаратнинг миқдори 5-10 мкг/мл бўлганида амалга оширилади.

Эркин теофиллин ажратилгани ҳолда рН нинг физиологик қийматларида метаболизмга учрайди, у кейинчалик жигарда Р 450 цитохромнинг бир неча ферментлари иштирокида метаболизмга учрайди. Натижада 1,3-диметилсиддик кислотаси (45-55 %) ҳосил бўлади, у фармакологик фаолликка эга, аммо теофиллинга нисбатан 1-5 марта кам бўлади. Кофеин фаол метаболит бўлиб ҳисобланади ва кичикроқ миқдорларда ҳосил бўлиб, кофеинни ярим чиқарилиш даврининг тўсатдан узоқ бўлиши натижасида унинг организмда тўпланиши кузатишга чала янги туғилган чақалоқлар ва 6 ойдан кичик болалар бундан мустасно.

3 ёшдан катта болаларда ва катталарда кофеиннинг тўпланиш феномени мавжуд эмас. Ярим чиқарилиши даври 6 ойликгача бўлган болалар ва янги туғилган чақалоқларда – 24 соатдан кўп; 6 ойдан катта болаларда – 3,7 соат; катталарда – 8,7 соат; чекувчиларда (суткада 20-40 та сигарета) – 4-5 соат (чекиш ташланганидан кейин фармакокинетика 3-4 ойдан кейин нормага келади); ўпканинг сурункали обструктив касаллиги (ЎСОК), ўпка-юрак етишмовчилиги бўлган катталарда – 24 соат юқорини ташкил этади.

Буйраклар орқали чиқарилади. Янги туғилган чақалоқларда теофиллиннинг 50% сийдик билан ўзгармаган ҳолда катталарда 10% қарши чиқарилади, бу жигар ферментларининг етарлича фаол бўлмагани билан боғлиқ.

5. **Nojo'ya samaralari**

Марказий ва периферик нерв тизими томонидан: қўзғалиш, хавотирлик, уйқуни бузилиши, уйқусизлик (айниқса болаларда), бош оғриғи, бош айланиши, тремор, қўзғалувчанлик, тиришишлар, галлюцинациялар, сафсата, тутқаноқ шаклли хуружлар, онгни чалкашлиги/йўқотиш.

Юрак қон-томир тизими томонидан: юрак уриб кетиши, кардиалгия, тахикардия, экстрасистолия, артериал босимни пасайиши, юрак етишмовчилиги, стенокардия хуружлари тез-тезлигини ошиши, коллапс (тез юборганда), шок.

Сийдик ажратиш тизими томонидан: диурезни ортиши (калавали фильтрациясини ошиши натижасида), кекса ёшдаги пациентларда-сийдик ажратишни қийинлашуви(детрузорни релаксацияси натижасида)

Иммун тизими томонидан: тошмалар, қичишиш, Квинке шиши, эксфолиатив дерматит, анафлакттик шок, бронхоспазм каби аллергия реакциялар.

Меъда-ичак йўли томонидан: меъда шираси секрециясини рағбатлантириш, меъдада оғриқ, кўнгил айнаши, қусиш, узоқ қўлланганда- диарея, ичак атонияси.

Метаболизм бузилишлар: метаболик ацидоз, гипокалиемия, гиперурикемия, гипергликемия, қонда кислота-ишқор мувозанатини бузилиши,

рабдомиолиз.

Бошқалар: кўкракда оғриқ, тахипное, субфебрил харорат, юз қизариши, қизиш хисси, кўп терлаш, гипогликемия, холсизлик, хансираш, альбуминурия.

Маҳаллий реакциялар: юборилган жойдаги реакциялар(зичлашиш, қизариш, оғриқ)

Ножўя таъсирлар препарат дозасини камайтирганда, юбориш йўлини алмаштирганда (оқимдан томчилабга) камаяди.

6. **Sotish shartlari**

Шифокор рецепти буйича.

7. **Maxsus shartlar**

Парентерал юборишдан олдин, эритма тана хароратигача қиздирилиши керак.

Препаратни юборишда пациент ётган ҳолатда бўлиши керак, шифокор қон босими, юрак қисқаришлар сонини, нафас олиш тез-тезлиги ва пациентнинг умумий ҳолатини назорат қилиш керак.

Эритмани фойдаланишдан олдин дарҳол тайёрланади: бевосита юбориш учун препаратнинг бир марталик дозасини 10-20 мл 0.9% натрий хлориди эритмасида суюлтирилади, вена ичига томчилатиб юбориш учун препаратнинг бир марталик дозасини 100-150 мл 0.9% натрий хлорид эритмасида олдиндан суюлтирилади.

Препарат дозасини турли юбориш тезлигини эҳтимолини ҳисобга олиб, алоҳида-алоҳида танланади.

Кекса пациентларга организмдан секин чиқарилиши туфайли препаратнинг дозасини камайтириш тавсия этилади.

Агар пациент теофиллинни ичга қабул қилса, эуфиллиннинг вена ичига юбориш учун дозасини камайтириш лозим.

Даволаш вақтида кафеин тутувчи озиқ-овқат ёки ичимликларни катта миқдорда истеъмол қилишда эҳтиёт бўлиш лозим.

- Теофиллин баъзи лаборатория кўрсаткичларини ўзгартириш мумкин: сийдик ёғ кислоталари ва катехоламин даражасини миқдорини ошириш.

- Чекиш ва спиртли ичимликларни истеъмол қилиш теофиллиннинг клиренсини ошишига ва шунга мос равишда терапевтик таъсирини камайишига ва юқори дозаларни қўллашга бўлган эҳтиёжга олиб келиши мумкин.

- Иситма, келиб чиқишидан қатъи назар, теофиллин чиқарилиш тезлигини камайтириши мумкин.

- Анамнезида тиришиш холлари бўлган пациентларда теофиллиндан фойдаланишдан қочиш ва муқобил даволанишга мурожаат қилиш керак.

8. Qo'llanilishi

Ҳар қандай генездаги бронхообструктив синдром:

Бронхиал астма(жисмоний зўриқишдаги бронхиал астма бўлган пациентларда танлов препарати ва бошқа шакилларда қўшимча восита сифатида)

Астматик статус(қўшимча даволаш сифатида)

Ўпканинг сурункали обструктив синдроми(ЎСОС)

Ўпка эмфиземаси

Сурункали обструктив бронхит.

Кичик қон айланиш доираси гипертензияси, тунги апноэ;

Ишемик типдаги бош мия қон айланишини бузилиши(мия ичи босимини камайтириш учун мажмуавий даволаш таркибида).

Чап қоринчали юрак етишмовчилиги (мажмуавий даволаш таркибида).

Янги туғилган чақалоқлардаги апное (15 секунд давомида нафаснинг бўлмаслиги даврлари ва цианоз ва брадикардия билан кечувчи характерланувчи ҳолатлар)

Чейн-Стокс нафасида қўлланилади.

9. Qo'llanilishi mumkin bo'lmagan holatlar

Препарат компонентларига, шунингдек, ксантиннинг бошқа ҳосилаларига(кофеин, пентоксифиллин, теобромин) юқори сезувчанлик;

Ўткир юрак етишмовчилиги, стенокардия, ўткир миокард инфаркти, декомпенсацияланган сурункали юрак етишмовчилиги, пароксизмал тахикардия, экстрасистолия, оғир артериал гипертензия ва гипотензия, ўпка шиши, гипертрофик обструктив кардиомиопатия.

Геморрагик инсульт, кўз тўр пардасига қон оқиши, глаукома, анамнезда қон кетиши;

Меъда ва ўн икки бармоқ ичак яра касаллиги (хуруж даврида);

Тутқаноқ, юқори тиришишга тайёргарлик

Гипертиреоз, тиреотоксикоз;

Оғир жигар ва/ёки буйрак етишмовчилиги

Порфирия;

6 ойлик ёшгача бўлган болалар

Эфедрин билан бир вақтда болаларда қўллаш мумкин эмас.

Эҳтиёткорлик билан:

Сепсис;

Узоқ давом этувчи гипертермия;

Меъда ва ўн икки бармоқ ичак яра касаллиги (анамнезда);

Кекса ёш (55 ёшдан катта)

14 шгача бўлган болалар (мумкин бўлган ножўя таъсирлар туфайли)

Назорат қилиб бўлмайдиган гипотиреоз(тўпланиши мумкин)

Қон томирларнинг тарқоқ атеросклерози;

Простата беши гиперплазияси;

Оғир гипоксия;

Қандли диабет;

Уйқусизлик билан азият чеккан пациентлар;

Буйраклар функцияси бузилиши.

10. **Dori vositalarining o'zaro ta'siri**

Кислота эритмалари билан фармацевтика мос келмайди.

Эуфиллин 0,9% ли натрий хлориди эритмасидан ташқари бошқа инъекцион препаратлар билан бир шприцда номутаносиб.

Эуфиллинни глюкоза, фруктоза (левулоза) эритмалари билан ишлатиб бўлмайди.

Эуфиллин глюкокортикостероидлар, минералокортикостероидлар (гипернатриемия), умумий анестезия учун воситалар (қоринча аритмияси хавфини оширади), марказий нерв тизимини қўзғатувчи воситалар (нейротоксикликни оширади).

Диареяга қарши препаратлар ва перорал эстроген тутувчи контрацептивлари эуфиллиннинг таъсирини пасайтиради (цитохром P450 ферментатив тизимига боғланади ва аминифиллиннинг метаболизмини ўзгартиради).

Рифампицин, фенобарбитал, фенитоин, изониазид, карбамазепин ва морацизин микросомал оксидланиш индукторлари сифатида эуфиллиннинг клиренсини оширади, бу унинг дозасини оширишни талаб қилиши мумкин.

Макролид гурухи антибиотиклари, линкомицин, аллопуринол, циметидин, изопреналин, кичик дозадаги этанол, дисульфирам, фторхинолонлар, алфа интерферони рекомбинанти, метотрексат, мексилетин, пропафенон, тиабендазол, тиклопидин, верапамил ва грипга қарши эмланишда эуфиллиннинг таъсир қилиш интенсивлиги ошиши мумкин, бу унинг дозасини камайтиришни талаб қилиши мумкин.

Бета-адреномиметиклар ва диуретиклар таъсирини кучайтиради (шу жумладан калавали филтрациясини ошириш орқали).

Литий препаратлари ва бета-адреноблокаторларининг самарадорлигини пасайтиради.

Спазмолитиклар билан мутаносиб.

Бошқа ксантин ҳосилалари билан биргаликда фойдаланилмайди.

Антикоагулянтлар билан бир вақтда эҳтиёткорлик билан тавсия этилади.

11. **Maxsus saqlash sharoitlari**

Куруқ ва ёруғликдан химояланган, 25°C дан юқори бўлмаган ҳароратда.

Болалар ололмайдиган жойда сақлансин.

Яроқлилик муддати

3 йил. Ўрамида кўрсатилган яроқлилик муддати тугаганидан кейин қўлланилмасин.

12. **Dozirovkasi**

Юбориш усули: вена ичига (оқим билан ёки томчилаб)

Катталар. Препарат секин-аста (4-6 минут давомиди) 5-10 мл (0,12-0,24 г) дан юборилиши керак бўлиб, у дастлаб 10-20 мл 0,9% ли натрий хлорид эритмасида суюлтирилади.

Юрак уруши, бош айланиши, кўнгил айнаш хислари пайдо бўлганда юбориш тезлигини секинлаштирилади ёки точилаб юборишга ўтилади, бунинг учун 10-20 мл препаратни (0,24-0,48 г) 100-150 мл 0,9 % ли натрий хлорид эритмасида суюлтирилади, минутига 30-50 томчи тезлик билан юборилади.

Эуфиллин парентерал ҳолда суткада 3 мартагача, кўпи билан 14 кун юборилади. Эуфиллиннинг юқори дозалари катталар учун вена ичига юборилганида: бир марталик дозаси – 0,25 г ни, суткалик дозаси – 0,5 г ни ташкил этади.

Болалар: керак бўлганда эуфиллинни 2-3 мг/кг бир марталик дозага қайта ҳисоблаганда вена ичига томчилаб юборилади.

Даволаш вақтида препаратнинг токсиклиги юзасидан пациентлар кузатув остида бўлишлари керак ва имкон бўлганида плазмада теофиллин миқдорини ҳам назорат қилиш лозим, дозалар идеал тана вазни асосида ҳисобланиши керак, препарат эрта ёшдаги болаларда теофиллин метаболизмида сезиларли ўзгаришлар туфайли 6 ойликгача ёшдаги болалар учун тавсия этилмайди.

Теофиллин препаратларини қабул қилмаган пациентлар:

А. Эуфиллиннинг юклама дозаси тана массасининг 6 мг/кг га вена ичига секинлик билан минутига 25 мг ошмайдиган тезликда юборилиши мумкин.

Б. Пациентнинг ҳолатига боғлиқ равишда кейинги 12 соат давомида самарани бир маромда ушлаб турувчи дозани қуйидаги тарзда ҳисоблаш мумкин:

- 6 ойликдан 9 ёшгача бўлган болаларда: 1,2 мг/кг/соат (12 соатдан кейин 1 мг/кг/соатгача пасайтирилиш);

- 9 ёшдан 16 ёшгача бўлган болаларда ва ёш чекувчиларда: 1 мг/кг/соат (12 соатдан кейин 0,8 мг/кг/соатгача пасайтирилиш);

- чекмайдиган соғлом катталарда: 0,7 мг/кг/соат (12 соатдан кейин 0,5 мг/кг/соатгача пасайтирилиш);

- кекса ёшдаги пациентларда ва ўпка юраги касаллиги бўлган шахсларда: 0,6 мг/кг/соат (12 соатдан кейин 0,3 мг/кг/соатгача пасайтирилиш);

- димланган юрак етишмовчилиги ёки жигар касаллиги бўлган пациентларда: 0,5 мг/кг/соат (12 соатдан кейин 0,1-0,2 мг/кг/соатгача пасайтирилиш);

Теofilлинни олаётган пациентлар:

Юклама дозаси юклама доза сифатида юборилган теofilлиннинг ҳар 0,5 мг/кг, зардобда теofilлин концентрациясининг 1 мкг/мл ўсишига олиб келиши мумкинлигига асосланган ҳолда ҳисоблаб топилиши мумкин.

Препаратни юборилиши идеал ҳолатда қон зардобда теofilлин концентрацияси аниқланишига қадар кечиктирилиши мумкин. Агар бу мумкин бўлмаса ва агар клиник вазият препарат юборилишини талаб қилса, юклама дозаси сифатида юборилганида зардобда теofilлиннинг концентрацияси тахминан 5 мкг/мл га ошишига олиб келишига асосланган ҳолда эуфиллин 3,1 мг/кг (2,5 мг/кг сувсиз теofilлиннинг эквиваленти) дозада юборилади.

Кейинчалик самарани бир маромда ушлаб турувчи дозага ўтилади.

13. **Dozani oshirib yuborilishi**

Теofilлиннинг қон плазмасидаги концентрацияси 20 мг/кг (110 мкмоль/л) дан юқори бўлганда қуйидаги белгилар пайдо бўлиши мумкин:

Симптомлар: иштаҳанинг пасайиши, гастралгия, диарея, кўнгил айнаши, қусиш (қон, шу жумладан), ошқозон-ичакдан қон кетиши, тахипноэ, юз териси қизариши, гипервентиляция, тахикардия, суправентрикуляр ва қоринча аритмияси, артериал гипотензия ёки артериал гипертензия, метаболик бузилишлар (гипокалиемия, гиперкальциемия, гипофосфатемия, гиперурикемия, гипергликемия, метаболик ацидоз, респиратор алкалоз), ҳаракат қўзғалишлари, хавотир, ёруғликдан қўрқиш, қалтираш, кома, тиришиш. Оғир захарланишларда эпилептоид талвасалар (айниқса, болаларда ҳеч қандай белгиларсиз пайдо бўлганда), гипоксия ривожланиши мумкин.

Бошқа токсик белгиларга онгни хиралашиши, деманция, токсик психоз, ўткир панкреатит белгилари, буйрак етишмовчилиги билан рабдомиолиз

киради.

Даволаш: Симптомларнинг оғирлигига боғлиқ ва препаратни бекор қилиш, гемодинамикани тузатиш, теофиллинни организмдан чиқаришни рағбатлантириш (мажбурий диурез, гемосорбция, плазмосорбция, гемодиализ, перитонеал диализ), симптоматик воситаларни тайинлаш, оксигенотерапия, ўпкани сунъий вентиляция қилиш киради.

Тиришишларни бартараф этиш учун диазепамдан фойдаланиш керак. Барбитуратлардан фойдаланиш мақсадга мувофиқ эмас. Қоринча аритмияларида тутқаноқнинг зўрайиши хавфи туфайли лидокаин каби тутқаноққа қарши таъсирга эга антиаритмик препаратларни қўллашдан қочиш керак.

Самарадорлик ва хавфсизлик учун препаратнинг зардобдаги концентрацияси 10-15 мг/кг атрофида ушлаб туриш керак, қонда теофиллин концентрациясини аниқлаш имконияти бўлмаса, унинг суткалик дозаси 10 мг/кг дан ошмаслиги керак.

14. Homiladorlik va laktatsiya davrida qullanishi

Керак бўлганда, ҳомиладорлик вақтида препаратни қўллаш онага кутилган фойда ва ҳомила учун потенциал хавф билан таққосланиши керак.

Кўкрак билан боқиш даврида препаратни қўллаш керак бўлганда кўкрак билан боқишни тўхтатиш керак.

Препаратни транспорт воситаларини бошқариш, механизмлар ва психомотор реакцияларнинг тезлиги ва диққат талаб қилувчи бошқа фаолиятлар билан шуғулланиш қобилиятига таъсир қилиш

Даволаш вақтида препаратни транспорт воситаларини, механизмларни бошқариш, шунингдек юқори диққат-эйтиборни ҳамда психомотор реакцияларнинг тезлигини талаб қилувчи потенциал хавфли бошқа фаолият турлари билан шуғулланиш тавсия этилмайди.