

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 100 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 200 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 600 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: ацетилцистеин.

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 100 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
1 пакетик содержит 100 мг ацетилцистеина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сахароза, аспартам (см. раздел 4.3, 4.4).

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 200 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
1 пакетик содержит 200 мг ацетилцистеина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сахароза, аспартам (см. раздел 4.3, 4.4).

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 600 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
1 пакетик содержит 600 мг ацетилцистеина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: сахароза, аспартам (см. раздел 4.3, 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Порошок для приготовления раствора для приема внутрь.

Порошок от белого до белого с желтоватым оттенком цвета с характерным запахом.

Внешний вид раствора препарата: бесцветный или со слегка желтоватым оттенком опалесцирующий раствор с характерным запахом.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 2 лет (дозировка 100 мг), у взрослых и детей в возрасте от 6 лет (дозировка 200 мг), у взрослых и детей в возрасте от 14 лет (дозировка 600 мг):

- острые и хронические заболевания органов дыхания, связанные с образованием вязкого трудноотделяемого бронхиального секрета: бронхит, трахеит, бронхиолит, пневмония, бронхоэктатическая болезнь, муковисцидоз, абсцесс легких, эмфизема легких, ларинготрахеит, интерстициальные заболевания легких, ателектаз легкого (вследствие закупорки бронхов слизистой пробкой);
- катаральный и гнойный отит, гайморит, синусит (облегчение отхождения секрета);
- удаление вязкого секрета из дыхательных путей при посттравматических и послеоперационных состояниях.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

По 1 пакетику (дозировка 600 мг) 1 раз в день или по 1 пакетику (дозировка 200 мг) 3 раза в день.

Максимальная суточная доза – 600 мг.

Дети

Дети старше 14 лет

Режим дозирования аналогичен взрослому.

Дети от 6 до 14 лет

По 1 пакетику 4 раза в день (дозировка 100 мг), либо по 1 пакетику 2 раза в день (дозировка 200 мг).

Максимальная суточная доза – 400 мг.

Дети от 2 до 6 лет

По 1 пакетику 3 раза в день (дозировка 100 мг).

Максимальная суточная доза – 300 мг.

Способ применения

Внутрь.

Препарат следует растворять в 1 стакане воды комнатной температуры и принимать после еды.

Продолжительность курса лечения следует оценивать индивидуально. При острых заболеваниях продолжительность курса лечения составляет от 5 до 10 дней; при лечении хронических заболеваний – до нескольких месяцев (по рекомендации врача).
Дополнительный прием жидкости усиливает муколитический эффект препарата.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к ацетилцистеину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения;
- кровохарканье, легочное кровотечение;
- беременность (см. раздел 4.6);
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6);
- пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат;
- фенилкетонурия;
- детский возраст до 2 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Больным с бронхиальной астмой и обструктивным бронхитом ацетилцистеин следует назначать с осторожностью под систематическим контролем бронхиальной проходимости. Препарат содержит аспартам, его применение противопоказано у больных фенилкетонурией.

Нет ограничений для применения при сахарном диабете, нарушенной толерантности к глюкозе, метаболическом синдроме, ожирении.

Присутствие легкого серного запаха является характерным запахом действующего вещества.

При растворении ацетилцистеина необходимо пользоваться стеклянной посудой, избегать контакта с металлическими и резиновыми поверхностями.

Ацетилцистеин может в незначительной степени влиять на гистаминный метаболизм, поэтому необходимо соблюдать осторожность при применении препарата для долгосрочного лечения пациентов, страдающих непереносимостью гистамина, при проявлении симптомов непереносимости (головная боль, вазомоторный ринит, зуд).

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат Ацетилцистеин ВЕРТЕКС содержит сахарозу. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат. При лечении пациентов с сахарным диабетом необходимо учитывать, что в препарате содержится сахароза (в одном пакетики 100/200/600 мг содержится 0,24/0,23/0,18 ХЕ соответственно).

Лекарственный препарат Ацетилцистеин ВЕРТЕКС содержит аспартам, который содержит источник фенилаланина и может оказаться вредным для людей с фенилкетонурией. Пациентам с фенилкетонурией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

При одновременном применении ацетилцистеина и противокашлевых средств из-за подавления кашлевого рефлекса может возникнуть застой мокроты.

При одновременном применении с такими антибиотиками, как тетрациклины (исключая доксициклин), ампициллин, амфотерицин В, возможно их взаимодействие с тиоловой группой ацетилцистеина, что может привести к снижению активности обоих препаратов.

Поэтому интервал между приемами этих препаратов должен составлять не менее 2 часов.

Совместное применение ацетилцистеина и нитроглицерина может вызвать головную боль и выраженное снижение артериального давления.

Одновременное применение ацетилцистеина и карбамазепина может приводить к субтерапевтическим уровням карбамазепина.

Одновременное применение активированного угля может снизить эффект ацетилцистеина.

Ацетилцистеин устраняет токсические эффекты парацетамола.

Ацетилцистеин может влиять на результаты колориметрического определения салицилатов.

Ацетилцистеин может оказывать влияние на анализ кетонов в моче.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Данные по применению ацетилцистеина при беременности ограничены, поэтому применение препарата при беременности противопоказано.

Лактация

В случае необходимости применения препарата грудное вскармливание следует прекратить.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Данных об отрицательном влиянии ацетилцистеина в рекомендуемых дозах на способность управлять транспортными средствами и выполнять другие виды деятельности, требующие концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, нет.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Классификация частоты развития нежелательных реакций согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто $\geq 1/10$;

часто $\geq 1/100$, но $< 1/10$;

нечасто $\geq 1/1000$, но $< 1/100$;

редко $\geq 1/10000$, но $< 1/1000$;

очень редко $< 1/10000$;

частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы:

нечасто – гиперчувствительность (в том числе ангионевротический отек);

очень редко – анафилактические/анафилактоидные реакции, анафилактический шок.

Нарушения со стороны нервной системы:

нечасто – головная боль.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта:

нечасто – шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца:

нечасто – увеличение частоты сердечных сокращений (тахикардия).

Нарушения со стороны сосудов:

нечасто – снижение артериального давления;

очень редко – кровотечение.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

редко – диспноэ, бронхоспазм.

Желудочно-кишечные нарушения:

нечасто – стоматит, боль в животе, тошнота, рвота, диарея;

редко – диспепсия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – крапивница, кожная сыпь, кожный зуд.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

нечасто – пирексия;

частота неизвестна – отек лица.

В очень редких случаях сообщалось о проявлении таких серьезных кожных реакций, как синдром Стивенса-Джонсона и синдром Лайелла, в хронологической зависимости от применения ацетилцистеина.

В большинстве случаев, по меньшей мере, один одновременно принимаемый препарат мог быть вовлечен в запуск вышеуказанных слизисто-кожных синдромов.

Снижение агрегации тромбоцитов в присутствии ацетилцистеина подтверждалось различными исследованиями. Клиническое значение до сих пор не установлено.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Телефон: 8 (800) 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Ацетилцистеин при приеме в дозе 500 мг/кг/день не вызывает признаков и симптомов передозировки.

Симптомы

Могут наблюдаться следующие симптомы: тошнота, рвота и диарея.

Лечение

Конкретный антидот отсутствует, лечение является симптоматическим.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: препараты, применяемые при кашле и простудных заболеваниях; отхаркивающие средства, кроме комбинаций с противокашлевыми средствами;

муколитические средства.

Код АТХ: R05CB01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Муколитическое средство, разжижает мокроту, увеличивает ее объем, облегчает отхождение мокроты. Ацетилцистеин является производным аминокислоты цистеина. Действие связано со способностью свободных сульфгидрильных групп ацетилцистеина разрывать внутри- и межмолекулярные дисульфидные связи кислых мукополисахаридов мокроты, что приводит к деполимеризации мукопротеинов и уменьшению вязкости мокроты (в ряде случаев это приводит к значительному увеличению объема мокроты, что требует аспирации содержимого бронхов).

Кроме того, ацетилцистеин снижает индуцированную гиперплазию мукоидных клеток, усиливает выработку поверхностно-активных соединений путем стимуляции пневмоцитов II типа, стимулирует мукоцилиарную активность, что приводит к улучшению мукоцилиарного клиренса.

Сохраняет активность при гнойной, слизисто-гнойной и слизистой мокроте. Не влияет на иммунитет.

Увеличивает секрецию менее вязких сиаломуцинов бокаловидными клетками, снижает адгезию бактерий на эпителиальных клетках слизистой оболочки бронхов.

Стимулирует мукозные клетки бронхов, секрет которых лизует фибрин.

Аналогичное действие оказывает на секрет, образующийся при воспалительных заболеваниях ЛОР-органов.

Оказывает антиоксидантное действие, обусловленное наличием SH-группы, способной нейтрализовать электрофильные окислительные токсины.

Ацетилцистеин легко проникает внутрь клетки, деацетируется до L-цистеина, из которого синтезируется внутриклеточный глутатион.

Глутатион – высокореактивный трипептид, мощный антиоксидант, цитопротектор, улавливающий эндогенные и экзогенные свободные радикалы и токсины. Ацетилцистеин предупреждает истощение и способствует повышению синтеза внутриклеточного глутатиона, участвующего в окислительно-восстановительных процессах клеток, таким образом способствуя детоксикации вредных веществ. Этим объясняется действие ацетилцистеина в качестве антидота при отравлении парацетамолом.

Парацетамол оказывает свое цитотоксическое действие через прогрессивное истощение глутатиона. Основной ролью ацетилцистеина является поддержание надлежащего уровня концентрации глутатиона, обеспечивая таким образом защиту для клеток.

Предохраняет альфа-1-антитрипсин (ингибитор эластазы) от инактивирующего воздействия НОСІ-окислителя, вырабатываемого миелопероксидазой активных фагоцитов. Обладает также некоторым противовоспалительным действием (за счет подавления образования свободных радикалов и активных кислородсодержащих веществ, ответственных за развитие воспаления в легочной ткани).

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция после приема внутрь высокая. Ацетилцистеин немедленно деацетируется до цистеина в печени. В крови наблюдается подвижное равновесие свободного и связанного с белками плазмы ацетилцистеина и его метаболитов (цистеина, цистина и диацетилцистина). Биологическая доступность низкая – около 10 % в связи с наличием сильно выраженного эффекта «первого прохождения» через печень.

Распределение

Ацетилцистеин распределяется как в неизменном виде (20 %), так и в виде активных метаболитов (80 %), проникает в межклеточное пространство, распределяется преимущественно в печени, почках, легких и бронхиальном секрете. Объем распределения ацетилцистеина варьирует от 0,33 до 0,47 л/кг, максимальная концентрация в плазме крови ($C_{\max}$) после приема внутрь достигается примерно через 1 – 3 часа и составляет 15 ммоль/л. Связь с белками плазмы крови – 50 % через 4 часа после приема и снижается до 20 % через 12 часов. Проникает через плацентарный барьер.

Биотрансформация

После приема внутрь ацетилцистеин быстро и экстенсивно метаболизируется в стенках кишечника с образованием фармакологически активного метаболита – цистеина, а также диацетилцистина, цистина.

Элиминация

Выводится в основном почками в виде неактивных метаболитов (неорганические сульфаты, диацетилцистин), незначительная часть выделяется в неизменном виде через кишечник. Период полувыведения ($T_{1/2}$) ацетилцистеина из плазмы составляет около 1 часа. При нарушении функции печени этот показатель увеличивается до 8 часов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Сахароза

Аскорбиновая кислота

Ароматизатор Апельсин
Аспартам

6.2. Несовместимость

Не применимо

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 3 г в пакетиках термосвариваемых из материала многослойного комбинированного (бумага/полиэтилен/алюминиевая фольга/полиэтилен).

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 100 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
10, 20 или 30 пакетиков вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 200 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
10, 20 или 30 пакетиков вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

Ацетилцистеин ВЕРТЕКС, 600 мг, порошок для приготовления раствора для приема внутрь
6, 10 или 20 пакетиков вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А.

Телефон: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: vertex@vertex.spb.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А.

Телефон: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: pharmacovigilance@vertex.spb.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Ацетилцистеин ВЕРТЕКС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org>.