

Україна, м.Київ
Публічне акціонерне товариство
«Науково-виробничий центр
«Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод»

ВІДДІЛ РЕЄСТРАЦІЇ

Комісія

Документ ТОВ "Агрофарм"
ОРИГІНАЛ
22.06.17

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
12.06.2017 № 640
Реєстраційне посвідчення
№ 44/6199/d/a

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування лікарського засобу

КОФЕЇН-БЕНЗОАТ НАТРІЮ (COFFEINE-SODIUM BENZOATE)

Склад:

діюча речовина: кофеїн-бензоат натрію;

1 таблетка містить кофеїну-бензоату натрію (у перерахунку на 100 % сухої речовини) – 200 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, повідон, кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, білого кольору, з плоскою поверхнею зі скошеними краями і рискою.

Фармакотерапевтична група.

Психостимулятори, засоби для застосування при синдромі порушення уваги та гіперактивності (ADHD), та ноотропні засоби. Похідні ксантину. Код АТХ N06B C01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Кофеїн-бензоат натрію застосовується переважно як стимулятор центральної нервової системи.

В основі механізму дії препарату лежить пригнічення кофеїном ферменту фосфодіестерази, що призводить до накопичення всередині клітин циклічного аденозинмонофосфату. Останній посилює глікогеноліз, стимулює метаболізм в органах і тканинах, включаючи центральну нервову систему та м'язи. Важливою ланкою у механізмі стимулюючого ефекту препарату є зв'язування кофеїну з пуриновими рецепторами мозку.

Кофеїн посилює та регулює процеси збудження у корі головного мозку, посилює позитивні рефлекси, підвищує рухову активність. Дані ефекти є дозозалежними, сприяють підвищенню розумової та фізичної працездатності, зменшенню втоми та сонливості. У надто великих дозах кофеїн може призвести до виснаження нервових клітин.

Препарат послаблює дію снодійних і наркотичних засобів, підвищує рефлекторну збудливість спинного мозку, збуджує дихальний та судинноруховий центри. Під впливом препарату посилюється серцева діяльність, підвищується частота серцевих скорочень.

Під впливом кофеїну-бензоату натрію трохи посилюється діурез (головним чином через зменшення реабсорбції електролітів у ниркових каналцях).

Фармакокінетика.

Препарат добре всмоктується з травного тракту. Рівномірно розподіляється в організмі. Легко проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр. Проникає крізь плаценту та екскретується у грудне молоко. У процесі біотрансформації піддається деметилюванню та окисленню. Період напіввиведення – 3-7 години. Виділяється з організму з сечею та калом у вигляді метаболітів, невелика частина (близько 8 %) – у незміненому вигляді.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Інфекційні та інші захворювання, що супроводжуються пригніченням центральної нервової і серцево-судинної систем;
- артеріальна гіпотензія;
- астеничний синдром;
- спазми судин головного мозку;
- сонливість;
- підвищення розумової та фізичної працездатності.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до кофеїну, інших похідних ксантинів (теофілін, теобромін) або до будь-якого з компонентів препарату;
- підвищена збудливість;
- безсоння;
- виражене підвищення артеріального тиску, артеріальна гіпертензія;
- органічні захворювання серцево-судинної системи (у т.ч. гострий інфаркт міокарда, пароксизмальна тахікардія, атеросклероз);
- глаукома;
- вік понад 60 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування кофеїну-бензоату натрію з:

- *інгібіторами MAO, фуразолідом, прокарбазином і селегіліном* – може спричинити розвиток небезпечних серцевих аритмій або вираженого підвищення артеріального тиску;
- *барбітуратами, примідоном, протисудомними лікарськими засобами (похідними гідантоїну, особливо фенітоїном)* – посилення метаболізму та збільшення кліренсу кофеїну;
- *кетоконазолом, дисульфірамом, ципрофлоксацином, норфлоксацином, еноксацином, піпемідиною кислотою* – може спричинити уповільнення виведення кофеїну та збільшення його концентрації в крові;
- *циметидином, гормональними контрацептивами, ізоніазидом* – посилення дії кофеїну;
- *флувоксаміном* – підвищення рівню кофеїну у плазмі крові;
- *мексилетином* – зниження виведення кофеїну на 50 %;
- *нікотинном* – збільшення швидкості виведення кофеїну;
- *метоксаленом* – зменшення виведення кофеїну з організму з можливим посиленням його ефекту та розвитком токсичної дії;
- *клозапіном* – підвищення концентрації клозапіну в крові;
- *теофіліном та іншими ксантинами* – зниження кліренсу даних препаратів, збільшення ризику адитивних фармакодинамічних і токсичних ефектів;
- *β -адреноблокаторами* – може призводити до взаємного пригнічення терапевтичних ефектів;
- *тиреотропними засобами* – підвищення тиреоїдного ефекту;
- *опіоїдними анальгетиками, анксиолітиками, снодійними і седативними засобами* – зниження ефекту даних препаратів;
- *препаратами літію* – збільшення виведення літію з сечею;
- *препаратами кальцію* – зниження всмоктування даних препаратів;
- *серцевими глікозидами* – прискорення всмоктування, посилення дії та підвищення токсичності серцевих глікозидів;
- *анальгетиками-антипіретиками* – посилення їх ефекту;
- *ерготаміном* – покращення всмоктування ерготаміна з травного тракту;
- *похідними ксантину, α - та β -адреноміметиками, психостимулюючими засобами* – потенціювання їх ефектів.

Кофеїн є антагоністом засобів для наркозу та інших препаратів, що пригнічують центральну нервову систему, конкурентним антагоністом препаратів аденозину, АТФ.

Напої та лікарські засоби, що містять кофеїн, при сумісному застосуванні з препаратом можуть призвести до надмірної стимуляції центральної нервової системи. Високі дози кофеїну можуть спричинити тремтіння і серцебиття. Пацієнтам слід уникати надмірного вживання кави або чаю.

Особливості застосування.

При застосуванні препарату слід уникати надмірного вживання кави, міцного чаю, інших тонізуючих напоїв, алкоголю та лікарських засобів, що містять кофеїн.

У випадку тривалого застосування препарату можливий розвиток психічної залежності. Різде припинення лікування призводить до посилення гальмування центральної нервової системи (сонливість, депресія).

Дія препарату значною мірою залежить від типу нервової системи та може проявлятися як збудженням, так і гальмуванням вищої нервової діяльності.

Кофеїн може стати причиною хибного підвищення сечової кислоти у крові, що визначається методом Bittner.

Кофеїн може підвищувати рівні 5-гідроксиіндолацетової кислоти (5-НІАА), ванілілмигдалевої кислоти (VMA) та катехоламінів у сечі, що може призвести до хибнопозитивних результатів діагностики феохромоцитоми та нейробластоми.

З обережністю застосовувати препарат пацієнтам з виразковою хворобою шлунка і дванадцятипалої кишки в анамнезі.

Препарат містить лактозу. Пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом мальабсорбції глюкози-галактози не слід застосовувати даний препарат.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат протипоказано застосовувати у період вагітності або годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Доки не буде з'ясована індивідуальна реакція пацієнта на препарат, слід утримуватися від керування автотранспортом або іншими механізмами, враховуючи, що під час лікування можуть виникнути побічні реакції з боку центральної нервової системи.

Спосіб застосування та дози.

Застосовувати внутрішньо 2-3 рази на добу. Разова доза для дорослих становить 100-200 мг.

Вища разова доза – 500 мг, вища добова доза – 1 г.

Дітям віком від 12 років призначати у дозі 100 мг 2-3 рази на добу.

Вища добова доза для дітей – 500 мг.

Дозу препарату та курс лікування встановлює лікар індивідуально залежно від тяжкості захворювання та ефективності терапії.

Діти.

Кофеїн-бензоат натрію у вигляді таблеток не рекомендується застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Симптоми: гастралгія, ажитація, тривожність, рухове занепокоєння, сплутаність свідомості, делірій, зневоднення, тахікардія, аритмії, гіпертермія, збільшення частоти сечовипускання, головний біль, підвищена тактильна або больова чутливість, тремор або м'язові посмикування; нудота та блювання, іноді з домішками крові; дзвін у вухах, судомні напади (при гострому передозуванні – тоніко-клонічні судоми).

Лікування: промивання шлунка, призначення ентеросорбентів, підтримка вентиляції легенів і оксигенація; при судомних нападах – внутрішньовенно діазепам, фенобарбітал або фенітоїн; підтримка балансу рідини та солей; гемодіаліз. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції.

Нервова система: збудження, тривожність, тремор, занепокоєння, головний біль, запаморочення, м'язові посмикування, судомні напади, посилення рефлексів, тахіпноє, безсоння; при раптовій відміні – посилення гальмування центральної нервової системи з появою відчуття підвищеної втомлюваності, сонливості, м'язового напруження, депресії.

Серцево-судинна система: відчуття тиснення у грудях, відчуття серцебиття, тахікардія, аритмії, підвищення артеріального тиску.

Травний тракт: нудота, блювання, діарея, загострення виразкової хвороби.

Сечовидільна система: збільшення частоти сечовипускання, підвищення кліренсу креатиніну, збільшення екскреції натрію та кальцію.

Імунна система: можливі прояви реакцій гіперчутливості, у т.ч. шкірні висипання, свербіж, кропив'янка, набряк Квінке, бронхоспазм, анафілактичний шок, синдром Стівенса-Джонсона.

Лабораторні показники: можливе хибне підвищення сечової кислоти в крові, що визначається методом Bittner, гіпоглікемія/гіперглікемія, незначне підвищення 5-гідроксиіндолоцтової кислоти (5-НІАА), ванілілмигдалевої кислоти (VMA) та катехоламінів у сечі.

Інші: закладеність носа, при тривалому застосуванні – зниження ефекту кофеїну, що пов'язано з утворенням нових аденозинових рецепторів, медикаментозна залежність.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

В оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.
Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у пачці; по 10 таблеток у блістері.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Публічне акціонерне товариство «Науково-виробничий центр «Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод».

Товариство з обмеженою відповідальністю «АГРОФАРМ».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 03134, м. Київ, вул. Миру, 17.

Україна, 08200, Київська область, м. Ірпінь, вул. Центральна, 113-А.

Дата останнього перегляду.

Мешет узюрмешев

23.02.17

Радослав

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє



УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
дд.06.2017 № 640
Регистрационное удостоверение
№ УА/6199/01/0

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

КОФЕИН-БЕНЗОАТ НАТРИЯ
(COFFEINE-SODIUM BENZOATE)

Состав:

действующее вещество: кофеин-бензоат натрия;
1 таблетка содержит кофеина-бензоата натрия (в пересчете на 100 % сухое вещество) – 200 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, повидон, кальция стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы, белого цвета, с плоской поверхностью со скошенными краями и риской.

Фармакотерапевтическая группа.

Психостимуляторы, средства для применения при синдроме нарушения внимания и гиперактивности (ADHD), и ноотропные средства. Производные ксантина.
Код АТХ N06B C01.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Кофеин-бензоат натрия применяется преимущественно как стимулятор центральной нервной системы.

В основе механизма действия препарата лежит угнетение кофеином фермента фосфодиэстеразы, приводящее к накоплению внутри клеток циклического аденозинмонофосфата. Последний усиливает гликогенолиз, стимулирует метаболизм в органах и тканях, включая центральную нервную систему и мышцы. Важным звеном в механизме стимулирующего эффекта препарата является связывание кофеина с пуриновыми рецепторами мозга.

Кофеин усиливает и регулирует процессы возбуждения в коре головного мозга, усиливает положительные рефлексы, повышает двигательную активность. Данные эффекты являются дозозависимыми, способствуют повышению умственной и физической работоспособности, уменьшению усталости и сонливости. В очень больших дозах кофеин может привести к истощению нервных клеток.

Препарат ослабляет действие снотворных и наркотических средств, повышает рефлекторную возбудимость спинного мозга, возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры. Под влиянием препарата усиливается сердечная деятельность, повышается частота сердечных сокращений.

Под влиянием кофеина-бензоата натрия несколько усиливается диурез (главным образом из-за уменьшения реабсорбции электролитов в почечных канальцах).

Фармакокинетика.

Препарат хорошо всасывается из пищеварительного тракта. Равномерно распределяется в организме. Легко проникает через гематоэнцефалический барьер. Проникает через плаценту и экскретируется в грудное молоко. В процессе биотрансформации подвергается

деметилированию и окислению. Период полувыведения – 3-7 часов. Выделяется из организма с мочой и калом в виде метаболитов, небольшая часть (около 8 %) – в неизмененном виде.

Клинические характеристики.

Показания.

- Инфекционные и другие заболевания, сопровождающиеся угнетением центральной нервной и сердечно-сосудистой систем;
- артериальная гипотензия;
- астенический синдром;
- спазмы сосудов головного мозга;
- сонливость;
- повышение умственной и физической работоспособности.

Противопоказания.

- Повышенная чувствительность к кофеину, другим производным ксантинов (теофиллин, теобромин) или к какому-либо из компонентов препарата;
- повышенная возбудимость;
- бессонница;
- выраженное повышение артериального давления, артериальная гипертензия;
- органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. острый инфаркт миокарда, пароксизмальная тахикардия, атеросклероз);
- глаукома;
- возраст более 60 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Одновременное применение кофеина-бензоата натрия с:

- *ингибиторами MAO, фуразолидоном, прокарбазином и селегилином* – может вызывать развитие опасных сердечных аритмий или выраженного повышения артериального давления;
- *барбитуратами, примидоном, противосудорожными лекарственными средствами (производными гидантоина, особенно фенитоином)* – усиление метаболизма и увеличение клиренса кофеина;
- *кетоконазолом, дисульфирамом, ципрофлоксацином, норфлоксацином, энноксацином, пипемидиновой кислотой* – может вызывать замедление выведения кофеина и увеличение его концентрации в крови;
- *циметидином, гормональными контрацептивами, изониазидом* – усиление действия кофеина;
- *флувоксамином* – повышение уровня кофеина в плазме крови;
- *мексилетином* – снижение выведения кофеина на 50 %;
- *никотином* – увеличение скорости выведения кофеина;
- *метоксаленом* – уменьшение выведения кофеина из организма с возможным усилением его эффекта и развитием токсического действия;
- *клозапином* – повышение концентрации клозапина в крови;
- *теофиллином и другими ксантинами* – снижение клиренса данных препаратов, увеличение риска аддитивных фармакодинамических и токсических эффектов;
- *β -адреноблокаторами* – может приводить к взаимному подавлению терапевтических эффектов;
- *тиреотропными средствами* – повышение тиреоидного эффекта;
- *опиоидными анальгетиками, анксиолитиками, снотворными и седативными средствами* – снижение эффекта данных препаратов;
- препаратами *лития* – увеличение выведения лития с мочой;
- препаратами *кальция* – снижение всасывания данных препаратов;



- *сердечными гликозидами* – ускорение всасывания, усиление действия и повышение токсичности сердечных гликозидов;
- *аналгетиками-антипиретиками* – усиление их эффекта;
- *эрготамином* – улучшение всасывания эрготамина в пищеварительном тракте;
- *производными ксантинов, α - и β -адреномиметиками, психостимулирующими средствами* – потенцирование их эффектов.

Кофеин является антагонистом средств для наркоза и других препаратов, угнетающих центральную нервную систему, конкурентным антагонистом препаратов аденозина, АТФ.

Напитки и лекарственные средства, содержащие кофеин, при совместном применении с препаратом могут привести к чрезмерной стимуляции центральной нервной системы. Высокие дозы кофеина могут вызывать дрожь и сердцебиение. Пациентам следует избегать чрезмерного употребления кофе или чая.

Особенности применения.

При применении препарата следует избегать чрезмерного употребления кофе, крепкого чая, других тонизирующих напитков, алкоголя и лекарственных препаратов, содержащих кофеин.

В случае длительного применения препарата возможно развитие психической зависимости. Резкое прекращение лечения приводит к усилению торможения центральной нервной системы (сонливость, депрессия).

Действие препарата в значительной степени зависит от типа нервной системы и может проявляться как возбуждением, так и торможением высшей нервной деятельности.

Кофеин может стать причиной ложного повышения мочевой кислоты в крови, определяемой методом Bittner.

Кофеин может повышать уровни 5-гидроксииндолуксусной кислоты (5-НИАА), ванилилминдальной кислоты (VMA) и катехоламинов в моче, что может приводить к ложноположительным результатам диагностики феохромоцитомы и нейроblastомы.

С осторожностью применяют препарат пациентам с язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе.

Препарат содержит лактозу. Пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует применять данный препарат.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Препарат противопоказано применять в период беременности или кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Пока не будет выяснена индивидуальная реакция пациента на препарат, следует воздерживаться от управления автотранспортом или другими механизмами, учитывая, что во время лечения могут возникнуть побочные реакции со стороны центральной нервной системы.

Способ применения и дозы.

Применять внутрь 2-3 раза в сутки. Разовая доза для взрослых составляет 100-200 мг.

Высшая разовая доза – 500 мг, высшая суточная доза – 1 г.

Детям с 12 лет назначать в дозе 100 мг 2-3 раза в сутки.

Высшая суточная доза для детей – 500 мг.

Дозу препарата и курс лечения устанавливает врач индивидуально в зависимости от тяжести заболевания и эффективности терапии.

Дети.

Кофеин-бензоат натрия в виде таблеток не рекомендуется применять детям до 12 лет.

Передозировка.

Симптомы: гастралгия, жажда, тревожность, двигательное беспокойство, спутанность сознания, делирий, обезвоживание, тахикардия, аритмии, гипертермия, повышение частоты мочеиспускания, головная боль, повышенная тактильная или болевая чувствительность, тремор или мышечные подергивания; тошнота и рвота, иногда с примесью крови; звон в ушах, судорожные припадки (при острой передозировке – тонико-клонические судороги).

Лечение: промывание желудка, назначение энтеросорбентов, поддержание вентиляции легких и оксигенация; при судорожных припадках – внутривенно диазепам, фенобарбитал или фенитоин; поддержание баланса жидкости и солей; гемодиализ. Специфического антидота нет.

Побочные реакции.

Нервная система: возбуждение, тревожность, тремор, беспокойство, головная боль, головокружение, мышечные подергивания, судорожные приступы, усиление рефлексов, тахипноэ, бессонница; при внезапной отмене – усиление торможения центральной нервной системы с появлением чувства повышенной утомляемости, сонливости, мышечного напряжения, депрессии.

Сердечно-сосудистая система: чувство сдавливания в груди, ощущение сердцебиения, тахикардия, аритмии, повышение артериального давления.

Пищеварительный тракт: тошнота, рвота, диарея, обострение язвенной болезни.

Мочевыделительная система: повышение частоты мочеиспускания, повышение клиренса креатинина, увеличение экскреции натрия и кальция.

Иммунная система: возможны проявления реакций гиперчувствительности, в т.ч. кожные высыпания, зуд, крапивница, отек Квинке, бронхоспазм, анафилактический шок, синдром Стивенса-Джонсона.

Лабораторные показатели: возможно ложное повышение мочевой кислоты в крови, определяемой методом Bittner, гипогликемия/гипергликемия, незначительное повышение 5-гидроксииндолуксусной кислоты (5-HIAA), ванилилминдальной кислоты (VMA) и катехоламинов в моче.

Другие: заложенность носа, при длительном применении – снижение действия кофеина, что связано с образованием в клетках мозга новых аденозиновых рецепторов, лекарственная зависимость.

Срок годности. 4 года.

Условия хранения.

В оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере, по 1 блистеру в пачке; по 10 таблеток в блистере.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

Публичное акционерное общество «Научно-производственный центр «Борщаговский химико-фармацевтический завод».

Общество с ограниченной ответственностью «АГРОФАРМ».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 03134, г. Киев, ул. Мира, 17.

Украина, 08200, Киевская область, г. Ирпень, ул. Центральная, 113-А.

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

113-А.
Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

Дата последнего пересмотра.

Масло узгоджено
23.02.17

[Handwritten signature]