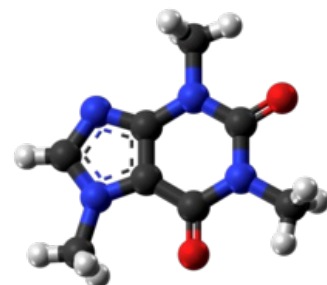


Kofein

Kofein neboli 1, 3, 7-trimethylxantin je purinový alkaloid, patřící do skupiny methylxantinů. Ovlivňuje funkce kardiovaskulárního, respiračního, renálního a nervového systému. Má několik mechanismů účinku. Kofein patří mezi **nejrozšířenější a nejužívanější** stimulanty na světě. Jeho zdrojem jsou kávové a kakaové boby, listy čajovníku či bobule guarany, kola lesklá (popř. kola pravá), cesmína paraguayská a několik dalších rostlin.

Chemické vlastnosti

- Sumární vzorec: $C_8H_{10}N_4O_2$
- Molární hmotnost: 194,19 g/mol
- Teplota tání: 235-238 °C
- Hustota: 1,2 g/cm³
- UV maximum: 275 nm
- Biologický poločas (v plazmě): 3-7 hodin
- Celková plazmatická clearance: 0,078 L/h/kg
- Vlastnosti: bílý krystal nebo prášek, bez zápachu, lehce hořká chuť. ^[1]

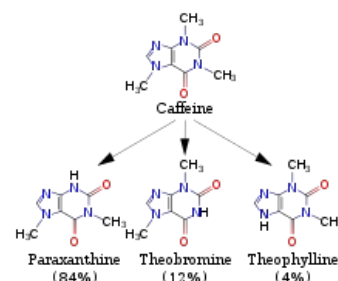


Molekula kofeinu

Metabolismus kofeinu

Asi 99% je absorbováno během trávení v průběhu **prvních 45 minut**. Pokud se do těla dostane v podobě nápojů, probíhá absorpce v GIT (žaludek a tenké střevo) a je distribuován pomocí tělních tekutin. V případě žvýkání různých rostlinných lístků je absorpce rychlejší a probíhá již v oblasti ústní sliznice. ^[2] Reverzibilně se váže na plazmatické proteiny (cca 10-30 %). Kofein je resorbován v renálních tubulech, většina je filtrována glomerulem a pouze malé procento je vyloučeno močí v nezměněné podobě.

Samotný metabolismus kofeinu probíhá **v játrech**. Podílí se na něm mnoho enzymatických systémů, především enzymy **cytochromu P450** (formou N-demethylace), N-acetyltransferáza (NAT), xantinoxidáza (XO) aj. Demethylací a oxidací vznikají **3 nejdůležitější metabolity** kofeinu:



Metabolity kofeinu

- paraxantin** je produktem metabolismu zhruba 80-85% celkového objemu kofeinu; jeho působením dochází ke zvýšení lipolýzy, která vede ke zvýšení plazmatických koncentrací glycerolu a volných mastných kyselin;
- teobromin**: asi 12% z celkového objemu kofeinu; dilatuje cévy a zvyšuje objem moči;
- teofylin**: asi 4% z celkového objemu kofeinu a jeho působením dochází k relaxaci hladkého svalstva v bronchu. ^[3]

Mechanismus účinku

Bylo popsáno několik metabolických cest, skrze které kofein účinkuje. Nejzásadnější jsou však dvě: inhibice fosfodiesterázy a antagonismus adenosinových receptorů. Dále sem patří také uvolňování kalcia z intracelulárních zásob či antagonismus benzodiazepinových receptorů.

1. **Inhibice fosfodiesterázy**: Kofein inhibuje fosfodiesterázu (enzym, který katalyzuje hydrolýzu cAMP), což vede ke zvýšení koncentrace cAMP. Tím kofein nepřímo ovlivňuje regulaci cAMP-dependentních proteinových kináz, které jsou zodpovědné za regulaci glykogenu, cukrů a metabolismu lipidů. Aktivací hormon-citlivých lipáz dochází ke zvýšené lipolýze, která se projevuje zvýšením plazmatických hladin volných mastných kyselin a glycerolu. Dochází rovněž ke zvýšenému uvolňování katecholaminů.

2. **Antagonismus adenosinových receptorů**: Velký vliv na behaviorální a kognitivní funkce. Kofein se nespécificky váže na adenosinové receptory. Buňky jsou pak vůči adenosinu "slepé". Pokud se naváže adenosin na své receptory, působí jako inhibitor nervových signálů, což vede k ospalosti, malátnosti a zapříčiňuje usínání. Dále adenosin dilatuje krevní cévy mozku. Navázáním kofeinu a paraxantinu na adenosinové receptory dochází k opačným reakcím: zrychlení nervových signálů, pocit bdělosti a konstrikce mozkových cév. ^[4]

Účinky

- Zrychlení psychomotoriky
- Zmírnění únavy
- Palpitace
- Zlepšení koncentrace a paměti
- Větší využití tuků jako zdroje energie
- Diuretický účinek

Při vyšších dávkách se může objevit tachykardie, hypertenze, nauzea, úzkost, neschopnost se soustředit, tremor, či mimovolní svalové záškuby.

Závislost

Kofein patří mezi **nejméně návykové** drogy, přesto jeho nadužívání může způsobit závislost. Jeho užívání je však poměrně bezpečné, neboť letální dávka se u zdravého jedince pohybuje okolo 10 gramů (asi 100 šálků kávy). V případě snížení příjmu kofeinu nebo jeho vysazení po dlouhodobém pravidelném užívání vyšších dávek může dojít k **abstinenčním příznakům**. Ty nebývají silné, patří mezi ně podrážděnost, únava, dysforie. V průběhu 2–3 dnů odeznívají. Za relativně bezpečnou dávku se považuje asi 300 mg kofeinu (3 šálky kávy).

Odkazy

Související články

- Návykové látky
- Abúzus návykových látek

Reference

1. UNIVERSITY OF DELAWARE,. *The Chemistry of Caffeine* [online]. [cit. 2013-04-19]. <<http://www1.udel.edu/chem/C465/senior/fall00/Caffeine/Chemistry.htm>>.
2. REISBERG, Paul. *Caffeine* [online]. ©September 23, 1997. Poslední revize November 16, 1998, [cit. 2013-04-19]. <<http://academics.wellesley.edu/Chemistry/Chem101/caffeine/caffeine.html>>.
3. KOLLMORGEN, Danielle. *Effects of caffein : Metabolism of caffein* [online]. University of Delaware, ©2011. [cit. 2013-04-19]. <<http://udel.edu/~danikoll/metabolism.html>>.
4. NATIONAL ACADEMY OF SCIENCES,. *Caffeine for the Sustainment of Mental Task Performance* [online]. The National Academies Press, ©2001. [cit. 2013-04-19]. <<https://www.nap.edu/read/10219/page/R1>>.