Инструкция по применению
Никоретте® Спрей никотиновый от курения 150 доз мятный 1 мг/доза 13,2 мл 2 шт

Характеристики



Форма выпуска: Спрей
Страна: Швеция
Производитель: МакНил АБ
Порядок отпуска: без рецепта
Действующее вещество: Никотин
Количество в упаковке: 2
Дозировка действующего вещества: 1 мг/доза
Срок годности: 24.0

Действующее вещество

Никотин

Состав

1 мл препарата содержит: Действующее вещество: никотин – 13,6 мг; Вспомогательные вещества: пропиленгликоль – 150,0 мг, этанол – 97,0 мг, трометамол – 40,5 мг, полоксамер – 40,0 мг, глицерол – 25,0 мг, натрия гидрокарбонат – 14,3 мг, левоментол – 10,0 мг, ароматизатор мятный QL24245 – 4,0 мг, ароматизатор Cooler 2 SN046680 – 3,0 мг, сукралоза – 1,5 мг, ацесульфам калия – 1,5 мг, хлористоводородная кислота 10 % – достаточное количество до pH 9, вода очищенная – достаточное количество до 1 мл.

Форма выпуска

Спрей

Фармакокинетика

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. **_Всасывание_** 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. **_Выведение_** Средний плазменный клиренс никотина равен 70 л /час, период полувыведения составляет 2–3 ч. Основными метаболитами никотина, обнаруживаемыми в моче, являются котинин (12% введенной дозы) и транс-3-гидроксикотинин (37% введенной дозы). Примерно 10% никотина выводится с мочой в неизмененном виде. При высокой скорости фильтрации и pH мочи ниже 5 количество никотина, выводимого с мочой в неизменном виде, может достигать 30%.

Линейность/нелинейность При 1, 2, 3 и 4 нажатиях спрея с дозировкой 1 мг/доза выявлено лишь незначительное отклонение от линейности AUC∞ и Cmax. **_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.

Показания

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.

Способ применения и дозы

Для нанесения на слизистую оболочку полости рта. Пациент должен сделать все возможное, чтобы окончательно бросить курить при лечении спреем Никоретте®. **_Взрослые старше 18 лет_** Спрей Никоретте® следует применять в тот момент, когда возникает непреодолимое желание закурить. После подготовки спрея к использованию (см. ниже Инструкцию по использованию при первом применении спрея) 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 «Передозировка») применение препарата необходимо немедленно прекратить. _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 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, 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_ Курильщикам, желающим снизить количество выкуриваемых сигарет, 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 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: _Дети и подростки младше 18 лет_ Не рекомендуется применять препарат лицам младше 18 лет. Опыт лечения подростков в возрасте до 18 лет спреем отсутствует.

Применение при беременности и кормлении грудью

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. **_Грудное вскармливание_** 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). Курение увеличивает риск развития бесплодия у мужчин и женщин. Исследования _in vitro_ показали, что никотин негативно влияет на качество спермы у мужчин.

Побочные действия

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. Критерии оценки частоты возникновения побочных эффектов: очень частые (≥1/10); частые (≥1/100, <1/10); нечастые (≥1/1000, <1/100); редкие (≥1/10000, <1/1000); очень редкие (<1/10000); неизвестно (оценка на основании имеющихся данных невозможна). По данным клинических исследований: По данным постмаркетинговых исследований: * 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.

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. _Лечение_ Следует немедленно прекратить применение никотина и начать симптоматическое лечение. При необходимости следует начать искусственную вентиляцию легких. Прием активированного угля препятствует всасыванию никотина в желудочно-кишечном тракте.

Взаимодействие с другими препаратами

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.

Особые указания

Применение препарата Никоретте® сопровождается меньшим риском, чем курение. _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_ Проглатываемый никотин может обострять симптомы эзофагита, гастрита или пептической язвы, поэтому применять препараты для пероральной никотин-заместительной терапии при указанной патологии следует 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. _Опасность для маленьких детей_ 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 «Передозировка»). _Феохромоцитома и неконтролируемый гипертиреоз_ У пациентов с неконтролируемым гипертиреозом и феохромоцитомой применять препарат надлежит с осторожностью, поскольку никотин вызывает высвобождение катехоламинов. _Формирование зависимости_ Может развиться 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. _Вспомогательные вещества_ Спрей Никоретте® содержит малое количество этанола (спирт) – менее 10 мг на дозу. При применении спрея Никоретте® следует соблюдать осторожность и не допускать попадания спрея в глаза. Предупреждения и меры предосторожности при комбинированной терапии спрея с трансдермальным пластырем

Никоретте®аналогичны предупреждениям и мерам предосторожности при применении каждого из препаратов по отдельности. 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! Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.