

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[мятный]

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[фруктово-мятный]

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: никотин

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[мятный]

Каждая доза спрея содержит 1 мг никотина.

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

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[фруктово-мятный]

Каждая доза спрея содержит 1 мг никотина.

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

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный.

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[мятный]

От бесцветного до светло-желтого цвета прозрачный или слегка опалесцирующий
раствор с запахом мяты.

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный
[фруктово-мятный]

От бесцветного до желтого цвета прозрачный или слегка опалесцирующий раствор с запахом мяты и фруктов.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

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

4.2. Режим дозирования и способ применения

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

Режим дозирования

Взрослые

Спрей Никоретте следует применять в тот момент, когда возникает непреодолимое желание закурить.

Полный отказ от курения

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 или стиков для систем нагревания табака спреем Никоретте и, как только представится возможность, снизить количество впрыскиваний до их полного прекращения.

При полном отказе от курения сделайте 1 или 2 впрыскивания в период времени, когда обычно вы выкуривали сигарету или стик для систем нагревания табака, 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.

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

Каждый флакон содержит не менее 150 доз.

Средний курс применения спрея в указанной дозе – 6 недель. Затем следует начать снижение количества впрыскиваний таким образом, чтобы к концу 9-й недели количество доз составляло половину от среднего количества доз в сутки, получаемых в первые 6 недель, а в течение 12-й недели – не более 4 доз в сутки. Когда суточная доза снизится до 2–4 впрыскиваний, применение спрея следует прекратить.

После окончания терапии для предотвращения возврата к курению пациенты могут применять спрей Никоретте при непреодолимом желании курить. В таких ситуациях можно сделать 1 впрыскивание, а в случае, если после однократного впрыскивания тяга к курению в течение нескольких минут не снижается, следует произвести второе впрыскивание. При этом не следует превышать 4 дозированных впрыскиваний в сутки. Регулярное применение спрея более 6 месяцев обычно не рекомендуется, однако некоторым пациентам может потребоваться более длительная терапия, чтобы не возобновить курение.

Сокращение количества выкуриваемых сигарет и стиков для систем нагревания табака

Курильщикам, желающим снизить количество выкуриваемых сигарет или стиков для систем нагревания табака, следует применять спрей 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.

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

Поведенческая терапия и психологическая поддержка обычно увеличивают успешность лечения. Тем, кому удалось бросить курить, но сложно отказаться от спрея, рекомендуется обратиться к врачу за медицинской помощью.

Временный отказ от курения

Спрей 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 – 64 дозы.

В комбинации с пластырем трансдермальным

Для курильщиков с сильно выраженной никотиновой зависимостью (более 20 сигарет или стиков для систем нагревания табака в день) или испытывающих непреодолимую тягу к курению, или курильщиков, которым не удалось отказаться от курения с применением только одного вида никотин-заместительной терапии, возможно применение спрея для слизистой оболочки полости рта Никоретте в комбинации с пластырем трансдермальным Никоретте для быстрого облегчения тяги к курению.

Пластырь накладывается на неповрежденный участок кожи сразу после пробуждения утром и удаляется перед сном. Пластырь должен накладываться на сухую, чистую, неповрежденную кожу, не содержащую волос, например, бедра, верхние конечности или грудную клетку. Необходимо изменять место наложения каждый день: не следует использовать одну и ту же область в течение двух последующих дней.

После наложения пластыря тщательно вымойте руки, чтобы избежать раздражения глаз от возможного попадания в них никотина.

Начальная терапия:

Лечение следует начинать с пластыря 25 мг/16 часов (1 этап) в комбинации со спреем 1 мг/доза. Обычно бывает достаточно 13 доз спрея в сутки. Максимальная суточная доза спрея – 32 дозы.

Пациенты должны полностью отказаться от курения во время терапии. Обычно общий курс лечения продолжается в течение 8 недель. После этого дозу никотина следует постепенно снижать.

Отмена комбинированной терапии:

Отменять комбинированную терапию можно двумя способами.

Способ 1: в течение последующих 2 недель необходимо перейти с пластыря 25 мг/16 часов (1 этап) на пластырь 15 мг/16 часов (2 этап), а затем, в течение последующих 2 недель – на пластырь 10 мг/16 часов (3 этап), сохраняя при этом, если необходимо, количество применяемых доз спрея Никоретте, как и при *Начальной терапии*. Далее постепенно снижают количество доз спрея до полной отмены в течение времени, которое необходимо пациенту в зависимости от его потребностей, но не позднее, чем через 12 месяцев после начала применения комбинированной терапии.

Способ 2: заключается в полной отмене пластыря сразу после окончания этапа *Начальной терапии*. Далее постепенно снижают количество доз спрея Никоретте до полной отмены в течение времени, которое необходимо пациенту в зависимости от его потребностей, но не позднее, чем через 12 месяцев после начала применения комбинированной терапии.

Рекомендуемая доза:

Начальная терапия		
Период времени	Пластырь трансдермальный	Спрей для слизистой оболочки полости рта 1 мг/доза
Первые 8 недель	1 пластырь 25 мг/16 часов (1 этап) ежедневно	При необходимости. Рекомендуемая суточная доза – 13 доз спрея Никоретте
Отмена – способ 1		
Следующие 2 недели	1 пластырь 15 мг/16 часов (2 этап) ежедневно	Продолжать применение спрея Никоретте по необходимости
Следующие 2 недели	1 пластырь 10 мг/16 часов (3 этап) ежедневно	Продолжать применение спрея Никоретте по необходимости
До 12 месяцев после начала применения комбинированной терапии	-----	Постепенная отмена спрея Никоретте
Отмена – способ 2		

До 12 месяцев после начала применения комбинированной терапии		Постепенная отмена спрея Никоретте
---	--	------------------------------------

Дети

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

Способ применения

Для нанесения на слизистую оболочку полости рта.

После подготовки спрея к использованию (см. ниже Инструкцию по использованию) 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.

При появлении симптомов передозировки (см. раздел 4.9) применение препарата необходимо немедленно прекратить.

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 Никоретте



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 (е) и опустите дозатор вниз (f). Затем опустите 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.

В случае возникновения любых симптомов избытка никотина применение следует временно прекратить. Если симптомы избытка никотина сохраняются, то прием никотина следует уменьшить путем снижения частоты применения или дозы.

4.3. Противопоказания

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

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Применение препарата Никоретте сопровождается меньшим риском, чем курение.

При применении спрея Никоретте следует соблюдать осторожность и не допускать попадания спрея в глаза.

Оценка соотношения риска и пользы должна быть произведена врачом соответствующей специальности у пациентов со следующими состояниями:

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 неконтролируемой гипертензией 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 никотин-заместительной терапии рекомендуется более тщательно контролировать концентрацию глюкозы в крови, поскольку снижение содержания катехоламинов, высвобождение которых индуцировано никотином, может повлиять на метаболизм углеводов.

Аллергические реакции

Препарат следует применять с осторожностью пациентам, предрасположенным к ангионевротическому отеку и крапивнице.

Заболевания желудочно-кишечного тракта

Никотин может усиливать симптомы у пациентов, страдающих эзофагитом, язвенной болезнью желудка или пептической язвой. При данных состояниях препараты для пероральной никотин-заместительной терапии следует применять 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.

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.

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.

Если симптомы сохраняются или ухудшаются, либо в случае развития новых симптомов следует прекратить использование препарата и проконсультироваться с врачом.

Предупреждения и меры предосторожности при комбинированной терапии спрея с трансдермальным пластырем Никоретте аналогичны предупреждениям и мерам предосторожности при применении каждого из препаратов по отдельности.

Вспомогательные вещества

Данный лекарственный препарат содержит небольшое количество этанола (алкоголя), менее чем 100 мг на дозу.

Дети

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 4.9).

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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.

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 в идеале отказ от курения во время беременности должен осуществляться без никотин-заместительной терапии. Однако если женщина не в состоянии (или это предполагается) отказаться от курения без фармакологической поддержки, то применяют никотин-заместительную терапию, поскольку продолжение курения несет в себе больший риск для плода по сравнению с никотин-заместительной терапией. 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. Применение беременной женщиной спрея Никоретте следует начинать только после консультации с врачом.

Лактация

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

Лекарственные формы для периодического применения минимизируют содержание никотина в грудном молоке и позволяют осуществлять грудное вскармливание при наименьшей концентрации никотина в нем. С целью уменьшения отрицательного влияния никотина на ребенка препарат следует применять сразу же после кормления.

Периоды между применением препарата и следующим кормлением должны быть максимально длинными (рекомендуется не менее 2 часов).

Фертильность

Курение увеличивает риск развития бесплодия у мужчин и женщин. Исследования *in vitro* показали, что никотин негативно влияет на качество спермы у мужчин.

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

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Вне зависимости от используемой лекарственной формы препарата, содержащего никотин, некоторые симптомы могут быть обусловлены отменой никотина вследствие прекращения курения. К ним относятся следующие проявления: 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; кашель; афтозные язвы; назофарингит. Причинно-следственная связь не установлена.

Помимо этого, у лиц, использующих спрей для слизистой оболочки полости рта, 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.

Аллергические реакции (такие как ангионевротический отек, крапивница и анафилактический шок) могут возникать у предрасположенных к этому лиц.

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.

Резюме в форме таблицы нежелательных реакций

Критерии оценки частоты возникновения нежелательных реакций: 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).

По данным клинических исследований:

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные явления
Нарушения со стороны иммунной системы	Часто:	Реакции гиперчувствительности*
Нарушения со стороны нервной системы	Очень часто: Часто:	Головная боль* Изменение вкуса, парестезия*
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	Очень часто:	Икота, раздражение глотки
Желудочно-кишечные нарушения	Очень часто: Часто:	Тошнота*

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные явления
		Боль в животе, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, гиперсекреция слюны, стоматит, рвота*
Общие нарушения и реакции в месте введения	Часто:	Чувство жжения в месте применения, утомляемость*

По данным постмаркетинговых исследований:

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные явления
Нарушения со стороны иммунной системы	Частота неизвестна:	Аллергические реакции, включая ангионевротический отек и анафилактический шок*
Психические нарушения	Нечасто:	Необычные сновидения*
Нарушения со стороны нервной системы	Неизвестно:	Судороги*
Нарушения со стороны органа зрения	Частота неизвестна	Нечеткость зрения, усиление слезотечения
Нарушения со стороны сердца	Нечасто:	Ощущение сердцебиения*, тахикардия*, фибрилляция предсердий
Нарушения со стороны сосудов	Нечасто:	Гиперемия*, гипертензия*
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов	Нечасто:	Бронхоспазм, ринорея, дисфония, одышка*, заложенность носа, боль в ротоглотке, чихание, чувство стеснения в горле

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные явления
грудной клетки и средостения:		
Желудочно-кишечные нарушения	Часто: Нечасто: Редко: Частота неизвестна	Диарея Отрыжка, глоссит, отслоение слизистой оболочки полости рта, парестезия полости рта Дисфагия, гипестезия полости рта, позывы на рвоту Сухость в глотке, желудочно-кишечный дискомфорт*, боль в губах
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто: Частота неизвестна	Повышенная потливость*, зуд*, высыпания на коже*, крапивница* Эритема*
Общие нарушения и реакции в месте введения	Нечасто:	Астения*, боль и дискомфорт в грудной клетке*, недомогание*

* Системные реакции

Нежелательные реакции, наблюдающиеся при комбинированной терапии с пластырем трансдермальным, отличаются от таковых при использовании каждого из препаратов по отдельности только в отношении местных нежелательных явлений, связанных с конкретными лекарственными формами. Частота этих нежелательных реакций сравнима с частотой, приведенной в инструкции по применению для каждого препарата.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
<http://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

Республика Беларусь

Министерство Здравоохранения Республики Беларусь, Республиканское Унитарное
Предприятие РУП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

Адрес: 220037, г. Минск, пер. Товарищеский, 2а

Телефон/факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: <https://www.rceth.by/>

Республика Армения

ГНКО «Центр экспертизы лекарств и медицинских технологий»

Адрес: 0051, г. Ереван, пр. Комитаса, 49/5

Телефон: (+374 10) 20-05-05; (+374 96) 22-05-05

Электронная почта: vigilance@pharm.am

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: www.pharm.am

Кыргызская Республика

Департамент лекарственных средств и медицинских изделий при Министерстве
Здравоохранения Кыргызской Республики

Адрес: 720044, г. Бишкек, ул. 3-я Линия, 25

Телефон: 0800 800 26 26; (+996) 312 21-92-86

Электронная почта: pharm@dlsmi.kg

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: <https://dlsmi.kg/>

4.9. 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. В случае передозировки необходимо незамедлительно обратиться за медицинской помощью.

Лечение

Следует немедленно прекратить применение никотина и начать симптоматическое лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: N07BA01.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

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

Резкий отказ от курения вызывает развитие характерного синдрома отмены, включая тягу к курению.

Клинические исследования показали, что препараты для заместительной никотиновой терапии позволяют курильщикам воздержаться от курения, облегчая симптомы отмены. Исследование разовой дозы у 200 здоровых курильщиков продемонстрировало, что при использовании двух доз спрея по 1 мг желание закурить снижается, начиная с первой минуты после применения спрея и в значительно большей степени, чем при применении таблеток для рассасывания, содержащих никотин. По сравнению с никотиновой резинкой жевательной или таблетками для рассасывания, абсорбция никотина из спрея для слизистой оболочки полости рта более быстрая (см. раздел 5.2) 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. Важным симптомом синдрома отмены является также желание курить.

5.2. Фармакокинетические свойства

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

Фармакокинетика спрея для слизистой оболочки полости рта изучена в четырех исследованиях, включавших 141 субъект.

Абсорбция

Лекарственная форма спрей для слизистой оболочки полости рта предполагает, что доза никотина поступает немедленно и, как следствие, его абсорбция из полости рта быстрая. 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 ч×нг/мл, в сравнении с 0,33 и 0,33 ч×нг/мл).

Значения AUC_{∞} свидетельствуют о том, что биодоступность никотина при нанесении спрея на слизистую оболочку полости рта сходна с биодоступностью при применении таблеток и несколько выше, чем при применении никотиновой жевательной резинки. AUC_{∞} для спрея дозировкой 2 мг равнялась 14,0 ч×нг/мл по сравнению с 23,0 ч×нг/мл для жевательной резинки дозировкой 4 мг и 26,7 ч×нг/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.

Элиминация

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.

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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный

[мятный]

Пропиленгликоль

Этанол дегидратированный

Трометамол

Полоксамер 407

Глицерол

Натрия гидрокарбонат

Левоментол

Ароматизатор мятный бальзамический QL24245

Ароматизатор Cooler 2 SN046680

Сукралоза

Ацесульфам калия

Хлористоводородная кислота 10 %

Вода очищенная

Никоретте, 1 мг/доза, спрей для слизистой оболочки полости рта дозированный

[фруктово-мятный]

Пропиленгликоль

Этанол дегидратированный

Трометамол

Полоксамер 407

Глицерол

Натрия гидрокарбонат

Ароматизатор красный фруктовый 911441

Левоментол

Ароматизатор Cooler 2 SN046680

Сукралоза

Ацесульфам калия

Хлористоводородная кислота 10 %

Вода очищенная

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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 листком-вкладышем заламинированы в прозрачный контурный пластиковый контейнер с картонной основой.

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 к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «ДжейТНЛ»

121614, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Крылатское, ул. Крылатская, д. 17, к. 3, тел. +7 495 726-55-55

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей следует направлять по адресу:

Российская Федерация, Республика Беларусь, Республика Армения, Кыргызская Республика

ООО «ДжейТНЛ», Россия

121614, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Крылатское, ул. Крылатская, д. 17, к. 3, тел. +7 495 726-55-55

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Никоретте доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>