70/729/44 от 27.10.2023

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Кофеин-бензоат натрия

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Кофеин-бензоат натрия

Международное непатентованное или группировочное наименование: Кофеин

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку:

Действующее вещество

Кофеин-бензоат натрия	100,0 мг

Вспомогательные вещества

Крахмал картофельный

Кальция стеарат

Описание: Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого цвета с фаской и риской.

Фармакотерапевтическая группа: Психостимулирующее средство.

Код АТХ: N06BC01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Кофеин - метилксантин, оказывающий психостимулирующее и аналептическое действие. Конкурентно блокирует центральные и периферические А1 и А2 аденозиновые рецепторы. Тормозит активность фосфодиэстеразы в центральной нервной системе, сердце, гладкой и поперечно-полосатой мышечной ткани, жировой ткани, способствует накоплению в них циклического аденозинмонофосфата и циклического гуанозинмонофосфата (данный эффект наблюдается при применении только высоких доз кофеина). Стимулирует центры продолговатого мозга (дыхательный и сосудодвигательный), а также центр блуждающего нерва, оказывает прямое возбуждающее влияние на кору головного мозга. В высоких дозах облегчает межнейрональную проводимость в спинном мозге, усиливая рефлексы. Повышает умственную и физическую работоспособность, стимулирует психическую деятельность, двигательную активность, укорачивает время реакций, временно уменьшает

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

утомление и сонливость. В низких дозах преобладает эффект стимуляции, а в больших - эффект угнетения нервной системы.

Учащает и углубляет дыхание, обычно оказывает положительный ино-, хроно-, батмо- и дромотропный эффект (поскольку влияние на сердечно-сосудистую систему складывается из прямого стимулирующего действия на миокард и одновременного возбуждающего влияния на центр блуждающего нерва, результирующий эффект зависит от преобладания того или иного действия).

Стимулирует сосудодвигательный центр и оказывает непосредственное расслабляющее действие на сосудистую стенку, что приводит к расширению сосудов сердца, скелетных мышц и почек, при этом тонус церебральных артерий повышается (вызывает сужение сосудов головного мозга, что сопровождается снижением мозгового кровотока). Артериальное давление изменяется под действием сосудистых и сердечных механизмов влияния кофеина: при нормальном исходном артериальном давлении кофеин не изменяет или несколько повышает его, при артериальной гипотензии повышает его.

Оказывает спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру (в т.ч. бронходилатирующий эффект), на поперечно-полосатую - стимулирующее. Повышает секреторную активность желудка и диурез (снижение реабсорбции натрия и воды в проксимальных и дистальных почечных канальцах, а также расширение сосудов почек и увеличение фильтрации в почечных клубочках).

Снижает агрегацию тромбоцитов и высвобождение гистамина из тучных клеток. Повышает основной обмен: увеличивает гликогенолиз, повышает липолиз.

Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбция - хорошая, происходит на всем протяжении кишечника. Быстро распределяется во всех органах и тканях организма, проникает через гематоэнцефалический барьер и плаценту, экскретируется в грудное молоко. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 50-75 мин, период полувыведения составляет - 3,9-5,3 ч (иногда до 10 ч). Связь с белками крови (альбуминами) - 15 %. Метаболизму в печени подвергается более 90 %, у детей первых лет жизни до 10-15 %. Кофеин метаболизируется в печени (основная часть диметилируется и окисляется) с образованием 5 метаболитов. Выведение кофеина и его метаболитов осуществляется почками (10 % - в неизмененном виде).

Показания к применению:

Снижение умственной и физической работоспособности, сонливость, головная боль сосудистого генеза (в т.ч. мигрень), умеренная артериальная гипотензия.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

Противопоказания

Гиперчувствительность к компонентам препарата (в т.ч. к другим ксантинам), тревожные расстройства (агорафобия, панические расстройства), органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. острый инфаркт миокарда, атеросклероз), пароксизмальная тахикардия, желудочковая экстрасистолия, артериальная гипертензия, нарушения сна, детский возраст до 12 лет.

С осторожностью

Глаукома, повышенная возбудимость, пожилой возраст, эпилепсия и склонность к судорожным припадкам.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Использование возможно только после консультации с врачом, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и ребенка.

Способ применения и дозы

Назначают внутрь независимо от приема пищи. Не принимать перед сном. При снижении умственной и физической работоспособности, сонливости - взрослым и детям старше 12 лет - по 50 - 100 мг 2-3 раза в день. Курс лечения от нескольких недель до нескольких месяцев в зависимости от состояния больного.

При головной боли сосудистого генеза (в т.ч. мигрень) - взрослым и детям старше 12 лет - по 50 - 100 мг 2-3 раза в день в течение нескольких дней.

При умеренной артериальной гипотензии - взрослым и детям старше 12 лет - по 50 - 100 мг 2-3 раза в день. Курс лечения несколько недель.

Высшая разовая доза для взрослых - 300 мг, высшая суточная доза для взрослых - 1000 мг.

Высшая разовая доза для детей с 12 лет - 150 мг, высшая суточная доза для детей - 500 мг.

Побочное действие

Нежелательные реакции распределены в соответствии с классификацией поражения органов и систем органов согласно словарю MedDRA.

Нарушения со стороны нервной системы: психомоторное возбуждение, тревога, тремор, беспокойство, головная боль, головокружение, эпилептические припадки, усиление рефлексов, тахипноэ, бессонница; при внезапной отмене - усиление торможения центральной нервной системы, повышенная утомляемость, сонливость, мышечное напряжение.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения, тахикардия, повышение артериального давления.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, обострение язвенной болезни.

Общие расстройства: заложенность носа, при длительном применении - привыкание, лекарственная зависимость.

Передозировка

Симптомы: гастралгия, ажитация, тревога, возбуждение, двигательное беспокойство, спутанность сознания, делирий, обезвоживание, тахикардия, аритмия, гипертермия, учащенное мочеиспускание, головная боль, повышенная тактильная или болевая чувствительность, тремор или мышечные подергивания; тошнота и рвота, иногда с кровью; звон в ушах, судороги (при острой передозировке - тонико-клонические).

Кофеин в дозах более 300 мг/сут (в т.ч. на фоне злоупотребления кофе - более 4 чашек натурального кофе по 150 мл) может вызывать состояние тревоги, тремор, головную боль, спутанность сознания, экстрасистолию.

Лечение: промывание желудка, если кофеин был принят в последние 4 ч в дозе более 15 мг/кг и не было рвоты, вызванной кофеином; прием активированного угля, слабительных лекарственных средств; при геморрагическом гастрите - введение антацидных лекарственных средств и промывание желудка ледяным 0,9 % раствором натрия хлорида; поддержание вентиляции легких и оксигенации; при судорогах - внутривенно диазепам, фенобарбитал или фенитоин; поддержание водно-электролитного баланса.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Кофеин является антагонистом аденозина (могут потребоваться большие дозы аденозина). При совместном применении кофеина и барбитуратов, примидона, противосудорожных лекарственных средств (производные гидантоина, особенно фенитоин) возможно усиление метаболизма и увеличение клиренса кофеина; циметидина, пероральных контрацептивов, дисульфирама, ципрофлоксацина, норфлоксацина — снижение метаболизма кофеина в печени (замедление его выведения и увеличение концентрации в крови). Кофеинсодержащие напитки и другие лекарственные средства, стимулирующие центральную нервную систему, - возможна чрезмерная стимуляция центральной нервной системы. Мексилетин — снижает выведение кофеина на 50 %; никотин — увеличивает скорость выведения кофеина.

Ингибиторы моноаминоксидазы, фуразолидон, прокарбазин и селегилин - большие дозы кофеина (более 300 мг/сут) могут вызывать развитие жизнеугрожающих аритмий сердца или выраженного повышения артериального давления.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

Кофеин снижает всасывание препаратов кальция в желудочно-кишечном тракте. Снижает эффективность наркотических и снотворных лекарственных средств. Увеличивает выведение препаратов лития с мочой.

Ускоряет всасывание и усиливает действие сердечных гликозидов, повышает их токсичность.

Совместное применение с бета-адреноблокаторами может приводить к взаимному подавлению терапевтических эффектов; с β-адреномиметиками - к дополнительной стимуляции центральной нервной системы и другим аддитивным токсическим эффектам. Кофеин может снижать клиренс теофиллина и, возможно, других ксантинов, увеличивая возможность аддитивных фармакодинамических и токсических эффектов.

Особые указания

Следует иметь в виду, что внезапное прекращение приема может приводить к усилению торможения центральной нервной системы (сонливость, депрессия). Влияние на центральную нервную систему зависит от типа нервной системы и может проявляться как возбуждением, так и торможением высшей нервной деятельности. В связи с тем, что действие кофеина на артериальное давление складывается из сосудистого и кардиального компонентов, в результате может развиваться как эффект стимуляции сердца, так и угнетение (слабое) его деятельности. Не принимать перед сном.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки 100 мг.

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

По 1, 2, 3, 4, 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 ^{0}С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 25.10.2023 № 21394
(Входящий МЗ №4263247)

Отпускают по рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии:

АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»

Россия, 665462, Иркутская область, г.Усолье-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги.

тел./факс: +7 (39543) 58910, +7 (39543) 58908

Генеральный директор
АО «Усолье-Сибирский химфармзавод» Тюстин С.В.