

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МИНЗДРАВРОССИИ

ЛП - 006264-160620

СОГЛАСОВАНО

Ацетилцистеин

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Ацетилцистеин

Международное непатентованное или группировочное наименование:

Ацетилцистеин

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для приема внутрь

Состав

1 пакет дозировкой 600 мг содержит:

действующее вещество: ацетилцистеин – 600,00 мг;

вспомогательные вещества: аскорбиновая кислота – 25,30 мг (25,00 мг в пересчете на 100 % вещество), сорбитол (сорбит) – 1232,70 мг, ароматизатор апельсиновый (ароматизатор пищевой «Апельсин») – 100,00 мг, аспартам – 30,00 мг.

Описание: смесь гранул и порошка белого цвета с желтоватым оттенком с запахом апельсина.

Фармакотерапевтическая группа: отхаркивающее муколитическое средство

Код АТХ: R05CB01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Муколитическое средство, разжижает мокроту, увеличивает ее объем, облегчает отделение мокроты. 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.

Кроме того, 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 мокроте, слизисто-гнойной и слизистой мокроте.

117247

Увеличивает секрецию менее вязких сиаломуцинов бокаловидными клетками, снижает адгезию бактерий на эпителиальных клетках слизистой оболочки бронхов. Стимулирует мукозные клетки бронхов, секрет которых лизирует 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 альфа1-антитрипсин (ингибитор эластазы) от инактивирующего воздействия НОС1 окислителя, вырабатываемого миелопероксидазой активных фагоцитов. Обладает также противовоспалительным действием (за счет подавления образования свободных радикалов и активных кислородсодержащих веществ, ответственных за развитие воспаления в легочной ткани).

Фармакокинетика.

Абсорбция.

Ацетилцистеин хорошо абсорбируется при пероральном приеме. Он немедленно деацетируется до цистеина в печени. В крови наблюдается подвижное равновесие свободного и связанного с белками плазмы ацетилцистеина и его метаболитов (цистеина, цистина, диацетилцистеина). Из-за высокого эффекта «первого прохождения» через печень биодоступность ацетилцистеина составляет около 10 %.

Распределение

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

Метаболизм

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

Выведение

Выводится почками в виде неактивных метаболитов (неорганические сульфаты, диацетилцистеин), незначительная часть выделяется в неизменном виде через кишечник.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) – около 1 ч, при нарушении функции печени увеличивается до 8 ч.

Показания к применению

Острые и хронические заболевания органов дыхания, связанных 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.

Противопоказания

- повышенная чувствительность по отношению к ацетилцистеину или другим компонентам препарата;
- детский возраст до 18 лет;

- беременность и период грудного вскармливания;
- фенилкетонурия;
- непереносимость фруктозы, т.к. препарат содержит сорбитол;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения;
- кровохарканье, легочное кровотечение.

С осторожностью

- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе;
- варикозное расширение вен пищевода;
- заболевания надпочечников;
- печеночная и/или почечная недостаточность;
- непереносимость гистамина (ацетилцистеин влияет на метаболизм гистамина и может привести к возникновению признаков непереносимости, таких как головная боль, вазомоторный ринит, зуд);
- бронхиальная астма;
- артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В целях безопасности из-за недостаточного количества данных в период беременности и кормления грудью применение препарата противопоказано.

Способ применения и дозы

Внутрь. Содержимое пакета растворить в 1/3 стакана воды комнатной температуры и принимать после еды.

При отсутствии других назначений рекомендуется придерживаться следующих дозировок.

Взрослым: 1 раз в день по 1 пакетику (600 мг).

Дополнительный прием жидкости усиливает муколитический эффект препарата.

При острых заболеваниях продолжительность курса лечения составляет от 5 до 10 дней; при лечении хронических заболеваний – до нескольких месяцев (по рекомендации врача).

Побочное действие

Частота развития побочных эффектов классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения:

очень часто: $\geq 1/10$ ($> 10\%$);

часто: от $\geq 1/100$ до $< 1/10$ ($> 1\%$ и $< 10\%$);

нечасто: от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$ ($> 0,1\%$ и $< 1\%$);

редко: от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$ ($> 0,01\%$ и $< 0,1\%$);

очень редко: $< 1/10000$ ($< 0,01\%$);

частота неизвестна: частота не может быть оценена на основании имеющихся данных.

Со стороны нервной системы:

редко – головная боль.

Со стороны пищеварительной системы:

нечасто - абдоминальная боль;

редко – воспаление слизистой оболочки рта (стоматит);

очень редко – диарея, рвота, изжога, тошнота;

частота неизвестна – диспепсия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

очень редко – снижение артериального давления, увеличение частоты сердечных сокращений (тахикардия).

Аллергические реакции:

очень редко – бронхоспазм (преимущественно у пациентов с гиперреактивностью бронхов), кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, экзантема, ангионевротический отек, анафилактические реакции вплоть до шока, кровотечения в связи с наличием реакций повышенной чувствительности;

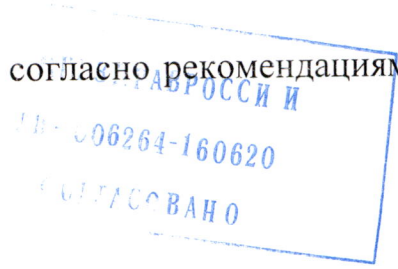
частота неизвестна – синдром Стивенса-Джонсона и синдром Лайелла (токсический эпидермальный некролиз).

Прочие:

нечасто - лихорадка.

редко – шум в ушах, одышка;

частота неизвестна – снижение агрегации тромбоцитов.



При развитии побочных явлений следует отменить прием препарата и обратиться к врачу.

Передозировка

Ацетилцистеин при приеме в дозах 500 мг/кг/день не вызывает симптомов передозировки.

При ошибочной или преднамеренной передозировке наблюдаются такие явления, как диарея, рвота, боли в желудке, изжога и тошнота. До настоящего времени не наблюдалось тяжелых и опасных для жизни побочных явлений.

Лечение симптоматическое.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

При одновременном применении ацетилцистеина и *противокашлевых* средств из-за подавления кашлевого рефлекса может возникнуть застой слизи. Поэтому подобные комбинации следует подбирать с осторожностью.

Одновременный прием ацетилцистеина и *нитроглицерина* может привести к усилению сосудорасширяющего действия последнего.

Фармацевтически несовместим с *антибиотиками* (пенициллинами, цефалоспорины, эритромицином, тетрациклином и амфотерицином В) и протеолитическими ферментами.

При контакте с металлами, резиной образуются сульфиды с характерным запахом.

Уменьшает всасывание пенициллинов, цефалоспоринов, тетрациклина (их следует принимать не ранее, чем через 2 часа после приема внутрь ацетилцистеина).

Ацетилцистеин устраняет токсические эффекты парацетамола.

Одновременное применение ацетилцистеина и карбамазепина может выражаться в субтерапевтических уровнях карбамазепина.

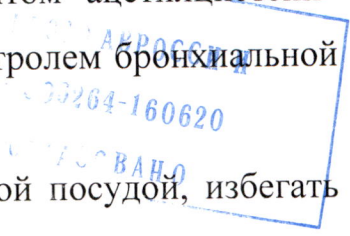
Активированный уголь способен снижать действие ацетилцистеина.

Ацетилцистеин может влиять на результаты колориметрического определения салицилатов.

Ацетилцистеин может оказывать влияние на анализ кетонов в моче.

Особые указания

Дополнительный прием жидкости усиливает муколитический эффект препарата.



Больным с бронхиальной астмой и обструктивным бронхитом ацетилцистеин следует назначать с осторожностью под систематическим контролем бронхиальной проходимости.

При работе с препаратом необходимо пользоваться стеклянной посудой, избегать контакта с металлами, резиной, кислородом, легко окисляющимися веществами.

Для больных сахарным диабетом:

1 пакет содержит 0,12 ХЕ.

Препарат содержит аспартам, поэтому не рекомендуется его применение у больных фенилкетонурией.

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). При применении ацетилцистеина очень редко сообщалось о случаях развития тяжелых аллергических реакций, таких как синдром Стивена-Джонсона и синдром Лайелла. При возникновении изменений кожи и слизистых оболочек следует немедленно обратиться к врачу, прием препарата необходимо прекратить.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

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

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для приема внутрь 600 мг.

По 2 г в термосвариваемые пакеты из материала упаковочного комбинированного «буфлен» (бумага+полиэтилен+фольга+полиэтилен).

По 6, 10 или 20 пакетов вместе с инструкцией по применению помещают в пачки из картона для потребительской тары.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

В сухом месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель/ Организация, принимающая претензии потребителей

ОАО «Марбиофарм»,

424006, Россия, Республика Марий Эл, г. Йошкар-Ола, ул. К. Маркса, 121,

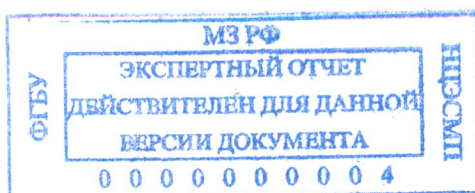
тел.: (8362) 42-03-12, факс: (8362) 45-00-00



**Генеральный директор
ОАО «Марбиофарм»**



М.А. Толмачев



117247