

## ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

### 1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

### 2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: никотин

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Каждая таблетка для рассасывания, покрытая пленочной оболочкой, содержит 10,5 мг никотина резината, эквивалентного 2,0 мг никотина.

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

Каждая таблетка для рассасывания, покрытая пленочной оболочкой, содержит 10,5 мг никотина резината, эквивалентного 2,0 мг никотина.

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Каждая таблетка для рассасывания, покрытая пленочной оболочкой, содержит 21,0 мг никотина резината, эквивалентного 4,0 мг никотина.

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

Каждая таблетка для рассасывания, покрытая пленочной оболочкой, содержит 21,0 мг никотина резината, эквивалентного 4,0 мг никотина.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные].

Таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые].

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета; с гравировкой «п» на одной стороне и «2» – на другой стороне.

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета; с гравировкой «п» на одной стороне и «2» – на другой стороне.

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета; с гравировкой «п» на одной стороне и «4» – на другой стороне.

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета; с гравировкой «п» на одной стороне и «4» – на другой стороне.

## 4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

### 4.1. Показания к применению

Препарат Никоретте показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет для лечения табачной зависимости путем снижения потребности в никотине в следующих случаях:

- уменьшение симптомов синдрома «отмены», возникающих при полном отказе от курения у пациентов, решивших бросить курить;
- при временном отказе от курения;
- уменьшение количества выкуриваемых сигарет и стиков для систем нагревания табака у тех, кто не может или не хочет полностью отказаться от курения.

### 4.2. Режим дозирования и способ применения

#### Режим дозирования

Никоретте следует применять в тот момент, когда обычно выкуривались сигарета или стик для системы нагревания табака или при возникновении непреодолимого желания закурить. Для увеличения шансов на успех препарат следует принимать ежедневно в необходимой дозировке.

Первоначальная доза подбирается индивидуально, в зависимости от степени никотиновой зависимости пациента. Никоретте, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой, с содержанием никотина 4 мг рекомендуется применять тем, кто выкуривает 20 и более сигарет или стиков для систем нагревания табака в день или выкуривает первую сигарету или стик для системы нагревания табака через 30 или менее минут после пробуждения. Остальным курильщикам следует начинать лечение с таблеток для рассасывания с содержанием никотина 2 мг.

#### *Полный отказ от курения*

При полном отказе от курения количество таблеток для рассасывания обычно составляет 8–12 штук в день, максимальная суточная доза – 15 таблеток.

Средний курс применения таблеток для рассасывания в указанной дозе – 6 недель. Затем следует постепенно снижать количество применяемых таблеток. Когда суточная доза снизится до 1–2 таблеток, применение препарата следует прекратить.

Пациенты должны полностью отказаться от курения во время применения таблеток для рассасывания Никоретте.

#### *Сокращение количества выкуриваемых сигарет и стиков для систем нагревания табака*

Курильщикам, желающим снизить количество выкуриваемых сигарет или стиков для систем нагревания табака, следует применять таблетки для рассасывания по потребности между эпизодами курения в целях увеличения промежутков времени между курением и с целью максимально возможного снижения курения.

Количество таблеток, применяемых в течение дня, может варьироваться в зависимости от потребности, но максимальная суточная доза составляет 15 таблеток.

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

После отказа от курения следует соблюдать рекомендации терапии и постепенного снижения дозы, указанные выше при полном отказе от курения.

Одновременное проведение медицинского консультирования и обеспечение психологической поддержки обычно повышают эффективность терапии.

#### *Временный отказ от курения*

Таблетки для рассасывания можно применять в периоды, когда необходимо воздержаться от курения - например, при нахождении в местах, где запрещено курить, или в других ситуациях, когда нужно воздержаться от курения. Максимальная суточная доза при временном отказе от курения – 15 таблеток.

#### *В комбинации с пластырем трансдермальным*

Для курильщиков с сильно выраженной никотиновой зависимостью или испытывающих непреодолимую тягу к курению, или курильщиков, которым не удалось отказаться от курения с применением одних только таблеток для рассасывания, возможно применение таблеток для рассасывания Никоретте в комбинации с пластырем трансдермальным Никоретте.

При комбинированном применении таблеток для рассасывания и пластыря трансдермального следует руководствоваться рекомендациями по определению дозы и способа применения, как и при монотерапии.

Пациенты должны полностью отказаться от курения во время терапии.

#### Особые группы пациентов

##### *Пациенты с нарушением функции почек*

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью препарат следует применять с осторожностью, поскольку клиренс никотина и его метаболитов может быть снижен, что может увеличить риск нежелательных реакций (см. разделы 4.4. и 5.2.).

##### *Пациенты с нарушением функции печени*

У пациентов со средней и тяжелой степенью печеночной недостаточности препарат следует применять с осторожностью, поскольку клиренс никотина и его метаболитов может быть снижен, что может увеличить риск нежелательных явлений (см. разделы 4.4. и 5.2.).

##### *Лица пожилого возраста*

Коррекция дозы не требуется (см. раздел 5.2.).

##### Дети

В возрасте от 12 до 18 лет препарат может применяться только по рекомендации врача. Данные контролируемых клинических исследований по применению таблеток для рассасывания Никоретте у детей в возрасте до 18 лет отсутствуют. Противопоказано для детей моложе 12 лет.

Режим дозирования в возрасте от 12 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Перед применением препарата в возрасте от 12 до 18 лет необходимо проконсультироваться с врачом.

## Способ применения

Местно.

Таблетку для рассасывания помещают в полость рта, периодически перемещая ее с одной стороны на другую до полного растворения.

Таблетку для рассасывания не следует жевать или проглатывать целиком. Во время приема таблеток для рассасывания не допустим прием пищи и напитков.

При появлении симптомов передозировки (см. раздел 4.9.) применение препарата необходимо временно прекратить. Если симптомы передозировки сохраняются, потребление никотина должно быть снижено за счет уменьшения дозировки или частоты приема препарата.

## **Рекомендации по использованию флакона**

Как открыть флакон



Как закрыть флакон



## **4.3. Противопоказания**

- гиперчувствительность к никотину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- детский возраст до 12 лет;
- некурящие

## **4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении**

### Особые указания

Преимущества отказа от курения перевешивают любые риски, которые присущи никотинзаместительной терапии.

Оценка соотношения риска и пользы должна проводиться для пациентов соответствующим специалистом с учетом следующих условий:

### *Сопутствующие сердечно-сосудистые заболевания*

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 неконтролируемой артериальной гипертензией следует рекомендовать прекратить курение без помощи фармакологического вмешательства (например, посредством психологической консультации). Если такие попытки безрезультатны, то можно рассмотреть вопрос о применении таблеток для рассасывания Никоретте, однако ввиду ограниченности данных по

безопасности у этой категории пациентов начинать подобное лечение следует только под строгим медицинским наблюдением.

#### *Сахарный диабет*

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

#### *Нарушение функций почек и печени*

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.

#### *Феохромоцитома и неконтролируемый гипертиреоз*

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

#### *Эпилепсия и судороги*

Применять с осторожностью у пациентов с эпилепсией или судорогами в анамнезе во время никотинзаместительной терапии. Табачный дым содержит вещества, в том числе никотин, которые воздействуют на рецепторы головного мозга, а изменения в уровне их потребления при переходе с курения табака на никотинзаместительную терапию во время отказа от курения могут повлиять на судорожный порог.

#### *Заболевания желудочно-кишечного тракта*

Никотин может обострять симптомы эзофагита, гастрита или пептической язвы, поэтому применять препараты никотинзаместительной терапии при указанной патологии следует с осторожностью.

#### *Аллергические реакции*

Склонность к отеку Квинке и крапивнице.

#### *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, такрина, клозапина и ропинирола.

#### Меры предосторожности при применении

Таблетки для рассасывания могут представлять опасность в случае попадания в дыхательные пути. Следует с осторожностью применять лицам с проблемами аспирации и глотания.

В дно флакона встроена ячейка, содержащая гранулы влагопоглотителя - силикагеля. Не нарушать целостность ячейки, содержащей влагопоглотитель! Не проглатывать влагопоглотитель!

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.

### Дети

Дозы никотина, которые легко переносят взрослые курильщики, могут вызвать тяжелую интоксикацию у детей, что может привести к смерти. Важно не оставлять без присмотра препараты, содержащие никотин, поскольку это может привести к их неправильному применению и проглатыванию детьми (см. раздел 4.9.).

***Применение Никоретте сопровождается меньшим риском, чем курение!***

## **4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия**

Четкого клинически значимого взаимодействия между никотинзаместительной 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.

Прекращение курения может вызвать снижение клиренса субстратов фермента CYP1A2 и повышение концентрации в плазме лекарственных препаратов, метаболизируемых CYP1A2, особенно препаратов с узким терапевтическим диапазоном, таких как теофиллин, такрин, клозапин и ропинирол (см. раздел 4.4).

Возможна повышенная подкожная абсорбция инсулина, что может потребовать снижение дозы инсулина при отказе от курения (см. раздел 4.4).

## **4.6. Фертильность, беременность и лактация**

### Беременность

Курение во время беременности связано с такими рисками, как задержка внутриутробного развития, преждевременные роды или мертворождение. 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.

Никотин проникает через плацентарный барьер и влияет на дыхательную активность и кровообращение плода. Влияние на кровообращение является дозозависимым. Поэтому беременным женщинам рекомендуется полностью отказаться от курения без использования заместительной никотиновой терапии. Продолжение курения может представлять более высокую опасность для плода по сравнению с контролируемым применением препаратов никотинзаместительной терапии при отказе от курения. Применение беременной женщиной препарата Никоретте следует начинать только после консультации с врачом.

### Лактация

Никотин свободно проникает в грудное молоко в количествах, которые могут оказать воздействие на ребенка, даже при применении препарата в терапевтических дозах. Поэтому следует воздержаться от применения таблеток для рассасывания Никоретте в период грудного вскармливания. Если не удалось отказаться от курения, то применение препарата следует начинать только после консультации с врачом.

С целью уменьшения отрицательного влияния никотина на ребенка препарат следует применять сразу же после кормления или за два часа до следующего кормления.

### Фертильность

Курение снижает фертильность у женщин и мужчин. Исследования in vitro показали, что никотин отрицательно влияет на качество спермы. Исследования на крысах продемонстрировали снижение качества спермы и низкую фертильность.

В отличие от хорошо известных побочных эффектов никотина на организм человека и течение беременности, последствия терапевтической никотиновой терапии неизвестны. Таким образом, для женщин, планирующих беременность, наиболее целесообразным считается не курить и не проходить никотинзаместительную терапию. В то время как курение может оказывать неблагоприятное воздействие на мужскую фертильность, доказательства того, что во время никотинзаместительной терапии мужчинам необходимы особые средства контрацепции, не установлены.

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

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами не установлено. Тем не менее, пациенты, использующие никотинзаместительную терапию, должны иметь в виду, что отказ от курения может вызвать изменения в поведении.

### **4.8. Нежелательные реакции**

#### Резюме профиля безопасности

Некоторые симптомы могут быть обусловлены отменой никотина вследствие прекращения курения. К ним относятся эмоциональные или когнитивные эффекты, такие как дисфория или подавленное настроение; бессонница; раздражительность, недовольство или гневливость; тревога; затруднение концентрации внимания, беспокойство или нетерпеливость. Также могут наблюдаться эффекты, влияющие на физическое состояние человека, такие как снижение частоты сердечных сокращений; повышение аппетита или увеличение массы тела, головокружение или пресинкопальные состояния, кашель, запор, кровоточивость десен, повышение частоты афтозных язв или назофарингита. Кроме того, тяга к никотину, рассматриваемая в качестве клинически значимого симптома – важное проявление отмены никотина после прекращения курения.

Большинство нежелательных реакций отмечались в раннюю фазу лечения и носят преимущественно дозозависимый характер.

В первые несколько дней лечения может наблюдаться раздражение слизистой оболочки полости рта и глотки, однако продолжение лечения приводит к адаптации.

При применении таблеток для рассасывания Никоретте редко развиваются аллергические реакции (включая анафилактические реакции).

#### Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции классифицированы по частоте возникновения следующим образом: 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 ( $< 1/10000$ ), неизвестно (на основании имеющихся данных оценить невозможно). При группировке по частоте встречаемости нежелательные реакции приведены в порядке уменьшения их тяжести.

*По данным клинических исследований*

| Системно-органный класс                                                        | Частота              | Нежелательные реакции                                                                                  |
|--------------------------------------------------------------------------------|----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Нарушения со стороны иммунной системы                                          | Часто                | Реакции гиперчувствительности*                                                                         |
| Нарушения со стороны нервной системы                                           | Очень часто<br>Часто | Головная боль* <sup>#</sup><br>Изменение вкуса, парестезия*                                            |
| Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения | Очень часто          | Кашель***, икота, раздражение слизистой оболочки глотки                                                |
| Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта                                | Очень часто<br>Часто | Тошнота*<br>Боль в животе, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, гиперсекреция слюны, стоматит, рвота* |
| Общие нарушения и реакции в месте введения                                     | Часто                | Чувство жжения**, утомляемость*                                                                        |

\* Системное действие

\*\* В месте применения

\*\*\* Более высокая частота развития реакции наблюдалась в клинических исследованиях никотинсодержащего препарата в форме ингалятора

<sup>#</sup> Несмотря на то что частота развития реакции в группе активного препарата ниже, чем в группе плацебо, частота развития реакции при применении конкретной лекарственной формы, для которой данное нежелательное явление (НЯ) было выявлено как «системная нежелательная реакция», была выше в группе активного препарата по сравнению с группой плацебо.

*По данным пострегистрационных исследований*

| Системно-органный класс                                                        | Частота    | Нежелательные реакции                                                                                      |
|--------------------------------------------------------------------------------|------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Нарушения со стороны иммунной системы                                          | Неизвестно | Анафилактические реакции*                                                                                  |
| Психические нарушения                                                          | Нечасто    | Необычные сновидения*                                                                                      |
| Нарушения со стороны нервной системы                                           | Неизвестно | Судороги*                                                                                                  |
| Нарушения со стороны органа зрения                                             | Неизвестно | Нечеткость зрения, усиление слезотечения                                                                   |
| Нарушения со стороны сердца                                                    | Нечасто    | Ощущение сердцебиения*, тахикардия*                                                                        |
| Нарушения со стороны сосудов                                                   | Нечасто    | Гиперемия*, гипертензия*, приливы*                                                                         |
| Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения | Нечасто    | Бронхоспазм, дисфония, одышка*, заложенность носа, боль в ротоглотке, чихание, чувство сдавливания в горле |

| Системно-органный класс                         | Частота    | Нежелательные реакции                                                                                                              |
|-------------------------------------------------|------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта | Часто      | Диарея <sup>#</sup>                                                                                                                |
|                                                 | Нечасто    | Отрыжка, глоссит, образование пузырей на слизистой оболочке рта и отслоение слизистой оболочки полости рта, парестезия полости рта |
|                                                 | Редко      | Дисфагия, гипестезия полости рта <sup>#</sup> , позывы на рвоту                                                                    |
|                                                 | Неизвестно | Сухость в глотке, желудочно-кишечный дискомфорт*, боль в губах                                                                     |
| Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей    | Нечасто    | Повышенная потливость*, зуд*, высыпания на коже*, крапивница*                                                                      |
|                                                 | Неизвестно | Ангioneвротический отек*, эритема*                                                                                                 |
| Общие нарушения и реакции в месте введения      | Нечасто    | Астения*, дискомфорт и боль в грудной клетке*, недомогание*                                                                        |

\* Системное действие.

<sup>#</sup> Зарегистрированы с аналогичной или меньшей частотой развития по сравнению с группой плацебо.

#### 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

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

Телефон: +7 800-550-99-03

Электронная почта: [pharm@roszdravnadzor.gov.ru](mailto:pharm@roszdravnadzor.gov.ru) или [npr@roszdravnadzor.gov.ru](mailto:npr@roszdravnadzor.gov.ru)

Сайт: [www.roszdravnadzor.gov.ru](http://www.roszdravnadzor.gov.ru)

## 4.9. Передозировка

### Симптомы

Чрезмерное поступление никотина при заместительной терапии и/или курении может вызвать появление симптомов передозировки.

Симптомы передозировки никотином могут возникать у пациентов с низким поступлением никотина до лечения или при одновременном использовании различных источников никотина.

Симптомы передозировки сходны с таковыми при остром отравлении никотином и включают в себя тошноту, рвоту, повышенное слюноотделение, боль в животе, диарею, потливость, головную боль, головокружение, нарушение слуха и выраженную общую слабость. При применении высоких доз никотина могут отмечаться артериальная гипотензия, слабый и

нерегулярный пульс, затрудненное дыхание, ~~протрация~~, ~~сосудистая недостаточность~~, циркуляторный коллапс и генерализованные судороги.

Никотин в переносимых взрослыми курильщиками дозах может вызвать у маленьких детей выраженные симптомы интоксикации, в том числе со смертельным исходом.

Подозрение на отравление никотином у детей должно расцениваться как неотложное состояние, требующее немедленной госпитализации.

#### Лечение

В случае передозировки препаратом необходимо незамедлительно обратиться за медицинской помощью.

В случае проглатывания избыточного количества никотина следует немедленно прекратить применение никотина и назначить симптоматическое лечение. При необходимости следует начать искусственную вентиляцию легких. Активированный уголь снижает всасывание никотина в желудочно-кишечном тракте.

Минимальная летальная доза при острой передозировке никотином у детей составляет от 40 до 60 мг (при пероральном приеме табака из сигарет) или от 0,8 до 1,0 мг/кг у некурящих взрослых.

## **5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

### **5.1. Фармакодинамические свойства**

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы; средства, применяемые при аддиктивных расстройствах; средства, применяемые при никотиновой зависимости.

Код АТХ: N07BA01

#### Механизм действия

Никотин является агонистом никотиновых рецепторов периферической и центральной нервной системы (ЦНС) и оказывает выраженное действие на ЦНС и сердечно-сосудистую систему.

#### Фармакодинамические эффекты

После резкого отказа от курения у пациентов, ежедневно использовавших табакосодержащие продукты в течение длительного времени, возможно развитие синдрома «отмены», который включает в себя: дисфорию, бессонницу, повышенную раздражительность, тревогу, нарушение концентрации внимания, снижение частоты сердечных сокращений, увеличение аппетита или прибавку в весе. Важным симптомом синдрома «отмены» является также желание курить.

При лечении табачной зависимости заместительная терапия никотином снижает потребность в числе выкуриваемых сигарет и стиков для систем нагревания табака, снижает выраженность симптомов «отмены», возникающих при полном отказе от курения у тех, кто решил бросить курить, облегчает временное воздержание от курения, а также способствует уменьшению количества выкуриваемых сигарет и стиков для систем нагревания табака у тех, кто не может или не хочет полностью отказаться от курения.

## 5.2. Фармакокинетические свойства

### Абсорбция

Таблетки для рассасывания полностью растворяются в полости рта. Все количество никотина, содержащееся в таблетке для рассасывания, всасывается трансбуккально или проглатывается. Биодоступность никотина, проглоченного вместе со слюной, снижается из-за первичного метаболизма. Следовательно, при жевании, удержании во рту и последующем проглатывании или жевании и немедленном проглатывании таблеток для рассасывания всасывание никотина замедляется и снижается.

Максимальная концентрация никотина в плазме крови, равная 5 нг/мл для таблеток для рассасывания 2 мг, и 8 нг/мл - для таблеток для рассасывания 4 мг, достигается в среднем в течение 40 и 50 мин, соответственно.

Таблетки для рассасывания полностью растворяются в течение 16–19 минут.

### Распределение

Объем распределения после внутривенного введения никотина был изучен в многочисленных исследованиях, часть из которых показали, что его значение составляет 2,5 л/кг. Распределение никотина в тканях зависит от уровня pH. Максимальное содержание никотина достигается в головном мозге, желудке, почках и печени.

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

Результаты фармакокинетических исследований показали, что метаболизм и выведение никотина не зависят от лекарственной формы, и поэтому для описания распределения, биотрансформации, метаболизма и выведения никотина используются результаты исследования при его внутривенном введении.

Основным органом, элиминирующим никотин, является печень. Тем не менее, никотин также метаболизируется в небольших количествах в почках и головном мозге. В первую очередь, в процесс биотрансформации вовлечен фермент CYP2A6. Известно семнадцать метаболитов никотина, при этом все они, по-видимому, менее активны по сравнению с исходным соединением.

Плазменный период полувыведения котинина - основного метаболита никотина – равен 15-20 ч, а его концентрация превышает таковую для никотина в 10 раз. Затем котинин окисляется в транс-3-гидроксикотинин, который является самым распространенным метаболитом никотина в моче. Как никотин, так и котинин проходят конъюгацию с глюкуроновой кислотой.

### Элиминация

Средние значения плазменного клиренса никотина составляют от 62,6 до 89 л/час, период полувыведения составляет приблизительно 2 ч (от 1 до 4 часов).

Примерно 10–30 % никотина выводится с мочой в неизменном виде. При высокой скорости фильтрации и pH мочи ниже 5 количество никотина, выводимого с мочой в неизменном виде, может достигать 23 %.

### Линейность/нелинейность

Средние значения  $AUC_{\infty}$  составили 16,0 нг/мл\*ч и 30,8 нг/мл\*ч после применения таблеток для рассасывания с содержанием никотина 2 мг и 4 мг, соответственно.

### **Особые группы пациентов**

#### Почечная недостаточность

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.

#### Печеночная недостаточность

Фармакокинетика никотина у пациентов с циррозом печени и 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 в среднем на 40–50 %. Данные о фармакокинетике никотина при нарушении функции печени более 7 баллов по шкале Чайлд-Пью отсутствуют.

#### Лица пожилого возраста

У здоровых пациентов пожилого возраста отмечено небольшое снижение общего клиренса никотина, но отклонения носят переменный характер и не дают достаточных оснований для обоснования общих рекомендаций по корректировке дозы, связанных с возрастом.

### **5.3. Данные доклинической безопасности**

Никотин имеет пероральную и дермальную  $LD_{50}$  в диапазоне до 70 мг/кг. Общая токсичность при повторном применении никотина общеизвестна.

Исследования генотоксичности никотина *in vitro* и *in vivo* преимущественно показали отсутствие генотоксичности. Получены некоторые положительные результаты исследований генотоксичности *in vitro* и *in vivo*, при этом исследования с применением одобренных регуляторных органов методов и протоколов не показали наличие признаков генотоксической активности в терапевтических дозах.

Анализ результатов долгосрочных исследований канцерогенности никотина или котинина, основного метаболита никотина, преимущественно указывает на отсутствие у никотина значимой или релевантной канцерогенной активности.

В исследованиях на животных никотин имел токсическое действие на организм матери, плод, включая постимплантационную гибель плодов и задержку роста

В исследованиях на животных никотин оказывал негативное влияние на сперматогенез. Степень его влияния на фертильность самок неизвестна.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

### **6.1. Перечень вспомогательных веществ**

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

*Ядро таблетки*

Маннитол

Камедь ксантановая

Ароматизатор Winterfresh RDE4-149 (акация камедь, ароматизатор мяты перечной, ароматизатор ментоловый, ароматизатор эвкалиптовый)

Натрия карбонат

Сукралоза

Ацесульфам калия

Магния стеарат

*Оболочка таблетки*

Гипромеллоза

Ароматизатор Winterfresh RDE4-149 (ароматизатор мяты перечной, ароматизатор ментоловый, ароматизатор эвкалиптовый)

Титана диоксид

Сукралоза

Полировочный агент Sepifilm Gloss (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, перламутровый пигмент на основе слюды)

Ацесульфам калия

Полисорбат-80

Никоретте, 2 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

*Ядро таблетки*

Маннитол

Камедь ксантановая

Ароматизатор Tutti Frutti (ароматизатор Tutti Frutti жидкий и акации камедь)

Натрия карбонат

Сукралоза

Ацесульфам калия

Магния стеарат

*Оболочка таблетки*

Гипромеллоза

Ароматизатор Tutti Frutti жидкий (апельсина масло, терпены апельсина масла, изоамилбутират и цитраль)

Титана диоксид

Сукралоза

Ацесульфам калия

Полисорбат-80

Полировочный агент Sepifilm Gloss (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, перламутровый пигмент на основе слюды)

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]

*Ядро таблетки*

Маннитол

Камедь ксантановая

Ароматизатор Winterfresh RDE4-149 (акация камедь, ароматизатор мяты перечной, ароматизатор ментоловый, ароматизатор эвкалиптовый)

Натрия карбонат

Сукралоза

Ацесульфам калия

Магния стеарат

*Оболочка таблетки*

Гипромеллоза

Ароматизатор Winterfresh RDE4-149 (ароматизатор мяты перечной, ароматизатор ментоловый, ароматизатор эвкалиптовый)

Титана диоксид

Сукралоза

Полировочный агент Sepifilm Gloss (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, перламутровый пигмент на основе слюды)

Ацесульфам калия

Полисорбат-80

Никоретте, 4 мг, таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]

*Ядро таблетки*

Маннитол

Камедь ксантановая

Ароматизатор Tutti Frutti (ароматизатор Tutti Frutti жидкий и акации камедь)

Натрия карбонат

Сукралоза

Ацесульфам калия

Магния стеарат

*Оболочка таблетки*

Гипромеллоза

Ароматизатор Tutti Frutti жидкий (апельсина масло, терпены апельсина масла, изоамилбутират и цитраль)

Титана диоксид

Сукралоза

Ацесульфам калия

Полисорбат-80

Полировочный агент Sepifilm Gloss (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, перламутровый пигмент на основе слюды)

## **6.2. Несовместимость**

Не применимо.

### **6.3. Срок годности (срок хранения)**

3 года.

### **6.4. Особые меры предосторожности при хранении**

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (флаконе).

### **6.5. Характер и содержание упаковки**

По 20 таблеток для рассасывания, покрытых пленочной оболочкой, в полипропиленовом флаконе синего цвета (Flip-rack), в дно которого встроена ячейка, содержащая влагопоглотитель силикагель. На флакон наносят этикетку.

Таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [мятные]: по 1 или 4 флакона вместе с инструкцией по медицинскому применению заламинированы в прозрачный контурный пластиковый контейнер из полиэтилентерефталата с картонной основой.

Таблетки для рассасывания, покрытые пленочной оболочкой [фруктовые]: по 1 флакону вместе с инструкцией по медицинскому применению заламинированы в прозрачный контурный пластиковый контейнер из полиэтилентерефталата с картонной основой.

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

Особые требования отсутствуют.

## **7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ**

Российская Федерация

ООО «ДжейТНЛ»

121614, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Крылатское, ул. Крылатская, д. 17, к. 3.

Телефон: +7 495 726-55-55.

### **7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения**

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ДжейТНЛ»

121614, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Крылатское, ул. Крылатская, д. 17, к. 3.

Телефон: +7 495 726-55-55

Электронная почта: safetyru@kenvue.com

## **8. НОМЕР(НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ**

## **9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Лекарственный препарат относится к категории отпуска без рецепта.

Общая характеристика лекарственного препарата Никоретте доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) [https://lk.regmed.ru/Register/EAEU\\_SmPC](https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC).