

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

КОФЕЇН-БЕНЗОАТ НАТРІЮ

Склад:

діюча речовина: caffeine;

1 мл розчину містить кофеїн-бензоату натрію 100 мг або 200 мг;

допоміжні речовини: натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвна прозора рідина.

Фармакотерапевтична група. Психостимулятори, засоби для застосування при синдромі дефіциту уваги та гіперактивності та ноотропні засоби. Похідні ксантину. Код АТХ N06B C01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Кофеїн — алкалоїд, який міститься у листі чаю, зернах кави. Фармакологічні властивості лікарського засобу розподіляють на центральні та периферичні. Центральні ефекти, у свою чергу, розподіляють на психостимулювальні та аналептичні.

Психостимулювальна дія препарату пов'язана з його антагонізмом щодо аденозину у механізмі дії на пуринаргічні (аденозинні) A1- та A2-рецептори у центральній нервовій системі (ЦНС). Відомо, що аденозин пригнічує функції ЦНС. Під впливом препарату посилюється психічна діяльність, розумова та фізична працездатність. Психостимулювальний ефект прямо залежить від дози. Малі дози стимулюють функції ЦНС, більші — пригнічують (за рахунок виснаження нервових клітин).

Аналептична дія препарату пов'язана з його впливом на дихальний і гемодинамічний центри довгастого мозку. Унаслідок цього спостерігається збільшення частоти та об'єму вдиху.

Периферичні ефекти препарату неоднозначні та пов'язані з його дозою та рівнем впливу на судинне русло та міокард. Коронарний кровотік спочатку підсилюється, а потім знижується, збільшується нирковий кровотік, звужуються судини черевної порожнини, шкіри. Під впливом препарату пригнічується центральний кровообіг і знижується тиск цереброспінальної рідини, чим пояснюється його ефективність при мігрені. Дія препарату на серце неоднозначна. У малих дозах він спричиняє позитивний інотропний ефект, у підвищених дозах — позитивний хронотропний ефект. У деяких людей може спричинити тахікардію та навіть аритмію.

Фармакокінетика. Препарат швидко розподіляється в усіх органах і тканинах організму.

Зв'язок з білками крові (альбумінами) — 25–36 %. Легко проникає через гематоенцефалічний бар'єр і плаценту. Проникає у грудне молоко. Об'єм розподілу у дорослих — 0,4–0,6 л/кг, у немовлят — 0,78–0,92 л/кг. Метаболізму у печінці піддається більше 90 % прийнятої дози препарату, у дітей першого року життя — до 10–15 %. У дорослих близько 80 % дози кофеїну метаболізується у параксантин, близько 10 % — у теобромін і близько 4 % — у теофілін. Ці сполуки згодом деметилуються у монометилксантини, а потім — у метильовані сечові кислоти. Період напіввиведення у дорослих — 3,9–5,3 години (іноді — до 10 годин), у немовлят (віком до 4–7 місяців життя) — 65–130 годин. Кофеїн і його метаболіти виводяться нирками (у незмінену вигляді у дорослих виводиться 1–2 %, у немовлят — до 85 %).

Клінічні характеристики.

Показання. Інфекційні та інші захворювання, що супроводжуються пригніченням центральної нервової і серцево-судинної систем; пригнічення дихання, асфіксія; отруєння наркотиками та іншими речовинами, що пригнічують центральну нервову систему; астеничний синдром; спазми судин головного мозку.

Протипоказання. Підвищена чутливість до похідних ксантину та до інших компонентів лікарського засобу; підвищена збудливість; безсоння; виражене підвищення артеріального тиску; атеросклероз; органічні захворювання серцево-судинної системи, у т. ч. гострий інфаркт міокарда; пароксизмальна тахікардія; артеріальна гіпертензія; глаукома; вік понад 60 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. При одночасному застосуванні препарату з іншими лікарськими засобами можливе:

з α - та β -адреноміметиками, аналгетиками-антипіретиками, клозапіном, похідними ксантину, психостимулювальними засобами, серцевими глікозидами, тиреотропними засобами — посилення ефектів вищезазначених лікарських засобів;

з анксиолітиками, опіоїдними аналгетиками, снодійними та седативними засобами — послаблення ефектів вищезазначених лікарських засобів;

з антиаритмічними препаратами (мексилетин), гормональними пероральними контрацептивами, дисульфірамом, еноксацином, еритроміцином, ізоніазидом, метоксаленом, норфлуксацином, офлоксацином, циметидином, ципрофлоксацином — посилення ефектів кофеїну;

з антидепресантами, барбітуратами, β -адреноблокаторами, примідоном, протисудомними лікарськими засобами (похідні гідантоїну, особливо фенітоїн), холестираміном, холінолітиками — послаблення ефектів кофеїну;

з лікарськими засобами, що стимулюють центральну нервову систему, напоями, що містять кофеїн — надмірна стимуляція центральної нервової системи;

з інгібіторами моноаміноксидази (MAO), прокарбазином, фуразолідоном — небезпечні аритмії серця або виражене підвищення артеріального тиску;

з *ерготаміном* — посилення всмоктування останнього з травного тракту;

з *препаратами кальцію* — послаблення всмоктування останніх зі шлунково-кишкового тракту;

з *препаратами літію* — посилення виведення останніх із сечею;

з *нікотином* — посилення виведення кофеїну із сечею.

Препарат незначною мірою збільшує концентрацію 5-гідроксиіндолоцтової кислоти при її визначенні у сечі.

Препарат незначною мірою збільшує концентрацію катехоламінів та ванілілмигдалевої кислоти, що може призвести до хибнопозитивних результатів тестів при діагностиці феохромоцитом та нейробластом. Не слід застосовувати препарат під час проведення тестів.

Препарат може призвести до хибних результатів визначення концентрації уратів у сироватці крові методом Бітнера.

Особливості застосування. Вплив на центральну нервову систему залежить від типу нервової системи та може проявлятися як збудженням, так і гальмуванням вищої нервової діяльності.

У зв'язку з тим, що дія кофеїну на артеріальний тиск складається із судинного та кардіального компонентів, може розвиватися як ефект стимуляції серця, так і слабке пригнічення його діяльності.

Застосовувати з обережністю хворим на виразкову хворобу шлунка і дванадцятипалої кишки в анамнезі.

При апное у немовлят та у дітей грудного віку у післяопераційному періоді (профілактика) застосовувати кофеїн або кофеїну цитрат, але не кофеїн-бензоат натрію.

Цей лікарський засіб містить 1,67 ммоль (або 38,33 мг) натрію на дозу 400 мг кофеїн-бензоату натрію. Слід бути обережним при застосуванні пацієнтам, які застосовують натрій-контрольовану дієту.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Препарат не застосовувати у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Під час лікування слід дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом та роботі з іншими механізмами, а у разі виникнення побічних ефектів з боку нервової системи утриматися від потенційно небезпечних видів діяльності, які вимагають підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози. Дорослим лікарський засіб призначати підшкірно у дозі 1-2

мл 10 % розчину (100–200 мг). Вища разова доза — 400 мг, вища добова доза — 1 г.

Дітям віком від 12 років препарат призначати підшкірно у дозі (залежно від віку) 0,25–1 мл 10 % розчину (25–100 мг).

Діти. Препарат не застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Симптоми: тривожність, збудження, рухове занепокоєння, ажитація, тремор або м'язові посмикування, епілептичні напади (при гострому передозуванні — тоніко-клонічні судоми), гіперестезія, миготлива скотома, дзвін у вухах, головний біль, безсоння, сплутаність свідомості, марення, делірій, тахікардія, аритмія, гіпертермія, прискорене сечовипускання, зневоднення, нудота, блювання, іноді з кров'ю.

Лікування: підтримка вентиляції легень, оксигенації, підтримка балансу рідини та солей, гемодіаліз, при епілептичних нападах — внутрішньовенно діазепам, фенобарбітал або фенітоїн.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: збудження, тривожність, тремор, занепокоєння, безсоння, головний біль, запаморочення, епілептичні напади, посилення рефлексів, тахіпное. При раптовій відміні препарату після тривалого застосування — посилення впливу на центральну нервову систему, підвищена стомлюваність, сонливість, м'язова напруженість, депресія.

З боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття, відчуття стиснення у грудях, тахікардія, аритмії, підвищення артеріального тиску.

З боку травного тракту: нудота, блювання, діарея, загострення виразкової хвороби.

З боку імунної системи, шкіри та підшкірної клітковини: реакції гіперчутливості, у тому числі висипання, свербіж, кропив'янка, набряк Квінке, бронхоспазм.

Лабораторні показники: гіпо- або гіперглікемія, підвищення кліренсу креатиніну, збільшення екскреції натрію та кальцію, хибне підвищення концентрації сечової кислоти у плазмі крові, що визначається методом Бітнера, незначне підвищення концентрації 5-гідроксиіндолоцтової кислоти, ванілілмигдалевої кислоти та катехоламінів у сечі.

Інші: збільшення частоти сечовипускання, закладеність носа, при тривалому застосуванні — звикання, медикаментозна залежність.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Кофеїн є антагоністом аденозину.

Упаковка. По 1 мл в ампулах № 10 у пачці; № 10, 5×2 у блістері в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Товариство з обмеженою відповідальністю «Дослідний завод «ГНЦЛС».

ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ'Я».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, Харківська обл., місто Харків, вулиця Воробйова, будинок 8.

(Товариство з обмеженою відповідальністю «Дослідний завод «ГНЦЛС»)

Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.

(ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ'Я»)