Никотинелл



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]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Н-холиномиметик. Алкалоид, содержащийся в листьях табака (Nicotiana tabacum и Nicotiana rustica), а также в некоторых других растениях. Влияет на периферические и центральные н-холинорецепторы. Наиболее чувствительны к никотину н-холинорецепторы вегетативных ганглиев, на которые никотин оказывает двухфазное действие. В фазу возбуждения происходит деполяризация мембран ганглионарных нейронов, фаза угнетения обусловлена конкурентным антагонизмом с ацетилхолином.

Никотин стимулирует хеморецепторы синокаротидной зоны, что сопровождается рефлекторным возбуждением дыхательного и сосудодвигательного центров. Фаза угнетения наблюдается при накоплении в крови значительного количества никотина.

В низких дозах никотин возбуждает н-холинорецепторы хромаффинных клеток надпочечников и потому увеличивает выделение в кровь адреналина. В высоких дозах никотин вызывает противоположный эффект.

В дозах, значительно превышающих те, которые необходимы для воздействия на вегетативные ганглии, никотин сначала облегчает, а затем угнетает нервно-мышечную передачу.

При действии никотина на синаптическую передачу в ЦНС также наблюдается двухфазность: в низких дозах вещество вызывает возбуждающий эффект, в больших - тормозный.

ЧСС после введения никотина сначала замедляется (возбуждение центра блуждающих нервов и интрамуральных парасимпатических ганглиев), затем учащается (стимуляция симпатических ганглиев и увеличение адреналина хромаффинными клетками).

Никотин в низких дозах повышает АД, что обусловлено возбуждением симпатических ганглиев и сосудодвигательного центра, повышением выделения адреналина мозговым слоем надпочечников и прямым миотропным сосудосуживающим влиянием.

Действие никотина часто проявляется тошнотой (центрального происхождения), иногда рвотой. Моторику кишечника никотин повышает. Секреция слюнных и бронхиальных желез сначала повышена, затем следует угнетение.

Фармакокинетика

Хорошо всасывается со слизистых оболочек (биодоступность зависит от уровня pH). $T_{1/2}$ из плазмы - 2 ч. Выводится

почками в первые 10-15 ч (в виде продуктов метаболизма и небольшого количества алкалоидов и в неизмененном виде). Проникает в грудное молоко, может создавать в нем высокие концентрации, достаточные для развития интоксикации, в т.ч. остановки дыхания у ребенка. При применении жевательной резинки через 20-30 мин высвобождается около 90% никотина, который легко абсорбируется в кровь через слизистую оболочку полости рта (всасывание увеличивает входящий в состав щелочной гидрокарбонатный буфер, увеличивающий pH слюны до 8.5). Биодоступность составляет 50%. Концентрация никотина в крови повышается медленнее и не достигает значений, определяемых во время курения: через 30 мин она составляет 1/3-2/3 уровня, который наблюдается при выкуривании 1 сигареты. При многократном применении резинки обеспечивается привычное содержание никотина в крови.

Показания к применению:

Для облегчения явлений абстиненции (синдрома отмены), связанных с прекращением курения табака.

Противопоказания:

Нестабильная стенокардия, тяжелые аритмии, недавно перенесенное нарушение мозгового кровообращения, эрозивно-язвенные нарушения ЖКТ в фазе обострения, беременность, лактация.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от степени зависимости от табака и применяемой лекарственной формы.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, тревожные состояния.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, боли в животе, раздражение слизистой оболочки полости рта, икота, метеоризм, болезненность или раздражение языка; при использовании жевательных резинок - боли в жевательных мышцах, стоматит, повреждение эмали зубов при прилипании к ним жевательной резинки.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии; редко - тахикардия, гиперемия кожи.

Дерматологические реакции: при применении трансдермальных терапевтических систем - зуд, эритема, дерматит, пузыри на коже, крапивница.

Прочие: аллергические реакции, фарингит.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Никотин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания). Хорошо проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Особые указания и меры предосторожности:

Никотин хорошо всасывается со слизистых оболочек и кожных покровов, проникает через ГЭБ.

Никотин применяется в экспериментальной фармакологии для анализа действия веществ. В связи с широким распространением курения табака никотин представляет значительный интерес в токсикологическом отношении. В медицинской практике применение ограничивается использованием для облегчения отвыкания от курения.

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