

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

NiQuitin 2 mg, pastylki do ssania

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Nicotinum

1 pastylka do ssania zawiera 2 mg nikotyny (w postaci nikotyny z kationitem).

Substancje pomocnicze (w jednej pastylce)

Aspartam (E951) 6 mg

Mannitol (E421) 1035 mg

Sód 17 mg

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Pastylka do ssania

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Pastylki do ssania NiQuitin wskazane są do łagodzenia objawów wynikających z odstawienia nikotyny, w tym uczucia głodu nikotynowego, związanych z rzucaniem palenia tytoniu. Jeżeli to możliwe, podczas rzucania palenia, pastylki do ssania NiQuitin należy stosować jednocześnie z programem wspierającym rzucenie palenia.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli (w tym osoby w podeszłym wieku):

Pastylki do ssania NiQuitin 2 mg są wskazane dla palaczy, którzy wypalają pierwszego papierosa po upływie przynajmniej 30 minut po przebudzeniu.

Pastylki do ssania NiQuitin 4 mg są wskazane dla palaczy, którzy wypalają pierwszego papierosa przed upływem 30 minut po przebudzeniu.

Podczas leczenia pastulkami NiQuitin pacjenci całkowicie zaprzestać palenia tytoniu. Osoby stosujące NiQuitin powinny przestrzegać podanego poniżej schematu dawkowania:

| | | | |
|-------------------------|-------------------------|---------------------------|--|
| Stopień 1 | | | |
| Tydzień 1. do 6. | Stopień 2 | | |
| | Tydzień 7. do 9. | Stopień 3 | |
| | | Tydzień 10. do 12. | Aby móc powstrzymać się od palenia przez kolejne 12 tygodni: |

| | | | |
|-------------------------------------|--------------------------------------|--------------------------------------|---|
| początkowy okres kuracji | okres kuracji ze zmniejszeniem dawki | okres kuracji ze zmniejszeniem dawki | należy stosować 1 lub 2 pastylki na dobę tylko w przypadkach silnej ochoty na zapalenie papierosa |
| 1 pastylka do ssania co 1-2 godziny | 1 pastylka do ssania co 2-4 godziny | 1 pastylka do ssania co 4-8 godzin | |

Od 1. do 6. tygodnia zalecane jest stosowanie co najmniej 9 pastylek na dobę.

Nie należy stosować więcej niż 15 pastylek na dobę.

Leku nie należy stosować dłużej niż przez 24 tygodnie (6 miesięcy). W razie konieczności lekarz może zdecydować o przedłużeniu kuracji ponad ten okres.

Sposób stosowania:

Jedną pastylkę umieścić w jamie ustnej i pozostawić do rozpuszczenia. Od czasu do czasu należy ją przemieszczać z jednej strony jamy ustnej na drugą, dopóki całkowicie się nie rozpuści (około 20-30 minut). Pastylki nie należy żuć ani połykać w całości.

Trzymając pastylkę w jamie ustnej należy powstrzymać się od jedzenia i picia.

Dzieci i młodzież:

Nie oceniano bezpieczeństwa i skuteczności leku u dzieci i młodzieży palących tytoń. Nie zaleca się stosowania pastylek NiQuitin u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat.

4.3 Przeciwwskazania

Produkt leczniczy NiQuitin pastylki do ssania jest przeciwwskazany:

- w razie nadwrażliwości na nikotynę lub którąkolwiek substancję pomocniczą preparatu;
- u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat oraz u osób niepalących;
- u osób chorych na fenyloketonurię;
- u osób z nadwrażliwością na orzeszki ziemne lub soję;
- u osób z niestabilną lub nasilającą się dławicą piersiową, dławicą Prinzmetalą lub ciężkimi zaburzeniami rytmu serca;
- u osób po niedawno przebytych zawale mięśnia sercowego lub udarze niedokrwiennym mózgu.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Preparat należy ostrożnie stosować w przypadkach:

- niekontrolowanego nadciśnienia tętniczego;
- choroby wrzodowej żołądka;
- umiarkowanych do ciężkich zaburzeń czynności wątroby i/lub ciężkich zaburzeń czynności nerek;
- guza chromochłonnego nadnerczy, nadczynności tarczycy, cukrzycy;
- schorzeń układu sercowo-naczyniowego (np. stabilna dławica piersiowa, niewydolność serca, zaburzenia krążenia mózgowego, schorzenia przebiegające ze skurczem naczyń, ciężkie schorzenia naczyń obwodowych).

Połączenie środka zawierającego nikotynę może spowodować nasilenie objawów u osób z czynnym zapaleniem przełyku, zapaleniem jamy ustnej lub gardła, zapaleniem błony śluzowej żołądka lub wrzodem trawiennym.

Pastylki do ssania NiQuitin nie zawierają cukru lecz zawierają aspartam ulegający przemianie do fenyloalaniny, dlatego preparat jest przeciwwskazany do stosowania u osób chorych na fenyloketonurię.

Jedna pastylka zawiera 17 mg sodu.

Lek zawiera laktozę. Pacjenci z rzadkimi dziedzicznymi zaburzeniami związanymi z nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy (typu Lapp) lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy nie powinni przyjmować tego preparatu.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Zaprzestanie palenia i jednocześnie przyjmowanie lub nieprzyjmowanie preparatu z nikotyną, może zmienić reakcję organizmu na inne jednocześnie przyjmowane leki u byłych palaczy.

Po zaprzestaniu palenia należy zmienić dawkowanie następujących leków:

| Leki, których dawki należałoby zmniejszyć w przypadku zaprzestania palenia | Prawdopodobny mechanizm działania |
|--|--|
| Kofeina, teofilina, imipramina, pentazocyna, fenacetyna, fenylbutazon, takryna, klomipramina, olanzapina, fluwoksamina i flekainid | Zmniejszenie aktywności enzymów wątrobowych |
| Insulina | Zwiększenie absorpcji insuliny po podaniu podskórnym |
| Leki blokujące receptory adrenergiczne np.: prazosyna, propranolol | Zmniejszenie stężenia amin katecholowych we krwi |
| Leki, których dawki należałoby zwiększyć w przypadku zaprzestania palenia | Prawdopodobny mechanizm działania |
| Agoniści adrenergiczni np. izoprenalina, salbutamol | Zmniejszenie stężenia amin katecholowych we krwi |

4.6 Ciąża i laktacja

Udowodniono szkodliwy wpływ palenia na zdrowie kobiet ciężarnych i płodu.

Palenie papierosów przez kobietę ciężarną powoduje małą masę urodzeniową noworodków, zwiększone ryzyko poronienia samoistnego i zwiększoną śmiertelność okołoporodową.

Nikotyna przenika również do mleka. Należy doradzić kobietom ciężarnym, starającym się zajść w ciążę lub karmiącym, aby spróbowały rzucić palenie bez przyjmowania preparatu NiQuitin.

Jeżeli rzucenie palenia się nie powiedzie, lekarz zalecający pastylki NiQuitin powinien ocenić stosunek ryzyka do korzyści zdrowotnych. Jednakże kobiety ciężarne i karmiące piersią nie powinny przyjmować preparatów zawierających nikotynę.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Nie jest znany wpływ preparatu NiQuitin na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

Pastylki do ssania NiQuitin mogą wywołać objawy niepożądane podobne do tych związanych z podaniem nikotyny inną drogą. Objawy te mogą być związane z farmakologicznym oddziaływaniem nikotyny, które jest zależne od dawki.

Przypadki działań niepożądanych związanych z przyjmowaniem leku w porównaniu z grupą przyjmującą placebo – badanie kontrolne:

Zaburzenia układu immunologicznego

Bardzo rzadko: reakcje anafilaktyczne

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Niezbyt często: zaburzenia krzepliwości i związane z nimi krwawienie (krwawienie z dziąseł i nosa)

Zaburzenia psychiczne

Często: bezsenność, niepokój, drażliwość, wzmożony apetyt

Niezbyt często: zły nastrój, wzmożony niepokój, koszmary senne, uczucie głodu, zmiany nastroju.

Zaburzenia układu nerwowego

Często: ból głowy

Niezbyt często: zawroty głowy, miejscowe odrętwienie, zaburzenia smaku

Zaburzenia serca

Niezbyt często: wzmożone palpacje, tachykardia

Zaburzenia naczyniowe

Niezbyt często: zaczerwienienie skóry

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Często: zapalenie gardła

Niezbyt często: kurcz krtani, astma, infekcje dolnych dróg oddechowych, kaszel, podrażnienie nosa lub gardła, zatkanie nosa

Zaburzenia żołądka i jelit

Bardzo często: nudności

Często: wymioty, zgaga, czkawka, podrażnienia lub owrzodzenia jamy ustnej, biegunka, wzdęcia i niestrawność

Niezbyt często: wrzód trawienny, trudności z połykaniem, niestrawność, refluks żołądkowo-przełykowy, przepuklina rozworu przełykowego, zapalenie przełyku, odbijanie się, owrzodzenie błony śluzowej policzków, suchość w ustach i gardle, ból zębów

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Niezbyt często: rumień, świąd, wysypka, miejscowe reakcje skórne, wzmożone pocenie

Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej

Niezbyt często: ból szczęki

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Niezbyt często: moczenie nocne

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Niezbyt często: efekt przedawkowania, ból nogi, obrzęk nóg

Przy klasyfikacji częstości występowania działań niepożądanych zastosowano następujące kryteria: bardzo często (występujące u więcej niż 10% pacjentów), często (występujące u od 1 do 10% pacjentów), niezbyt często (występujące u od 0,1% do 1% pacjentów), rzadko (występujące u od 0,01 do 0,1% pacjentów), bardzo rzadko/ w tym pojedyncze przypadki (występujące u mniej niż 0,01% pacjentów).

Niektóre ze zgłoszonych objawów, takie jak: depresja, drażliwość, niepokój i bezsenność mogą być związane z objawami odstawiennymi w związku z rzuceniem palenia tytoniu. Osoby zaprzestające palenia w jakikolwiek sposób mogą spodziewać się wystąpienia dolegliwości, takich jak ból głowy, zawroty głowy, nasilony kaszel lub przeziębienie.

4.9 Przedawkowanie

Przedawkowanie NiQuitin może wystąpić jeżeli przyjęto zbyt dużą ilość pastylek.

Doustna dawka letalna nikotyny wynosi około 0,5 – 0,75 mg / kg mc. (co jest równoznaczne z przyjęciem ok. 40 – 60 mg nikotyny przez osobę dorosłą).

Nawet niewielka dawka nikotyny może być niebezpieczna dla dzieci. W przypadku podejrzenia zatrucia u dziecka konieczna jest niezwłoczna konsultacja lekarska.

Spodziewane objawy przedawkowania byłyby takie same jak objawy ostrego zatrucia nikotyną i obejmowałyby: błądź, pocenie się, nudności, pieczenie w gardle, ślinotok, wymioty, bóle w jamie brzusznej, biegunkę, ból głowy, zawroty głowy, zaburzenia słyszenia i widzenia, drzenie, stany splątania i osłabienie.

Po znacznym przedawkowaniu mogą wystąpić: stan wyczerpania, niedociśnienie tętnicze, tachykardia, zaburzenia rytmu serca, zapaść krążeniowa i zaburzenia oddychania. Przyjęcie dawki śmiertelnej szybko powoduje wystąpienie drgawek i śmierci w następstwie porażenia układu oddechowego lub rzadziej niewydolności serca.

Postępowanie po zatruciu nikotyną

W przypadku przedawkowania należy wywołać wymioty podając syrop z korzenia wymiotnicy lub wykonać płukanie żołądka (szeroki zgłębnik). Przez zgłębnik należy następnie podać zawiesinę węgla aktywowanego i pozostawić ją w żołądku. W razie konieczności zastosować sztuczne oddychanie z jednoczesnym podawaniem tlenu i prowadzić je przez niezbędny okres wynikający ze stanu poszkodowanego. Inne zabiegi, w tym leczenie wstrząsu, to leczenie objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki stosowane w uzależnieniu od nikotyny

Kod ATC: N07B A01

Nikotyna jest agonistą receptorów nikotynowych obwodowego i ośrodkowego układu nerwowego i ma wyraźny wpływ na ośrodkowy układ nerwowy i układ sercowo-naczyniowy. Przyjmowana w postaci wyrobów tytoniowych powoduje uzależnienie i objawy odstawiennic po rzuceniu palenia. Objawy związane z odstawieniem obejmują: silne odczucie potrzeby palenia, obniżenie nastroju, bezsenność, drażliwość, frustrację lub złość, niepokój, trudności koncentracji, niepokój ruchowy i wzmożony apetyt lub zwiększenie masy ciała. Pastyłki do ssania zastępują część nikotyny dostarczanej przez tytoń i pomagają zmniejszyć natężenie objawów odstawiennic związanych z rzucaniem palenia tytoniu.

Współczynnik redukcji objawów związanych z zaprzestaniem palenia podczas 6-cio tygodniowej kuracji w grupie przyjmującej pastylki do ssania zawierające 2 mg nikotyny wyniósł 46,0% wobec 29,7% w grupie przyjmującej placebo. Po 6-ciu miesiącach wynosił on odpowiednio 24,2% w grupie aktywnej i 14,4% w grupie przyjmującej placebo. Współczynnik szans, w przełożeniu na objawy ośrodkowe, po sześciu tygodniach i sześciu miesiącach wyniósł odpowiednio 2,1 i 1,96.

Współczynnik redukcji objawów związanych z zaprzestaniem palenia podczas 6-cio tygodniowej kuracji w grupie przyjmującej pastylki do ssania zawierające 4 mg nikotyny wyniósł 48,7% wobec 20,8% w grupie przyjmującej placebo. Po 6-ciu miesiącach wynosił on odpowiednio 23,6% w grupie aktywnej i 10,2% w grupie przyjmującej placebo. Współczynnik szans, w przełożeniu na objawy ośrodkowe, po sześciu tygodniach i sześciu miesiącach wyniósł odpowiednio 3,69 i 2,76.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Pastyłki do ssania NiQuitin całkowicie rozpuszczają się w jamie ustnej i cała dawka zawartej w nich nikotyny może ulec wchłonięciu przez błonę śluzową policzków lub połknięciu. Całkowite rozpuszczenie pastylki NiQuitin następuje przeważnie po 20-30 minutach.

Maksymalne stężenie nikotyny w osoczu krwi po przyjęciu pojedynczej dawki 2 mg wynosi około 4,4 ng/ml. W przypadku przyjmowania pastylek w dawce 2 mg co 1,5 godziny, stężenie maksymalne i stężenie między kolejnymi podaniami wynoszą odpowiednio 12,7 i 9,4 ng/ml.

Maksymalne stężenie nikotyny w osoczu krwi po przyjęciu pojedynczej dawki 4 mg wynosi około 10,8 ng/ml. W przypadku przyjmowania pastylek w dawce 4 mg co 1,5 godziny, stężenie maksymalne i stężenie między kolejnymi podaniami wynoszą odpowiednio 26,0 i 19,7 ng/ml.

Zażycie pastylek do ssania NiQuitin niezgodnie z instrukcją dawkowania (żucie pastylki, trzymanie pastylki w jamie ustnej i następnie jej połknięcie, żucie i natychmiastowe połknięcie) nie powoduje szybszego lub większego wchłaniania, lecz znacząca ilość nikotyny (80-93%) również zostaje wchłonięta.

Nikotyna wiąże się z białkami osocza w małym stopniu (4,9% - 20%) dlatego objętość dystrybucji (2,5 l/kg) jest duża. Dystrybucja nikotyny do tkanek zależy od pH; największe stężenia nikotyny stwierdzono w mózgu, żołądku, nerkach i wątrobie.

Nikotyna podlega intensywnym przemianom ustrojowym do licznych metabolitów, a wszystkie z nich są mniej aktywne niż związek macierzysty. Metabolizm nikotyny przede wszystkim dokonuje się w wątrobie lecz również w płucach i nerkach. Nikotyna jest metabolizowana głównie do kotyniny oraz do N'-tlenku kotyniny. Kotynina ma okres półtrwania 15-20 godzin i jej stężenia we krwi są dziesięciokrotnie większe niż stężenia nikotyny. Kotynina jest następnie utleniana do *trans*-3'-hydroksykotyniny, która jest metabolitem nikotyny najobficiej występującym w moczu. Zarówno nikotyna jak i kotynina ulegają sprzężeniu z kwasem glukuronowym.

Okres półtrwania w fazie eliminacji nikotyny z ustroju wynosi około 2 godziny (od 1 do 4 godzin). Całkowity klirens nikotyny wynosi od 62 do 89 l/godzinę. Klirens nienerkowy dla nikotyny oceniany jest na około 75% klirensu całkowitego. Nikotyna i jej metabolity są wydalane prawie wyłącznie z moczem. Wydalanie nie zmienionej nikotyny przez nerki zależy w dużym stopniu od pH moczu, przy czym jest ono większe w warunkach kwaśnego pH.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Ogólna toksyczność nikotyny jest dobrze znana i została uwzględniona w zalecanej dawce. W odpowiednich stężeniach nie stwierdzono właściwości mutagennych nikotyny. Wyniki badań dotyczących rakotwórczości nie wykazują żadnego jednoznacznego dowodu na rakotwórcze działanie nikotyny. W badaniach na ciężarnych zwierzętach, wykazano toksyczny wpływ nikotyny na przebieg ciąży i wynikającą z tego średnią toksyczność nikotyny na płód. Skutki dodatkowe obejmowały opóźnienie wzrostu przed – i poporodowego oraz opóźnienia i zmiany w poporodowym rozwoju ośrodkowego układu nerwowego.

Objawy te stwierdzono jedynie po narażeniu na nikotynę w dawkach większych niż zalecane według schematu dawkowania pastylek do ssania NiQuitin. Nie określono wpływu nikotyny na płodność.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Mannitol (E421)
Alginian sodu
Guma ksantanowa
Wodorowęglan potasu
Kopolimer poliakrylu wapnia z glikolem diwinylowym
Węglan sodu bezwodny
Aspartam (E951)
Stearynian magnezu

Aromat miętowy 57581(zawiera laktozę i białko sojowe)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie stwierdzono.

6.3 Okres ważności

NiQuitin 2 mg, pastylki do ssania: 20 miesięcy (blister), 24 miesiące (tuba)

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

Przechowywać w oryginalnym opakowaniu.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Przezroczyste lub nieprzezroczyste blistry z PVC/PE/PVDC w pudełkach tekturowych zawierających 12, 36 lub 72 pastylki lub tuba z polipropylenu z zamknięciem, zawierająca 24 pastylki.

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania leku do stosowania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

GlaxoSmithKline Consumer Healthcare Sp. z o.o., ul. Rzymowskiego 53, 02-697 Warszawa
Tel. 0-22 576 9600, fax 0-22 576 9601

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

9490

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

20.09.2002/ 18.07.2007 / 26.03.2008

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO