ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА НИКОТИНЕЛЛ® (NICOTINELL®)

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Никотинелл®

МНН или группировочное название: никотин

Лекарственная форма: Трансдермальная терапевтическая система (ТТС)

Описание

ТТС 7 мг/сут: круглые пластыри бежевого цвета диаметром около 36 мм. На пластырь нанесена маркировка CG CWC. Защитный слой прямоугольный блестящий с обеих сторон, с надрезом около 5 мм от одного из краев.

ТТС 14 мг/сут: круглые пластыри бежевого цвета диаметром около 51 мм. На пластырь нанесена маркировка CG FEF. Защитный слой прямоугольный блестящий с обеих сторон, с надрезом около 5 мм от одного из краев.

ТТС 21 мг/сут: круглые пластыри бежевого цвета диаметром около 62 мм. На пластырь нанесена маркировка CG EME. Защитный слой прямоугольный блестящий с обеих сторон, с надрезом около 5 мм от одного из краев.

Состав

Каждая ТТС 7 мг/сутки (пластырь 10 см ^{2}, № 3) содержит:
Активное вещество: никотин 17,5 мг. Среднее количество никотина, высвобождающегося в кожу, составляет 7 мг в течение 24 ч.
Каждая ТТС 14 мг/сутки (пластырь 20 см ^{2}, № 2) содержит:
Активное вещество: никотин 35 мг. Среднее количество никотина, высвобождающегося в кожу, составляет 14 мг в течение 24 ч.
Каждая ТТС 21 мг/сутки (пластырь 30 см ^{2}, № 1) содержит:
Активное вещество: никотин 52,5 мг. Среднее количество никотина, высвобождающегося в кожу, составляет 21 мг в течение 24 ч.
Вспомогательные вещества: метакриловой кислоты и метилметакрилата сополимер, фольга полиэстровая с алюминиевым покрытием, Матрикс, слой 3: Дуро-Так® 387 - 2516, метакриловой кислоты и метилметакрилата сополимер, триглецириды среднецепочные (Миглиол 812); подложка - бумага (26 г/м^2), матрикс слои 1 и 2: Дуро-Так® 387-2516, метакриловой кислоты и метилметакрилата сополимер, триглецириды среднецепочные (Миглиол 812); адгезивный слой: Дуро-Так® 387 - 2516, триглецириды среднецепочные (Миглиол 812); высвобождающий слой - пленка полиэстерная, покрытая силиконом, с алюминием на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа средство для лечения никотиновой зависимости.

Код АТХ: N07BA01

Фармакологические свойства

Н-холиностимулятор, снижает влечение к курению. Позволяет избежать развития синдрома "отмены" у лиц, бросивших курить, который выражается в выраженном влечении к курению, дисфории, раздражительности, фрустрации, беспокойстве, возбудимости, повышении аппетита или увеличении веса. Содержащийся в пластырях никотин замещает часть никотина, поступавшего в организм при курении, и уменьшает остроту синдрома «отмены», а также снижает тягу к курению.

Фармакокинетика

Абсорбция:

Никотин быстро всасывается через кожу и слизистые. В препарате Никотинелл® ТТС никотин присутствует в свободной форме. Никотин абсорбируется постоянно на протяжении всего периода ношения пластыря с момента его аппликации.

Распределение:

Никотин распределяется по всему организму, объем распределения составляет примерно 180 л. Никотин проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, а также попадает в грудное молоко. Никотин имеет очень низкий уровень связывания с белками плазмы (менее 5 %), плазматический клиренс составляет 0,92-2,43 л/мин.

У здоровых курильщиков, не употребляющих табак (использующих пластыри для прекращения курения), после одной аппликации пластыря Никотинелл® после исходной 1-2 ч задержки наблюдается постепенное увеличение концентрации никотина в плазме крови. Концентрации никотина в плазме выравнивается спустя 8-10 ч после аппликации.

Пик концентрации никотина в плазме крови после аппликации Никотинелл® ТТС № 1 достигает 12,3 нг/мл. Устойчивая концентрация в плазме крови C_{max} после повторной аппликации Никотинелл® ТТС составляет 12 нг/мл (ТТС № 2), 17,7 нг/мл (ТТС № 1); минимальные концентрации составляют - 7,1 нг/мл (ТТС № 2) и 10,3 нг/мл (ТТС № 1).

Фармакокинетические данные демонстрируют линейную зависимость между площадью под кривыми плазменной концентрации ($AUC_{0-24\,h}$) и вводимой дозой (в зависимости от размера пластыря).

Концентрации никотина в плазме крови находится в диапазоне, который обычно наблюдается при умеренном курении, т.е. при выкуривании 1 сигареты в час.

Плазменные концентрации никотина медленно снижаются после удаления ТТС – около 10 % от общего объема никотина, поступающего в кровоток, высвобождается из депо кожи, образующихся во время аппликации пластыря.

- Метаболизм:

Никотин выводится в основном печенью. Основными метаболитами являются котинин и никотин-1`--N-оксид. Большая часть котинина подвергается повторному метаболизму, его метаболиты фармакологически неактивны.

Выведение:

Период полувыведения никотина - около 2 ч, клиренс из плазмы крови – 0,92 – 2,43 л/мин.

Через почки в неизмененном виде выводится лишь незначительное количество никотина.

Экскреция почками неизмененного никотина (5-10 % от общего количества) является pH-зависимым процессом. При щелочных значениях pH уровень экскреции невысок. Кумуляция вещества весьма незначительна.
Отмечалось повышение концентрации котинина в плазме крови у курильщиков с нарушением функции печени и почек.

Показания к применению
Лечение никотиновой зависимости. Облегчение симптомов, возникающих на фоне отказа от курения.

Противопоказания
Повышенная чувствительность кожи к никотину или одному из компонентов, входящих в состав препарат, вазоспастическая стенокардия, острый инфаркт миокарда, аритмия, недавно перенесенный инсульт, беременность и период лактации.
Препарат противопоказан некурящим, детям и подросткам.
Допускается применение пластыря Никотинелл® по рекомендации врача для лечения подростков в тех случаях, когда наблюдается выраженная никотиновая зависимость.
С осторожностью: тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы или госпитализация в предшествующие 4 недели (инсульт, инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, аритмия, операция аорто-коронарного шунтирования или ангиопластика), недостаточность периферического кровообращения, нарушение функции почек, сахарный диабет, неконтролируемая артериальная гипертензия, феохромоцитома, гипертиреоз, язва желудка.

Беременность и лактация
Беременным рекомендуется полный отказ от курения без применения никотин-заместительной терапии.
Никотин, поступающий в организм беременной, в любой форме (сигареты, препараты никотин-заместительной терапии и т.д.) может оказывать отрицательное воздействие на плод. Отказ от табака при помощи никотин-заместительной терапии может осуществляться только по строгим показаниям и непосредственно под контролем врача после оценки соотношения риск/польза.
Лактация
Никотин выделяется в грудное молоко в количествах, способных оказывать эффект на новорожденного. Поэтому в период лактации не рекомендуется применение пластырей Никотинелл®.
Применение пластырей Никотинелл® в период лактации проводят только по строгим показаниям и непосредственно под контролем врача после оценки соотношения риск/польза.

Дети и подростки:
Опыт применения Никотинелл® для лечения подростков в возрасте до 18 лет отсутствует.
Однако в случае острой необходимости препарат может применяться у подростков только при выраженной никотиновой зависимости и только по рекомендации врача.

Способ применения и дозы

Трансдермально (аппликация пластыря).

Никотинелл® предназначен для применения у взрослых (в исключительных случаях – у подростков, см. раздел «Противопоказания»).

Перед началом лечения необходимо полностью отказаться от курения.

Следует использовать только один пластырь в течение суток, наклеивая его на поверхность кожи.

Количество никотина, высвобождающегося из пластыря Никотинелл® на $см^2$ кожи, постоянно, таким образом, абсорбируемая доза зависит от размера площади, находящейся в непосредственном контакте с пластырем. Пластырь следует наклеивать на различные участки кожи, чтобы избежать локального раздражения.

Существующие формы выпуска пластыря Никотинелл® высвобождают 21 мг никотина в сутки (№ 1), 14 мг никотина в сутки (№ 2) и 7 мг никотина в сутки (№ 3). Не следует уменьшать дозу, обрезая пластырь.

Никотинелл® № 1 обычно применяют для лечения курильщиков с выраженной никотиновой зависимостью (т.е. выкуривающим более 20 сигарет в день). Никотинелл® № 2 эффективен у курильщиков с умеренно выраженной никотиновой зависимостью (выкуривающих менее 20 сигарет в день).

Никотинелл® № 3 предназначен для применения на заключительном этапе лечения (в течение последнего месяца) для постепенного снижения дозы никотин-заместительной терапии.

Продолжительность курса лечения

Лечение начинают с максимальной или промежуточной дозы (Никотинелл® № 1 или № 2) и затем постепенно снижают. Исходная дозировка может быть скорректирована через несколько дней в зависимости от реакции организма.

Лечение курильщиков с выраженной никотиновой зависимостью начинают с применения Никотинелл® № 1, далее переводят на Никотинелл® № 2 и заканчивают курс применением Никотинелл® № 3, используя каждую дозировку примерно в течение месяца.

Лечение умеренно курящих начинают с применения Никотинелл® № 2 в течение примерно восьми недель, затем переходят на Никотинелл® № 3, который применяют в течение четырех недель. Очень важно, чтобы во время лечения не использовалась более высокая дозировка, чем требуется пациенту.

Длительность курса лечения не должна превышать 3 месяца.

Способ применения

Удалить защитный слой и наклеить пластырь на чистую, сухую, неповрежденную кожу без волосяного покрова, на груди или на руке. Место, на которое будет наклеен пластырь, не должно быть покрыто лосьоном, кремом для бритья, парфюмерией, кремом и т.п. Пластырь прижать ладонью и держать примерно в течение 10 секунд. Каждый день следует наклеивать пластырь на новый участок кожи.

Если, пройдя курс никотин-заместительной терапии в соответствии с рекомендуемым способом применения при помощи пластырей Никотинелл®, вы не бросили курить, то необходимо прекратить применение препарата. Вы можете повторить попытку бросить курить при помощи пластырей Никотинелл® позже.

Побочное действие

Никотинелл® ТТС может приводить к развитию побочных реакций подобных тем, которые могут возникать при курении. Кроме того, вдыхание сигаретного дыма кроме попадания никотина в организм влечет за собой дополнительный риск, связанный с известными вредными эффектами окиси углерода. Пластыри Никотинелл® индуцируют значительно более низкие уровни концентрации никотина в плазме крови, чем это происходит при курении сигарет, сигар и трубки, поэтому при использовании пластырей Никотинелл® побочные эффекты проявляется в значительно менее выраженной форме. Побочные эффекты никотина могут развиваться более часто и проявляться более интенсивно у тех, кто продолжает курить, несмотря на использование пластырей Никотинелл®.

В клинических исследованиях были зарегистрированы следующие побочные эффекты после применения пластырей:

Центральная нервная система:

Часто: головная боль, головокружение, тошнота, бессонница, тревожные состояния.

Редко: снижение концентрации внимания, яркие сновидения, астения, спутанность сознания, мигрень, потливость, двигательные нарушения.

Сердечно-сосудистая система:

Редко: увеличение частоты сердечных сокращений, аритмия, артериальная гипертензия; боль в груди.

У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями может наблюдаться прогрессирование симптоматики и/или развитие нарушения периферического кровообращения (перемежающаяся хромота).

Пищеварительная система:

Редко: сухость во рту, повышение аппетита, боли в животе, диспепсия, рвота, язва желудка, метеоризм, боль при глотании.

Кожа:

Часто: незначительное покраснение и зуд, эритема в тяжелой форме, обратимая после снятия пластыря, проявляется с увеличивающейся частотой, начиная с третьей недели терапии. Во избежание появления на коже местного раздражения следует каждый день выбирать новое место для аппликации.

Редко: аллергические реакции (сыпь, крапивница, в крайне редких случаях - отек Квинке), простой герпес.

Прочие побочные эффекты:

Часто: гриппоподобные симптомы.

Редко: затрудненное дыхание.

Передозировка

Аппликация нескольких пластырей Никотинелл® может привести к тяжелой передозировке. При этом замедленная абсорбция никотина через кожу обеспечивает продолжительность токсических эффектов.

В случае случайного разжевывания или проглатывания Никотинелл® ТТС это не приведет к быстрому системному выделению никотина, поскольку никотин высвобождается медленно и сразу метаболизируется.

Острая передозировка:
Симптомы передозировки такие же, как при остром отравлении никотином: бледность, потливость, тошнота, повышенное слюноотделение, рвота, кишечные спазмы, диарея, головная боль, головокружение, расстройства зрения и слуха, тремор, спутанность сознания, тахикардия, повышение артериального давления, одышка, мидриаз, мышечная слабость, конвульсии, прострация, исчезновение рефлексов, нарушение дыхания. Смерть наступает в результате остановки дыхания периферического или центрального происхождения, реже - от внезапной остановки сердца.
Хроническая передозировка:
У постоянных курильщиков развивается тахифилаксия, что позволяет им переносить воздействие никотина, которое являлось бы высокотоксичным при острой интоксикации. При хронической передозировке симптомы аналогичные тем, которые отмечаются при острой интоксикации никотином.
Первая помощь:
Немедленно удалить пластырь с кожи, вымыть данный участок кожи водой (мыло не используют), высушить его. Следует учитывать, что никотин будет продолжать высвобождаться в кровоток в течение нескольких часов после удаления ТТС с кожи.
При острой никотиновой интоксикации: неотложная терапия в условиях стационара с использованием симптоматической терапии, в том числе с проведением мероприятий, направленных на поддержание деятельности дыхательной и сердечно-сосудистой систем.
Даже в небольших количествах никотин опасен для детей, поскольку вызывает симптомы отравления вплоть до летального исхода. При случайной передозировке никотином у детей необходима экстренная медицинская помощь.

Взаимодействие
У курильщиков отмечают индукцию ферментных систем, что обусловлено не столько действием собственно никотина, а смолистыми соединениями, присутствующими в табачном дыме. В связи с этим у тех, кто бросает курить, может отмечаться изменение (нормализация) метаболизма, следовательно, может меняться фармакологическая эффективность препаратов, даже на фоне никотин-заместительной терапии в виде пластыря Никотинелл®.
Курение может снижать концентрации лекарственного препарата в крови, это относится к таким препаратам, как феназон, эстрогены, нордазепам, лидокаин, оксазепам, варфарин, фенацетин, кофеин, теофиллин, имипрамин и пентазоцин.
К числу других эффектов, вызываемых курением, относятся: снижение анальгетического эффекта пропоксифена, а также диуретического эффекта фуросемида, изменение фармакологического ответа на пропранолол и изменение скорости заживления язвы под действием блокаторов H_2-гистаминовых рецепторов.
Табачный дым и никотин также могут повышать уровни кортизола и катехоламинов, циркулирующих в организме. Может потребоваться корректировка дозы нифедипина, а также стимуляторов или блокаторов адренергических рецепторов.
При прекращении курения может наблюдаться подавление вышеописанных явлений даже у пациентов, проводящих частичную заместительную терапию при

помощи пластырей Никотинелл®. Назначая терапию с использованием пластырей Никотинелл®, врачи должны оценивать необходимость корректировки дозы вышеуказанных препаратов. Эффект бета-адреноблокаторов может меняться различным образом, поскольку никотин воздействует на различные участки симпатической и парасимпатической нервной системы.

Влияние на способность водить машину или работу с механизмами

Препарат не влияет на способность управлять автомобилем или работу с механизмами, требующими повышенной концентрации внимания. Однако необходимо помнить, что потребность в курении может вызывать изменения в поведении.

Особые указания

Перед началом применения пластырей Никотинелл® следует полностью прекратить курение. Если продолжать курить во время курса лечения Никотинелл® ТТС, то риск развития побочных эффектов и их выраженность возрастают, в том числе побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы.

Никотинелл® ТТС рекомендуется применять в сочетании с другими программами, разработанными в помощь желающим бросить курить. Важную роль в лечении играют личная мотивация и психотерапевтическая помощь. Это позволяет повысить эффективность лечения.

Несовместимость

Локальная толерантность Никотинелла® ТТС: при трансдермальном введении очень важно четко определить разницу между толерантностью кожи к активному компоненту никотину и толерантностью кожи к самой адгезивной системе.

Дети

Никотин является высокотоксичным веществом. Дозы, нормально переносимые взрослыми, проходящими курс лечения, могут привести к сильной интоксикации у детей. В связи с этим пастырь Никотинелл® необходимо хранить в недоступном для детей месте.

Пластыри Никотинелл® упакованы в индивидуальные плотно запаянные пакеты, которые дети не смогут открыть самостоятельно. Перед применением обрежьте ножницами пакет, проследив за тем, чтобы не повредить пластырь, находящийся в нем.

В использованных пластырях тоже содержится никотин, поэтому необходимо следить за тем, чтобы они также не попадали в руки детей.

Аллергические реакции:

У некоторых пациентов во время применения пластырей Никотинелл® наблюдалась гиперчувствительность к никотину. Необходимо помнить, что у таких лиц применение других препаратов, содержащих никотин, а также курение может привести к развитию аллергических реакций.

Для лиц, страдающих хроническими нарушениями сна, допускается удалять пластырь через 16 ч после аппликации.

Форма выпуска

Пластырь площадью 10 $см^2$ (7 мг/сут), 20 $см^2$ (14 мг/сут) или 30 $см^2$ (21 мг/сут) в пакетик многослойный (бумага/алюминий/полиамид/полиакрилонитрил). По 2, 7, 14, 21 и 28 пакетиков вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения
Хранить в сухом месте, при температуре не выше 25 ° С в оригинальной упаковке.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
2 года.
Препарат не следует использовать после даты истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
Без рецепта

Производитель:
«ЛТС Ломанн Терапи-Системе АГ», Германия.
Адрес: Ломаннштрассе 2, D-56626, Андернах, Германия.
LTS Lohmann Therapie-Susteme AG, Germany.
Address: Lohmannstrasse 2, D-56626, Andernach, Germany.
Владелец регистрационного удостоверения:
Новартис Консьюмер Хелс СА, Швейцария

Представительство в Москве/Адрес для предъявления претензий

123317, Москва, Краснопресненская наб. 18, тел. (495) 969-21-65, факс 969-21-66

e-mail: consumerhealth@novartis.ru

И. о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Представитель фирмы С.А. Курашова