Кофеин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кофеин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Психостимулирующее и аналептическое средство, производное метилксантина. Конкурентно блокирует центральные и периферические А1 и А2 аденозиновые рецепторы. Тормозит активность ФДЭ в ЦНС, сердце, гладкомышечных органах, скелетных мышцах, жировой ткани, способствует накоплению в них цАМФ и цГМФ (данный эффект наблюдается при применении только в высоких дозах). Стимулирует центры продолговатого мозга (дыхательный и сосудодвигательный), а также центр n.vagus, оказывает прямое возбуждающее влияние на кору головного мозга. В высоких дозах облегчает межнейрональную проводимость в спинном мозге, усиливая спинномозговые рефлексы.

Повышает умственную и физическую работоспособность, стимулирует психическую деятельность, двигательную активность, укорачивает время реакций, временно уменьшает утомление и сонливость. В малых 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 ССС складывается из прямого стимулирующего действия на миокард и одновременного возбуждающего влияния на центры n.vagus, результирующий эффект зависит от преобладания того или иного действия). Стимулирует сосудодвигательный центр и оказывает непосредственное релаксирующее 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 и давления кислорода в головном мозге).

АД изменяется под действием сосудистых и сердечных механизмов влияния кофеина: при нормальном исходном АД кофеин не изменяет или слегка повышает его, при артериальной гипотензии нормализует его.

Оказывает спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру (в т.ч. бронходилатирующий эффект), на поперечнополосатую - стимулирующее.

Повышает секреторную активность желудка.

Оказывает умеренное диуретическое действие, что обусловлено снижением реабсорбции ионов 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.

Показания к применению:

Заболевания, сопровождающиеся угнетением ЦНС, функций сердечно-сосудистой и дыхательной систем (в т.ч. отравления опиоидными анальгетиками, инфекционные заболевания), спазмы сосудов головного мозга, снижение умственной и физической работоспособности, сонливость.

Относится к болезням:

- Инфекции
- Спазмы

Противопоказания:

Артериальная гипертензия, органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. выраженный атеросклероз), глаукома, повышенная возбудимость, нарушения сна, старческий возраст.

Способ применения и дозы:

Вводят п/к или принимают внутрь. Взрослым - по 100-200 мг 2-3 раза/сут; детям - по 25-100 мг 2-3 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: нарушение сна, возбуждение, беспокойство; при длительном применении возможно привыкание.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, повышение АД, аритмии.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении уменьшается действие снотворных препаратов и средств для наркоза.

При одновременном применении возможно усиление действия анальгетиков-антипиретиков, салициламида, напроксена.

При одновременном применении эстрогенов (гормональных контрацептивов, средств для ЗГТ) возможно повышение интенсивности и длительности действия кофеина за счет ингибирования эстрогенами изофермента CYP1A2.

При одновременном применении аденозина кофеин уменьшает повышенную ЧСС и изменения АД, вызванные инфузией аденозина; уменьшает вазодилатацию, обусловленную действием аденозина.

При одновременном применении возможно повышение биодоступности, скорости всасывания и концентрации в плазме крови ацетилсалициловой кислоты.

При одновременном применении мексилетин уменьшает клиренс кофеина и повышает его концентрации в плазме, по-видимому, за счет ингибирования мексилетином метаболизма кофеина в печени.

Метоксален уменьшает выведение кофеина из организма с возможным усилением его эффекта и развитием токсического действия.

Вследствие индукции микросомальных ферментов печени под влиянием фенитоина при его одновременном применении происходит ускорение метаболизма и выведения кофеина.

Флуконазол и тербинафин вызывают умеренное повышение концентрации кофеина в плазме крови, кетоконазол – менее выраженное.

Наиболее выраженные увеличение AUC и уменьшение клиренса наблюдаются при одновременном применении кофеина с эноксацином, ципрофлоксацином, пипемидовой кислотой; менее выраженные изменения – с пефлоксацином, норфлоксацином, флероксацином.

При одновременном применении кофеин ускоряет всасывание эрготамина.

Особые указания и меры предосторожности:

Возможно применение в виде моно- или в составе комбинированной терапии.

Применение в пожилом возрасте

Противопоказан в старческом возрасте.

Источник: http://drugs.thead.ru/Kofein