

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Наименование на лекарствения продукт

COFFEINUM-NATRIO BENZOICUM

2. Качествен и количествен състав

Състав на една ампула 1 ml:

Caffeine and Sodium benzoate 200 mg

(Еквивалент на 81,15 mg Caffeine и 118,85 mg Sodium benzoate)

3. Лекарствена форма

Инжекционен разтвор

4. Клинични данни

4.1. Показания

За лечение на респираторна депресия, свързана с предозиране на потискащи ЦНС лекарства, включително наркотични аналгетици и злоупотреба с алкохол; симптоматично облекчаване на главоболие след спинална пункция.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Прилага се парентерално, подкожно, мускулно и венозно в следния дозов режим:

Възрастни: 200-300 mg

Максимална еднократна доза – 500 mg и максимална денонощна доза – до 1000 mg



Поддържаща доза – 2,5 – 5 mg/kg тегло за 24 часа в продължителност на лечебния курс до 10-12 дни.

Поддържащата доза се мониторира съобразно толеранса на пациента и плазмените кофеинови нива.

4.3. Противопоказания

Продуктът не се прилага при повишена възбудимост на нервната система, безсъние, високостепенна артериална хипертония, нарушения в периферното кръвообращение, язвена болест на стомаха и глаукома, свръхчувствителност към кофеин и натриев бензоат, недоносени и новородени деца.

4.4. Специални предупреждения за употреба

С внимание да се прилага при пациенти с гастродуоденити, язвена болест на стомаха, исхемична болест на сърцето, чернодробна и бъбречна недостатъчност.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Клинично значими взаимодействия са наблюдавани при новородени и недоносени деца, при които се наблюдава засилване на нежеланите ефекти поради удълженото време на полуетиминиране на кофеин и теофилин.

Кофеин намалява ефекта на сънотворните лекарствени средства и потенцира аналгетичният ефект на нестероидните противовъзпалителни и аналгетичните продукти. Едновременното аплициране на кофеин и кетопрофен при здрави индивиди води до намаляване на диурезата. Кофеинът усилва ефекта на ерготаминовите деривати (подобрява гастроинтестиналната резорбция на



ерготаминовия тартарат), както и инотропния ефект на бета-адренергичните агонисти върху миокарда.

Cimetidine и ketokonazole намаляват елиминирането на кофеина, докато phenobarbital и phenytoin ускоряват елиминирането на кофеина, което предполага прилагането на съответно по-ниска и по-висока, доза от лекарствения продукт.

Ципрофлоксацин увеличава времето на пулуживот на кофеина, клинафлоксацин намалява неговия клирънс с 84 %, а флуфоксамин (антидепресант и мощен инхибитор на CYP 1A2) предизвиква подобен ефект. Mexiletine редуцира с 50% елиминирането на кофеин и засилва неговите странични ефекти.

Едновременното прилагане на фенилпропаноламин с кофеин води до значително повишаване на артериалното налягане, а с верапамил – до увеличаване честотата на страничните ефекти от страна на ССС и ЦНС. Комбинираното прилагане с MAO инхибитори може да доведе до състояние на хипертензия и екстрасистолия, поради засилване на симпатикомиметичните ефекти на кофеина.

Дисулфирам (есперал) и орални контрацептиви потискат чернодробния метаболизъм на кофеина.

Кофеин увеличава екскрецията на Lithium и намалява терапевтичния ефект на последния.

Не се препоръчва комбинираното прилагане на лекарствения продукт с теофилин.



4.6. Бременност и кърмене

Лекарственият продукт преминава в кърмата като съдържанието е 50% от това в плазмата. Приемането на продукта в периода на бременността и лактацията се допуска само в случаи на сериозни медицински показания, тъй като няма достатъчно данни за безвредността на продукта при бременни жени и кърмачки.

4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

При шофиране и работа с машини трябва да се прилага с внимание.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

При високи дози и предразположени пациенти могат да се наблюдават следните нежелани лекарствени реакции:

Сърдечно-съдова система: ускоряване на пулса и дишането, тахикардия, палпитации, екстрасистолия.

Нервна система: възбуда, безсъние, тремор, главоболие, халюцинации, световъртеж, гърчове, неспокойство, шум в ушите.

Храносмилателна система: гастро-езофагеален рефлукс и повишена стомашна секреция, повръщане, диария, болки в коремната област, гастритни оплаквания.

Дихателна система: тахипнея.

Отделителна система: засилена диуреза, промени в елиминирането на катехоламините.

Ендокринна система: хипергликемия.

Кожа и лигавици: сърбеж, повишаване на температурата.

4.9. Предозиране

Рядко са наблюдавани отравяния с кофеин тъй като еднократната летална доза за възрастни е 5 до 10 g, но при плазмени концентрации над 30 µg/ml са наблюдавани ефекти от страна на ЦНС и сърдечно-съдовата система. Ранните симптоми на кофеиновата интоксикация са безсъние, безпокойство и главоболие, които могат да прогресират в делириум, халюцинации, повръщане, гърчове, тахикардия, екстрасистолия, учестено дишане и усилена диуреза.

Лечението е симптоматично и поддържащо. Прилагат се инфузии с разтвори на глюкоза, фенобарбитал по 100-200 mg или хлорпромазин 25 до 30 mg до намаляване на серумната концентрация на кофеина в терапевтични граници.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамика

Има стимулиращ ефект върху висшите отдели на ЦНС и в терапевтични дози усилва и регулира процесите на възбуждане в кората на главния мозък, като същевременно потенцира положителните условни рефлексии и повишава двигателната активност. Увеличава силата на сърдечните съкращения, разширява мозъчните, коронарните и съдовете на скелетната мускулатура и белите дробове. Усилва обмяната на веществата и бъбречната диуреза. При колапсни и шокови състояния води до повишаване на системното кръвно налягане и намалява състоянието на умора и сънливост. Механизма на действие се изразява в увеличаване на нивото на клетъчния аденозин монофосфат чрез инхибиране на ензима фосфодиестераза, на което се дължи



усилването на процесите на гликогенолизата и останалите метаболитни процеси в човешкия организъм.

5.2. Фармакокинетика

Кофеинът е много слаба основа, която се резорбира бързо и възбуждащото му действие се проявява след 5-6 минути при подкожно инжектиране. Равномерно се разпределя в различните тъкани на организма, преминава през кръвномозъчната бариера и през плацентата. Плазменият му полуживот е около 4 часа. Метаболизира се изцяло в черния дроб, чрез деметилиране и се излъчва с урината под формата на метаболити 90-93 % и 8-19 % в непроменен вид. Слабо се излъчва и през кожата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Кофеин натриев бензоат принадлежи към нискотоксичните вещества. При експериментални животни не е установен канцерогенен и генотоксичен ефект, при ежедневен прием на 55 mg/kg тегло на мишки в продължение на 18 месеца. Не е установено увеличаване на хромозомните аберации в тъкани и култури от яйчници на хамстер и човешки лимфоцити.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Съдържание на 1 ампула в mg:

Натриев хидроксид 1 mol/l

Sodium hydroxide - до pH 6,8-8,5

Вода за инжекции

Water for injections - до 1 ml



6.2. Физико-химични несъвместимости

Продуктът да не се смесва с други лекарства в една спринцовка.

6.3. Срок на годност

3 години от датата на производство

6.4. Специални условия за съхранение

В оригинални опаковки на сухо и защитено от светлина място при температура под 25° С. Да не се замразява !

Да се съхранява на място, недостъпно за деца !

6.5. Данни за опаковката

Десет броя ампули от безцветно стъкло се поставят в блистерни опаковки от твърдо ПВХ-фолио.

Една или десет блистерни опаковки се поставят в щанцована кутия от едностранно пигментно покрит картон по БДС 11373-89.

Във всяка кутия се поставят листовка за начина на употреба, пилички и контролен номер, а когато има маркировка на горната част на ампулата във вид на цветна точка или пръстен, не се ползват пилички за отваряне на ампулата.

6.6. Препоръки за употреба

По лекарско предписание.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Софарма АД, България

1220 София, ул. "Илиенско шосе" N 16



8. **Регистрационен № в Регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ**

9. **Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт (подновяване на разрешението)**

10. **Дата на (частична) актуализация на текста**
12.11.2003 г.

