

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Никоретте® (Nicorette®)

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Никоретте® (Nicorette®)

Международное непатентованное название: никотин

Химическое название: 3-[(2S)-1-метилпирролидин-2-ил]пиридин

Лекарственная форма: спрей для местного применения дозированный

Описание: от бесцветного до светло-желтого цвета прозрачный или слегка опалесцирующий раствор с запахом мяты.

Состав:

1 мл препарата содержит:

Действующее вещество: никотин - 13,6 мг/мл;

Вспомогательные вещества: пропиленгликоль - 150,0 мг/мл, этанол - 97,0 мг/мл, трометамол - 40,5 мг/мл, полоксамер - 40,0 мг/мл, глицерол - 25,0 мг/мл, натрия гидрокарбонат - 14,3 мг/мл, левоментол - 10,0 мг/мл, ароматизатор мятный QL24245 - 4,0 мг/мл, ароматизатор Cooler 2 SN046680 - 3,0 мг/мл, сукралоза - 1,5 мг/мл, ацесульфам калия - 1,5 мг/мл, хлористоводородная кислота 10 % - достаточное количество до pH 9, вода - достаточное количество до 1 мл.

Фармакотерапевтическая группа: средство для лечения никотиновой зависимости.

Код АТХ: N07BA01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Никотин является агонистом никотиновых рецепторов в периферической и центральной нервной системе (ЦНС), оказывает выраженное влияние на ЦНС и сердечно-сосудистую систему.

Клинические исследования показали, что препараты для заместительной никотиновой терапии позволяют курильщикам воздержаться от курения, облегчая

симптомы «отмены». По сравнению с никотиновой резинкой жевательной или таблетками для рассасывания, абсорбция никотина из спрея для местного применения более быстрая (см. раздел «Фармакокинетика») и, основываясь на накопленном опыте применения заместительной никотиновой терапии, это приводит к более быстрому снижению тяги и других симптомов.

Повышение аппетита является общеизвестным симптомом «отмены» никотина, часто после прекращения курения происходит увеличение массы тела.

Фармакокинетика

Фармакокинетика никотина всесторонне изучена; было установлено, что способ доставки вещества в организм оказывает существенное влияние на скорость и степень всасывания.

Фармакокинетика спрея для местного применения изучена в четырех исследованиях, включавших 141 субъект.

Всасывание

Лекарственная форма спрей для местного применения предполагает, что доза никотина поступает немедленно и, как следствие, его абсорбция из полости рта быстрая: согласно исследованиям всасывание никотина из спрея для местного применения происходило через 2 мин (в первую временную точку).

Максимальная концентрация, равная 5,3 нг/мл, достигается в течение 13 мин после введения 2 мг никотина. Спустя 10 мин после применения спрея в дозах 1 и 2 мг площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) превышала аналогичные значения, полученные в исследованиях жевательной резинки и таблеток, содержащих 4 мг никотина (0,48 и 0,64 чхнг/мл в сравнении с 0,33 и 0,33 чхнг/мл).

Значения AUC_{∞} свидетельствуют, что биодоступность никотина при применении спрея местно несколько выше, чем при применении никотиновой жевательной резинки или таблеток. AUC_{∞} для спрея дозировкой 2 мг равнялась 14,0 чхнг/мл по сравнению с 23,0 чхнг/мл для жевательной резинки дозировкой 4 мг и 26,7 чхнг/мл для таблеток дозировкой 4 мг.

Средняя равновесная концентрация никотина в плазме крови, достигавшаяся после введения максимальной дозы (т. е. 2 впрыскивания спрея в дозе 1 мг каждые 30 мин), примерно равнялась 28,8 нг/мл по сравнению с 23,3 нг/мл при применении

жевательной резинки дозировкой 4 мг (1 подушечка каждый час) и 25,5 нг/мл для таблеток никотина дозировкой 4 мг (1 таблетка каждый час).

Принимая во внимание быстрое всасывание и сходную высокую относительную биодоступность, большая часть никотина, высвобождаемого из спрея, всасывается, очевидно, через слизистую оболочку щек.

Распределение

Объем распределения после внутривенного введения никотина составляет от 2–3 л/кг.

Связывание никотина с белками плазмы крови составляет менее 5%. По этой причине, изменения связывания никотина при применении сопутствующих препаратов или изменения содержания белков плазмы крови при ряде заболеваний предположительно не должны оказывать существенного влияния на фармакокинетику никотина.

Биотрансформация

Метаболизм и выведение никотина не зависят от лекарственной формы, и поэтому для их описания подходят результаты исследования никотина при внутривенном введении.

Основным органом, элиминирующим никотин, является печень. Тем не менее, никотин также метаболизируется в почках и легких. Известно более 20 метаболитов никотина, при этом все они, по-видимому, менее активны по сравнению с исходным соединением.

Плазменный период полувыведения основного метаболита никотина - котинина - равен 15–20 ч, а его концентрация превышает таковую для никотина в 10 раз.

Выведение

Средний плазменный клиренс никотина равен 70 л/час, период полувыведения составляет 2–3 ч.

Основными метаболитами никотина, обнаруживаемыми в моче, являются котинин (12% введенной дозы) и транс-3-гидроксикотинин (37% введенной дозы). Примерно 10% никотина выводится с мочой в неизменном виде. При высокой скорости фильтрации и pH мочи ниже 5 с мочой может выводиться до 30% неизменного никотина.

Линейность/нелинейность

При 1, 2, 3 и 4 нажатиях спрея с дозировкой 1 мг/доза выявлено лишь незначительное отклонение от линейности AUC_{∞} и C_{\max} .

Особые группы пациентов

Нарушение функции почек

Прогрессирование почечной недостаточности сопровождается снижением общего клиренса никотина. Клиренс никотина у пациентов с тяжелым нарушением функции почек снижен в среднем на 50%. У пациентов на гемодиализе отмечалось увеличение концентрации никотина.

Нарушение функции печени

Фармакокинетика никотина у пациентов с легким нарушением функции печени (5 баллов по шкале Чайлд-Пью) не изменялась, но при наличии нарушения функции печени средней степени (7 баллов по шкале Чайлд-Пью) снижалась на 40–50%. Данные о фармакокинетике никотина при нарушении функции печени более 7 баллов по шкале Чайлд-Пью отсутствуют.

Пожилые пациенты

У здоровых пациентов пожилого возраста отмечено небольшое снижение общего клиренса никотина, не требующее изменения дозы препарата.

Показания к применению

Спрей Никоретте® облегчает и (или) предотвращает тягу к курению и симптомы «отмены», возникающие при табачной зависимости. Показан в качестве поддержки курильщикам, намеренным бросить курить или снизить количество выкуриваемых сигарет перед полным отказом; в целях содействия курильщикам, не желающим курить или в отсутствие такой возможности; а также в качестве более безопасной альтернативы курению курильщикам и лицам их окружающим.

Спрей Никоретте® показан беременным и кормящим женщинам, пытающимся бросить курить.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к никотину или другим компонентам препарата.
- Детский возраст до 18 лет.

Беременность и период кормления грудью

Беременность

Отказ от курения является единственным наиболее эффективным вмешательством для улучшения состояния здоровья как беременной женщины, так и ее ребенка. Ранний отказ от курения является наилучшим вариантом. В идеале отказ от курения во время беременности должен осуществляться без заместительной никотиновой терапии (ЗНТ). Однако если женщина не в состоянии (или это предполагается) отказаться от курения без фармакологической поддержки, применяют ЗНТ, поскольку риск для плода меньше, чем при курении табака. Наилучшим вариантом является полный отказ от курения, но, если он недостижим, в качестве более безопасной альтернативы курению во время беременности можно применять спрей Никоретте®. В силу наличия потенциальных безникотиновых периодов, предпочтительны лекарственные формы для периодического применения, однако при значительной тошноте и (или) рвоте могут потребоваться пластыри.

Грудное вскармливание

Относительно небольшие количества никотина, обнаруживаемые в грудном молоке при ЗНТ, менее вредны для ребенка, чем пассивное курение. Лекарственные формы для периодического применения минимизируют содержание никотина в грудном молоке и позволяют осуществлять грудное вскармливание при наименьшей концентрации никотина в нем.

Способ применения и дозы

Местно, для полости рта.

Пациент должен сделать все возможное, чтобы окончательно бросить курить при лечении спреем Никоретте®.

Поведенческая терапия, консультирование и поддержка, как правило, повышают успешность терапии.

Взрослые и подростки старше 18 лет

Спрей Никоретте® следует применять в тот момент, когда возникает непреодолимое желание закурить. После заправки контейнера поднесите наконечник спрея как можно ближе к открытому рту. Нажмите на дозатор сверху, высвободив таким образом одну дозу препарата в полость рта; следует избегать попадания спрея на губы. Чтобы исключить попадание вещества в дыхательные пути, в момент нажатия на дозатор не следует совершать вдох. Для достижения наилучших результатов не сглатывайте слюну в течение нескольких секунд после впрыскивания.

Во время использования спрея прием пищи и жидкости не рекомендуется.

Сделайте 1 или 2 впрыскивания в период времени, когда обычно вы выкуривали сигарету, а также в случае появления тяги к курению. Если после однократного впрыскивания тяга к курению в течение нескольких минут не снижается, следует произвести второе впрыскивание. Если требуются две дозы, то последующее применение спрея может состоять из 2 последовательных впрыскиваний.

Большинству курильщиков требуется применение 1–2 доз спрея каждые 0,5–1 ч.

Каждый час разрешается принимать не более 4 дозированных впрыскиваний спрея. Не следует впрыскивать более 2 доз спрея одновременно или применять более 64 доз в течение суток (или 4 дозы в час в течение 16 часов).

Каждый флакон содержит не менее 150 впрысков.

Спрей Никоретте® следует использовать во всех случаях возникновения тяги к курению или для недопущения тяги в ситуациях, которые могут ее провоцировать.

Курильщики, желающие или способные отказаться от курения немедленно, должны сразу заменить выкуривание сигарет спреем Никоретте® и, как только представится возможность, снизить количество впрыскиваний до их полного прекращения.

Курильщикам, желающим снизить количество выкуриваемых сигарет, следует применять спрей для местного применения по потребности между эпизодами курения в целях увеличения промежутков времени между курением и с целью как можно большего снижения курения.

Как только чувствуется готовность, курильщики должны нацелиться на полный отказ от курения.

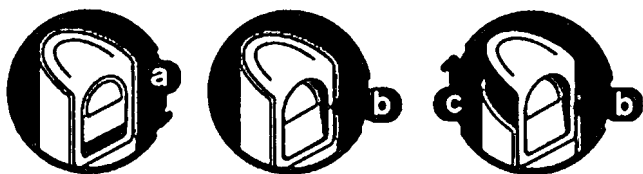
Поведенческая терапия, консультирование и поддержка, как правило, повышают успешность терапии. Тем, кому удалось бросить курить, но сложно отказаться от спрея для местного применения, рекомендуется обратиться к врачу за медицинской помощью.

Подростки младше 18 лет

Не рекомендуется применять препарат лицам младше 18 лет. Опыт лечения подростков в возрасте до 18 лет спреем отсутствует.

Инструкция по использованию

Как открыть дозатор спрея/разблокировать насадку



1. Большим пальцем плавно опустите вниз кнопку дозатора, как показано на рисунке (а) до возможности нажатия кнопки внутрь (см. рис. b).
2. Во время нажатия на кнопку поднимите вверх дозатор, как показано на рисунке (с). Отпустите кнопку.

Первое применение спрея



При применении спрея впервые вы должны проверить работу распылителя. Возьмите флакон таким образом, чтобы струя была направлена на расстоянии от вас, других людей, детей и домашних животных. Откройте распылитель спрея и нажмите 3 раза до появления мелких брызг.

Если вы не используете спрей в течение 2 дней, необходимо проделать эту процедуру повторно.

Как применять спрей Никоретте®



1. Поднесите флакон распылителем к открытому рту и держите настолько близко, насколько это возможно.
2. Нажмите на дозатор, чтобы выпустить дозу спрея в ротовую полость. Распыляя, избегайте попадания спрея на заднюю стенку глотки и губы.

Не вдыхайте спрей во время впрыскивания, чтобы не допустить его проглатывания. Для достижения лучшего результата не сглатывайте в течение нескольких секунд после распыления.

Как закрыть дозатор спрея/заблокировать насадку



1. Плавно опустите вниз кнопку дозатора, как показано на рисунке (d) до возможности нажатия кнопки внутрь (e).
2. Нажмите на кнопку дозатора (e) и опустите дозатор вниз (f). Затем отпустите кнопку. Теперь спрей закрыт.

При следующем применении повторите вышеизложенные шаги.

Закрывайте флакон спрея каждый раз после применения, чтобы предотвратить использование спрея детьми или случайное распыление.

Если спрей случайно попал в глаза, промойте глаза водой.

Побочное действие

Некоторые симптомы могут быть обусловлены отменой никотина вследствие прекращения курения. К ним относятся: дисфория или подавленное настроение; бессонница; раздражительность, недовольство или гневливость; тревога; затруднение концентрации внимания, беспокойство или нетерпеливость; снижение частоты сердечных сокращений; повышение аппетита или увеличение массы тела. Они выявлялись у пациентов, применяющих спрей для местного применения.

После прекращения курения также может повышаться частота афтозных язв, кашля и назофарингита. Причинно-следственная связь не установлена.

Помимо этого, у лиц, использующих спрей для местного применения, также отмечались другие симптомы, ассоциированные с прекращением курения: головокружение, пресинкопальные состояния, кашель, запор и кровоточивость десен.

Тяга к никотину, рассматриваемая в качестве клинически значимого симптома, - важное проявление отмены никотина после прекращения курения.

Спрей Никоретте® может вызывать нежелательные реакции, связанные с никотином, сходные с наблюдаемыми при применении других никотинсодержащих препаратов, эти реакции носят преимущественно дозозависимый характер.

Большинство нежелательных реакций на спрей Никоретте® отмечались в раннюю фазу лечения и схожи с таковыми для препаратов, принимаемых внутрь. В первые несколько дней лечения может наблюдаться раздражение слизистой оболочки полости рта и глотки, часто встречается икота. Продолжение лечения приводит к адаптации.

Ежедневный сбор данных у субъектов исследования показал, что очень часто возникающие нежелательные явления проявляются в первые 2–3 недели применения спрея и впоследствии исчезают.

Нежелательные явления, зарегистрированные в клинических исследованиях спрея Никоретте®, включают:

Очень частые ($\geq 1/10$); частые ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечастые ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редкие ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редкие ($< 1/10000$); неизвестно (оценка на основании имеющихся данных невозможна).

Органы и системы	Частота	Нежелательные явления
Нарушения со стороны нервной системы:	Очень частые: Частые: Нечастые:	Головная боль, изменение вкуса Головокружение Парестезия
Нарушения со стороны нервной системы:	Нечастые:	Слезотечение

стороны органа зрения	Неизвестно:	Нечеткость зрения
Нарушения стороны сердца	со Нечастые: Неизвестно:	Ощущение сердцебиения Фибрилляция предсердий
Нарушения стороны сосудов	со Нечастые:	Приливы
Нарушения стороны дыхательной системы и органов средостения:	со Очень частые: Нечастые:	Икота Ринорея, одышка, бронхоспазм, чихание, заложенность носа
Нарушения стороны пищеварительной системы:	со Очень частые: Частые: Нечастые:	Тошнота, диспепсия Рвота, вздутие, боль в животе, диарея Гингивит, глоссит
Нарушения стороны кожи и подкожной клетчатки	со Нечастые:	Сухость кожи, потливость, сыпь, крапивница, зуд
Нарушения иммунной системы	Нечастые:	Повышенная чувствительность
Нарушения стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани	со Нечастые:	Костно-мышечные боли
Системные нарушения осложнения в месте введения	Очень частые: Нечастые:	Боль в мягких тканях полости рта и парестезии, стоматит, гиперсекреция слюны, жжение губ, сухость во рту и (или) глотке Чувство сдавливания в глотке, усталость,

боль в грудной клетке, дискомфорт в грудной клетке, зубная боль, отслоение слизистой оболочки ротовой полости, изменения голоса

Передозировка

При применении в соответствии с инструкцией по применению симптомы передозировки никотином могут возникать у пациентов с низким поступлением никотина до лечения или при одновременном использовании различных источников никотина.

Симптомы

Минимальная летальная доза при острой передозировке для непривыкшего взрослого человека составляет 40–60 мг никотина. При передозировке отмечаются те же симптомы, что и при остром отравлении никотином, а именно: тошнота, рвота, повышенное слюноотделение, боль в животе, диарея, потливость, головная боль, головокружение, нарушение слуха и выраженная общая слабость. При более высоких дозах к ним могут присоединиться артериальная гипотензия, слабый и неритмичный пульс, нарушение дыхания, нарушение сознания, коллапс и генерализованные судороги.

Дозы никотина, которые хорошо переносятся в ходе лечения взрослыми курильщиками, могут вызвать симптомы тяжелого отравления у маленьких детей и даже привести к летальному исходу. Подозрение на отравление никотином у детей должно расцениваться как неотложное состояние, требующее немедленной госпитализации.

Лечение

Следует немедленно прекратить применение никотина и начать симптоматическое лечение. При необходимости следует начать искусственную вентиляцию легких. Прием активированного угля препятствует всасыванию никотина в желудочно-кишечном тракте.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Четкого клинически значимого взаимодействия между заместительной никотиновой терапией и другими препаратами не установлено. Тем не менее, теоретически, никотин может усиливать гемодинамические эффекты аденозина, т. е. приводить к повышению артериального давления и частоты сердечных сокращений, а также усиливать ответ на боль (боли в грудной клетке по типу стенокардии), провоцируемый введением аденозина.

Особые указания и меры предосторожности при использовании

Любые риски, которые присущи ЗНТ, существенно перевешивают доказанный вред, наносимый курением.

Сопутствующие сердечно-сосудистые заболевания

При стабильном течении сердечно-сосудистых заболеваний спрей Никоретте® причиняет меньший вред, чем продолжение курения. Однако курильщикам с недавно перенесенным инфарктом миокарда, нестабильной стенокардией или ухудшением ее течения, включая стенокардию Принцметала, с тяжелой аритмией, недавно перенесшим цереброваскулярные заболевания и (или) пациентам с нестабильной гемодинамикой следует рекомендовать прекратить курение без помощи фармакологического вмешательства. Если такие попытки безрезультатны, можно рассмотреть вопрос о применении спрея Никоретте®, однако, поскольку данные по безопасности у этой категории пациентов ограничены, начинать подобное лечение следует только под строгим медицинским наблюдением.

Сахарный диабет

Пациентам с сахарным диабетом после прекращения курения и с момента начала ЗНТ рекомендуется более тщательно контролировать концентрацию глюкозы в крови, поскольку снижение содержания катехоламинов, высвобождение которых индуцировано никотином, может повлиять на метаболизм углеводов.

Заболевания желудочно-кишечного тракта

Проглатываемый никотин может обострять симптомы эзофагита, гастрита или пептической язвы, поэтому применять препараты для пероральной ЗНТ при указанной патологии следует с осторожностью.

Нарушение функций печени и почек

У пациентов со средней и тяжелой степенью печеночной недостаточности и (или) тяжелой почечной недостаточностью препарат следует применять с осторожностью, поскольку клиренс никотина и его метаболитов может быть снижен, что может увеличить риск нежелательных явлений.

Опасность для маленьких детей

Дозы никотина, которые легко переносят взрослые курильщики и курильщики-подростки, могут вызвать тяжелую интоксикацию у детей, что может привести к смерти. Важно не оставлять без присмотра препараты, содержащие никотин, поскольку это может повлечь неправильное их применение и проглатывание детьми (см. раздел «Передозировка»).

Феохромоцитома и неконтролируемый гипертиреоз

У пациентов с неконтролируемым гипертиреозом и феохромоцитомой применять препарат надлежит с осторожностью, поскольку никотин вызывает высвобождение катехоламинов.

Формирование зависимости

Может развиваться зависимость от препарата, но она является менее опасной для здоровья и более легко преодолимой, чем зависимость от курения.

Отказ от курения

Полициклические ароматические углеводороды, содержащиеся в табачном дыме, индуцируют метаболизм препаратов, метаболизируемых изоферментом CYP1A2 (и, возможно, CYP1A1). Прекращение курения может вызывать замедление метаболизма и, как следствие, увеличение концентрации этих препаратов в крови. Это имеет потенциальное клиническое значение для препаратов с узким терапевтическим индексом, например, теофиллина, клозапина и ропинирола.

Вспомогательные вещества

Спрей Никоретте® содержит малое количество этанола (спирт) - менее 10 мг на дозу.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Следует принимать во внимание профиль нежелательных реакций препарата (головокружение, изменение поведения и пр.), которые могут ухудшить способность управлять транспортными средствами и работу с механизмами.

Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности - не выбрасывайте его в сточные воды или на улицу! Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду!

Применение Никоретте® сопровождается меньшим риском, чем курение!

Форма выпуска

Спрей для местного применения дозированный 1 мг/доза.

По 13,2 мл (150 доз) спрея в прозрачном флаконе из полиэтилентерефталата, который помещен в непрозрачный защитный футляр из полипропилена.

По 1 или 2 флакона (каждый в защитном футляре) с дозатором, вместе с инструкцией по применению заламинированы в прозрачный контурный пластиковый контейнер.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускается без рецепта.

Производитель

«МакНил АБ», Швеция.

Юридический адрес: McNeil AB, Norrbroplatsen 2, SE-251 09, Helsingborg, Sweden/
«МакНил АБ», Швеция, Хельсингборг, SE-251 09, Норрброплатцен 2.

Организация, принимающая претензии

ООО «Джонсон & Джонсон», Россия

121614, г. Москва, ул. Крылатская, д. 17, стр. 2, тел. (495) 726-55-55.

Специалист по регистрации
ООО «Джонсон & Джонсон»



Денисенко В.В.