Никоретте



Код АТХ:

- N07BA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Никотин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

◊ ***Трансдермальная терапевтическая система (ТТС)*** с площадью контактной поверхности 10 см^2; представляет собой пластырь прямоугольной формы с закругленными краями, одна сторона светло-коричневого цвета с надписью "nicorette", вторая сторона - клейкая, серебристо-белого цвета, покрыта прозрачной синтетической защитной пленкой.

	1 см ^{2}	**доза, выделяемая ТТС за 16 ч**
никотин	830 мкг	5 мг

Вспомогательные вещества: пленка подложки, нетканый полиэфир, полиизобутилен среднемолекулярный, полиизобутилен низкомолекулярный, полибутен, силиконизированный полиэфир.

1 шт. - саше (7) - пачки картонные.
1 шт. - саше (14) - пачки картонные.

◊ ***Трансдермальная терапевтическая система (ТТС)*** с площадью контактной поверхности 20 см^2; представляет собой пластырь прямоугольной формы с закругленными краями, одна сторона светло-коричневого цвета с надписью "nicorette", вторая сторона - клейкая, серебристо-белого цвета, покрыта прозрачной синтетической защитной пленкой.

	1 см ^{2}	**доза, выделяемая ТТС за 16 ч**
никотин	830 мкг	10 мг

Вспомогательные вещества: пленка подложки, нетканый полиэфир, полиизобутилен среднемолекулярный, полиизобутилен низкомолекулярный, полибутен, силиконизированный полиэфир.

1 шт. - саше (7) - пачки картонные.
1 шт. - саше (14) - пачки картонные.

◊ ***Трансдермальная терапевтическая система (ТТС)*** с площадью контактной поверхности 30 $см^2$; представляет собой пластырь прямоугольной формы с закругленными краями, одна сторона светло-коричневого цвета с надписью "nicorette", вторая сторона - клейкая, серебристо-белого цвета, покрыта прозрачной синтетической защитной пленкой.

	1 $см^2$	**доза, выделяемая ТТС за 16 ч**
никотин	830 мкг	15 мг

Вспомогательные вещества: пленка подложки, нетканый полиэфир, полиизобутилен среднемолекулярный, полиизобутилен низкомолекулярный, полибутен, силиконизированный полиэфир.

1 шт. - саше (7) - пачки картонные.
1 шт. - саше (14) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Разные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство для лечения никотиновой зависимости. После резкого отказа от курения у пациентов, ежедневно использующих табакосодержащие продукты в течение длительного времени, возможно развитие синдрома отмены, который включает в себя: дисфорию, бессонницу, повышенную раздражительность, тревогу, нарушение концентрации внимания, снижение ЧСС, увеличение аппетита или прибавку в весе. Важным симптомом синдрома отмены является также желание курить.

При лечении табачной зависимости заместительная терапия никотином может снижать потребность в курении (и количество выкуриваемых сигарет), уменьшать выраженность симптомов отмены, возникающих при полном отказе от курения у тех, кто решил бросить курить. Облегчает временное воздержание от курения и способствует уменьшению количества выкуриваемых сигарет у тех, кто не может или не хочет полностью отказаться от курения.

Фармакокинетика

Фармакокинетика никотина сопоставима при наложении пластыря на кожу руки или бедра.

Всасывание

После наложения пластыря с никотином на кожу руки или бедра примерно 95% высвобождающегося никотина поступает в системный кровоток. Оставшаяся часть испаряется по краям пластыря. На всех пластырях указано среднее количество никотина, которое всасывается у среднего пациента в течение 16 ч.

C_{max} никотина в плазме крови после наложения пластыря достигается через 6-10 ч и после применения пластыря 15 мг/16 ч составляет 9-15 нг/мл. Если пластырь 15 мг/16 ч оставляют на 24 ч (а не на 16 ч), то концентрация никотина в течение последних 8 ч снижается в среднем с 7.2 до 5.6 нг/мл. При использовании пластырей меньшего размера можно ожидать сходных изменений концентрации никотина в плазме.

При использовании трех дозировок пластыря концентрации никотина в плазме несколько отличались от пропорционального увеличения дозы: при увеличении размера пластыря соответствующее увеличение концентрации было несколько ниже ожидаемого.

Распределение

V_d никотина при в/в введении составляет около 2-3 л/кг. Связывание никотина с белками плазмы крови составляет менее 5%. В связи с этим нарушения связывания никотина при одновременном применении других препаратов или изменения количества белка в плазме при различных заболеваниях не должны оказывать существенного влияния на кинетику никотина.

При повторном применении пластыря концентрация никотина существенно не превышает таковую после его однократного наложения.

Метаболизм

Никотин метаболизируется в печени, почках и легких. Идентифицировано более 20 метаболитов, которые уступают по активности никотину. Концентрация первичного метаболита - котинина - превышает концентрацию никотина в 10 раз.

Выведение

Выводится в основном печенью. Средний плазменный клиренс составляет около 70 л/ч. $T_{1/2}$ - около 2 ч.

С мочой выводятся в основном котинин (15% дозы, $T_{1/2}$ - 15-20 ч) и транс-3-гидрокси-котинин (45% дозы). 10-30% дозы никотина выводится с мочой в неизмененном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Прогрессирующее ухудшение функции почек сопровождается снижением общего клиренса никотина.

Фармакокинетика никотина существенно не меняется у больных с циррозом печени с незначительно выраженными нарушениями функции печени (5 баллов по шкале Чайлд-Пью) и снижается у пациентов с циррозом печени с умеренно выраженными нарушениями функции печени (7 баллов по шкале Чайлд-Пью).

У курильщиков, находящихся на гемодиализе, отмечали повышение концентрации никотина в плазме крови.

У пожилых пациентов отмечается небольшое снижение общего клиренса никотина, что не требует коррекции дозы.

Показания к применению:

— лечение табачной зависимости путем снижения потребности в никотине;

— снятие симптомов отмены, возникающих при отказе от курения у пациентов, имеющих соответствующую мотивацию.

Относится к болезням:

- Табачная зависимость

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью и только после консультации врача* следует назначать препарат пациентам, перенесшим сердечно-сосудистое заболевание, или госпитализировавшимся по этому поводу в течение предыдущих 4 недель (в т.ч. инсульт, инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, аритмия, аортокоронарное шунтирование, ангиопластика), или имеющих неконтролируемую артериальную гипертонию.

С *осторожностью* следует назначать препарат больным с умеренными или выраженными нарушениями функции печени, тяжелой почечной недостаточностью, обострением язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки.

С *осторожностью* следует применять препарат пациентам с неконтролируемым гипертиреозом, феохромоцитомой (в связи с тем, что никотин вызывает высвобождение катехоламинов из мозгового слоя надпочечников).

Способ применения и дозы:

У **взрослых (в т.ч. у лиц пожилого возраста)** лечение начинают с применения 1 пластыря 15 мг/16 ч (30 $см^2$), который накладывают на неповрежденную кожу ежедневно утром (непосредственно после пробуждения) и удаляют перед сном.

Длительность начального периода терапии определяется индивидуально, при этом обычно она составляет, по крайней мере, 3 мес. Затем заместительную терапию постепенно отменяют. При этом в течение 2-3 недель ежедневно накладывают по одному пластырю 10 мг/16 ч (20 $см^2$), а в течение последующих 2-3 недель – по одному пластырю 5 мг/16 ч (10 $см^2$).

Применять пластыри в течение более 6 месяцев обычно не рекомендуется.

В некоторых случаях лицам, бросившим курить, может потребоваться более длительная терапия.

Побочное действие:

При применении пластырей Никоретте возможно развитие нежелательных дозозависимых (в основном) эффектов, сходных с эффектами, возникающими при применении никотина, поступающего в организм другим путем.

При описании побочных эффектов используются следующие критерии частоты встречаемости: очень часто (>1/10), часто (>1/100 <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000), включая отдельные случаи.

Головокружение, головная боль, бессонница могут быть проявлениями синдрома отмены, вызванного отказом от курения. При отказе от курения может увеличиваться частота возникновения афтозного стоматита (причина неизвестна).

Местные реакции: около 20% - умеренно выраженные покраснения, зуд.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения; очень редко – фибрилляции предсердий.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота.

Дерматологические реакции: нечасто - крапивница.

Со стороны организма в целом: очень часто - зуд в первые недели лечения; часто - эритема.

Передозировка:

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

Симптомы: тошнота, слюноотделение, боль в животе, диарея, потливость, головная боль, головокружение, нарушение слуха, выраженная слабость (сходны с проявлениями острого отравления никотином). При применении высоких доз никотина возможны снижение АД, слабый и нерегулярный пульс, затруднение дыхания, циркуляторный коллапс, генерализованные судороги, прострация.

Никотин в переносимых взрослыми курильщиками дозах может вызвать выраженные интоксикации у маленьких детей (в т.ч. со смертельным исходом).

Лечение передозировки: следует немедленно прекратить применение препарата (снять пластырь) и начать проведение симптоматической терапии. Активированный уголь снижает всасывание никотина из ЖКТ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Вопрос о возможности применения препарата при беременности решается индивидуально.

Никотин проникает через плацентарный барьер и оказывает влияние на дыхательную систему и кровообращение плода (в зависимости от дозы). Риск для плода, связанный с применением препарата при беременности, полностью не изучен. Польза заместительной терапии никотином для беременных, которые не могут бросить курить, значительно перевешивает риск, связанный с продолжающимся курением.

Никотин (даже при применении в терапевтических дозах) в небольших количествах выделяется с грудным молоком и может оказывать влияние на новорожденного. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Курение (но не применение никотина) вызывает повышение активности изофермента CYP1A2. После прекращения курения может наблюдаться снижение клиренса субстратов этого фермента, что может привести к повышению концентрации некоторых лекарственных средств в плазме крови, что имеет потенциальное клиническое значение при одновременном использовании препаратов, характеризующихся малой широтой терапевтического действия (теофиллин, такрин, клозапин, ропинирол).

После прекращения курения в плазме могут повышаться концентрации других лекарственных средств, которые частично метаболизируются под действием изофермента CYP1A2 (таких как имипрамин, оланзапин, кломипрамин, флувоксамин), хотя данные, подтверждающие это, отсутствуют, а возможное клиническое значение такого взаимодействия не известно.

Ограниченные данные свидетельствуют о том, что курение может индуцировать метаболизм флекаинида и пентазоцина.

Особые указания и меры предосторожности:

Больным сахарным диабетом после прекращение курения может потребоваться снижение доз инсулина.

Использование в педиатрии

Вопрос о назначении препарата **пациентам в возрасте младше 18 лет** решается врачом индивидуально. Опыт применения пластыря в этой возрастной группе ограничен.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат больным с тяжелой почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат больным с умеренными или выраженными нарушениями функции печени.

Применение в детском возрасте

Вопрос о назначении препарата **пациентам в возрасте младше 18 лет** решается врачом индивидуально. Опыт применения пластыря в этой возрастной группе ограничен.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Срок годности – 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

Источник: http://drugs.thead.ru/Nikorette