CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

NiQuitin, 4 mg, pastylki do ssania

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Nicotinum
1 pastylka do ssania zawiera 4 mg nikotyny (w postaci nikotyny z kationitem).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu (w jednej pastylce)
Aspartam (E951) 6,1 mg
Mannitol (E421) 1015 mg
Sód 15 mg

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Pastylka do ssania
Białe lub białawe, obustronnie wypukłe, okrągłe pastylki z wytłoczeniem NL4 na jednej ze stron.

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

Dawkowanie:
Osoby stosujące NiQuitin powinny dołożyć wszelkich starań, aby całkowicie zaprzestać palenia podczas leczenia tym produktem.
Wybór mocy pastylek do ssania jest uzależniony od nawyków palacza.

NiQuitin 2 mg jest odpowiedni dla palaczy wypalających 20 lub mniej papierosów dziennie.
NiQuitin 4 mg jest odpowiedni dla palaczy wypalających więcej niż 20 papierosów dziennie.

Poradnictwo i wsparcie o charakterze terapii behawioralnej zwykle poprawiają wskaźnik skuteczności leczenia.

Osoby dorosłe (w wieku co najmniej 18 lat)

Monoterapia:

Natychmiastowe rzucanie palenia:

Należy przestrzegać poniższego schematu leczenia:

<table>
<tr><td>Stopień 1</td><td></td><td></td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="2">Tydzień 1. do 6.</td><td>Stopień 2</td><td></td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="2">Tydzień 7. do 9.</td><td>Stopień 3</td><td></td></tr>
<tr><td>Tydzień 10. do 12.</td><td rowspan="3">Aby móc powstrzymać się od palenia przez kolejne 12 tygodni: należy stosować 1 lub 2 pastylki na dobę tylko w przypadkach silnej ochoty na zapalenie papierosa</td></tr>
<tr><td>początkowy okres kuracji</td><td>okres kuracji ze zmniejszeniem dawki</td><td>okres kuracji ze zmniejszeniem dawki</td></tr>
<tr><td>1 pastylka do ssania co 1-2 godziny</td><td>1 pastylka do ssania co 2-4 godziny</td><td>1 pastylka do ssania co 4-8 godzin</td></tr>
</table>

Od 1. do 6. tygodnia zalecane jest stosowanie co najmniej 9 pastylek na dobę.
Nie należy stosować więcej niż 15 pastylek na dobę.

Leczenie pastylkami z nikotyną może trwać dłużej niż 24 tygodnie, jeśli to konieczne, aby nie palić papierosów.

Pacjenci stosujący pastylki do ssania dłużej niż 12 miesięcy powinni skonsultować się z fachowym personelem medycznym.

Stopniowe rzucanie palenia:

Dotyczy palaczy, którzy nie chcą lub nie są w stanie nagle rzucić palenia.

Należy przyjąć pastylkę do ssania zawsze gdy pojawia się silna potrzeba zapalenia papierosa, w celu jak największego ograniczenia liczby wypalanych papierosów oraz w celu jak najdłuższego powstrzymania się od zapalenia kolejnego papierosa.

Liczba pastylek do ssania przyjmowanych w ciągu doby jest zmienna i zależna od potrzeb pacjenta, niemniej jednak nie należy stosować więcej niż 15 pastylek do ssania na dobę.

Jeśli po 6 tygodniach leczenia nie uda się zmniejszyć liczby papierosów wypalanych dziennie, pacjent powinien skonsultować się z fachowym personelem medycznym.

Zmniejszenie używania tytoniu powinno prowadzić do całkowitego zaprzestania palenia.

Należy starać się osiągnąć to jak najszybciej. Gdy liczba papierosów zostanie zmniejszona do poziomu, przy którym pacjent poczuje się gotowy do całkowitego zaprzestania palenia, należy rozpocząć schemat dawkowania przewidziany dla „natychmiastowego rzucenia palenia” przedstawiony powyżej.

Jeśli próba całkowitego zaprzestania palenia nie zostanie podjęta w ciągu 6 miesięcy od rozpoczęcia leczenia, zaleca się konsultację z fachowym personelem medycznym.

Tymczasowa abstynencja (gdy palenie jest zabronione lub w sytuacji, gdy dana osoba chce uniknąć palenia papierosa)

Należy przyjmować pastylki do ssania co 1-2 godziny, aby kontrolować uciążliwe objawy odstawienia, w tym głód nikotynowy.

Nie należy przyjmować więcej niż 30 pastylek na dobę.

Zaleca się, aby całkowicie zaprzestać palenia najszybciej jak to możliwe.

Jeśli po 6 miesiącach od rozpoczęcia leczenia osoby stosujące pastylki do ssania nadal odczuwają potrzebę regularnego stosowania pastylek i nadal nie są w stanie podjąć próby trwałego rzucenia palenia, zaleca się konsultację z fachowym personelem medycznym.

Terapia łączona: Leczenie pastylkami do ssania NiQuitin 4 mg w skojarzeniu z plastrami NiQuitin

W niektórych przypadkach korzystne może być stosowanie więcej niż jednej formy Nikotynowej Terapii Zastępczej (NTZ). Na przykład terapia łączona może być stosowana przez palaczy, którzy w przeszłości powrócili do palenia tytoniu po stosowaniu monoterapii NTZ lub u których monoterapia za pomocą jednego produktu NTZ nie jest wystarczająca do opanowania głodu nikotynowego lub u osób mających trudności w opanowaniu chęci zapalenia papierosa.

Pacjenci mogą łączyć system transdermalny (plastry) NiQuitin z doustnymi postaciami leków NiQuitin (w postaci gumy do żucia, tabletek do ssania, itp.). Połączenie systemu transdermalnego (plastrów) z formami doustnymi NTZ jest skuteczniejsze niż stosowanie samych plastrów .

Na początku leczenia należy określić dawkę plastra, która jest uzależniona od wcześniejszych nawyków palacza i ilości wypalanych przez niego papierosów, w połączeniu z pastylkami do ssania NiQuitin 4 mg. W trakcie jednoczesnego stosowania pastylek do ssania NiQuitin 4 mg z plastrami NiQuitin zaleca się przyjmowanie od 5 do 6 sztuk pastylek do ssania na dobę. Maksymalna dawka dobowa pastylek do ssania 4 mg wynosi 10 sztuk. W skojarzeniu z plastrem NiQuitin należy stosować tylko jeden rodzaj doustnego produktu NiQuitin (tabletki do ssania lub gumę do żucia).

Zalecany schemat dawkowania dla terapii łączonej:

<table>
<tr><td colspan="3">Osoby wypalające powyżej 10 papierosów dziennie</td></tr>
<tr><td>Etap</td><td>System transdermalny (plastry)</td><td>NiQuitin 4 mg, pastylki do ssania.</td></tr>
<tr><td>Przez pierwszych 6 tygodni</td><td>Etap 1, NiQuitin przezroczysty 21 mg / 24 godziny</td><td>5 do 6 pastylek do ssania na dobę*</td></tr>
<tr><td>Tydzień 7 i 8</td><td>Etap 2, NiQuitin przezroczysty 14 mg / 24 godziny</td><td rowspan="2">W razie konieczności należy nadal stosować pastylki do ssania*</td></tr>
<tr><td>Tydzień 9 i 10</td><td>Etap 3, NiQuitin przezroczysty 7 mg / 24 godziny</td></tr>
<tr><td>Po 10 tygodniach</td><td>Odstawić plastry NiQuitin przezroczysty</td><td>Stopniowo zmniejszać liczbę pastylek do ssania.
Leczenie należy przerwać, kiedy pacjent przyjmuje 1 do 2 pastylek.</td></tr>
<tr><td colspan="3">Osoby wypalające mniej niż 10 papierosów dziennie</td></tr>
<tr><td>Okres</td><td>System transdermalny (plastry)</td><td>NiQuitin 4 mg, pastylki do ssania.</td></tr>
<tr><td>Przez pierwszych 6</td><td>Etap 2, NiQuitin przezroczysty</td><td>5 do 6 pastylek do ssania na</td></tr>
</table>

tygodni	14 mg / 24 godziny	dobę*
Tydzień 7 i 8	Etap 3, NiQuitin przezroczysty 7 mg / 24 godziny	W razie konieczności należy nadal stosować pastylki do ssania*
Po 8 tygodniach	Odstawić plastry NiQuitin przezroczysty	Stopniowo zmniejszać liczbę pastylek. Leczenie należy przerwać, kiedy pacjent przyjmuje 1 do 2 pastylek.

*Maksymalna dobowa dawka dla postaci doustnych 4 mg wynosi 10 pastylek.

Czas trwania leczenia zależy indywidualnie od pacjenta rzucającego palenie. Na ogół stosowanie doustnych postaci NiQuitin powinno trwać 2-3 miesiące, a następnie ilość przyjmowanego leku powinna być stopniowo zmniejszana. Leczenie należy przerwać, kiedy pacjent przyjmuje 1 do 2 pastylek do ssania na dobę.

Sposób podawania
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

Nadwrażliwość na nikotynę lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

Produkt leczniczy NiQuitin pastylki do ssania jest przeciwwskazany:
- u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat oraz u osób niepalących;
- u osób z nadwrażliwością na orzeszki ziemne lub soję;

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Produkt należy ostrożnie stosować w przypadkach:
- niekontrolowanego nadciśnienia tętniczego;
- umiarkowanych do ciężkich zaburzeń czynności wątroby i (lub) umiarkowanych do ciężkich zaburzeń czynności nerek (klirens nikotyny lub jej metabolitów może być zmniejszony co potencjalnie może wpływać na wystąpienie działań niepożądanych);
- guza chromochłonnego nadnerczy, nadczynności tarczycy;
- schorzeń układu sercowo-naczyniowego (np. stabilna dławica piersiowa, niewydolność serca, zaburzenia krążenia mózgowego, schorzenia przebiegające ze skurczem naczyń, ciężkie schorzenia naczyń obwodowych).

Cukrzyca: stężenie glukozy we krwi może być bardziej zmienny podczas rzucania palenia, z lub bez użycia nikotynowej terapii zastępczej NTZ. Pacjentom chorym na cukrzycę należy zalecać częstsze niż zazwyczaj kontrole stężenia glukozy we krwi podczas stosowania leku NiQuitin.

Pacjentom hospitalizowanym z powodu zawału mięśnia sercowego, ciężkich zaburzeń rytmu serca lub udaru mózgu, którzy są hemodynamicznie niestabilni, zaleca się zaprzestanie palenia bez stosowania środków farmakologicznych.

Jeżeli jednak pacjenci nie rzucą palenia, można rozważyć zastosowanie pastylek NiQuitin. Jednakże ze względu na ograniczone informacje o bezpieczeństwie stosowania przez tę grupę pacjentów, rozpoczęcie leczenia może nastąpić jedynie pod ścisłą kontrolą lekarską. Po opuszczeniu szpitala pacjenci mogą kontynuować stosowanie NTZ. Jeżeli pojawi się klinicznie znaczący wzrost ciśnienia krwi lub pojawią się inne skutki zależnie od nikotyny, należy zmniejszyć ilość lub zaprzestać stosowania leku NiQuitin.

Drgawki: należy dokładnie ocenić stosunek korzyści do ryzyka podczas stosowania nikotynowej terapii zastępczej u pacjentów jednocześnie przyjmujących leki przeciwdrgawkowe, u pacjentów chorych na padaczkę lub u pacjentów z padaczką w wywiadzie, którzy obecnie nie maja napadów. Odnotowano przypadki wystąpienia drgawek mających związek z nikotyną.

Połknięcie 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.

Przeniesienie uzależnienia: może wystąpić przeniesiona zależność od nikotyny.

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

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.
Jedna pastylka zawiera 17 mg sodu.

Lek NiQuitin należy przechowywać w miejscu niewidocznym i niedostępnym dla dzieci.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Zaprzestanie palenia i jednoczesne przyjmowanie lub nieprzyjmowanie produktu z nikotyną, może zmienić reakcję organizmu na inne jednocześnie przyjmowane leki u byłych palaczy. Zaprzestanie palenia tytoniu może czasem wymagać dostosowania terapii farmakologicznej.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

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 produktu NiQuitin.
Jeżeli rzucenie palenia się nie powiedzie, lek NiQuitin może być stosowany jedynie po zaleceniu przez lekarza.

Karmienie piersią

Kobiety w okresie karmienia piersią mogą stosować pastylki do ssania NiQuitin, ponieważ ilość nikotyny przechodzącej do mleka matki jest mała i mniej szkodliwa niż ta pochodząca z palenia tytoniu.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwania maszyn

NiQuitin nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwania maszyn.

4.8 Działania niepożądane

Pastylki do ssania NiQuitin mogą wywołać objawy niepożądane podobne do tych związanych z przyjęciem nikotyny drogą tytoniem. mogą wiele z obserwowanych objawów może być związanych z farmakologicznym oddziaływaniem nikotyny, które jest zależne od dawki.

Działania niepożądane przedstawione w tabeli 1 i 2 mają związek z właściwościami nikotyny i odnoszą się do doustnych postaci nikotynowej terapii zastępczej.
W tabeli nr 1 przedstawiono działania niepożądane pochodzące z randomizowanego badania klinicznego z podwójnie ślepą próbą, kontrolowanego z użyciem placebo, obejmującego 1818 pacjentów. Uznano te działania niepożądane zgłoszone w tym badaniu, których częstość występowania w grupie pacjentów stosujących produkty zawierające 2 mg lub 4 mg nikotyny była większa niż w grupie pacjentów stosujących placebo. Częstość występowania działań niepożądanych została oszacowana na podstawie danych pochodzących z badania.

Tabela 1

Zaburzenia żołądka i jelit	
Bardzo często ≥1/10	nudności
Często ≥1/100 ;<1/10	wymioty, niestrawność♦, ból w nadbrzuszu, biegunka, suchość w jamie ustnej, zaparcia, czkawka, zapalenie jamy ustnej, wzdęcia z oddawaniem wiatrów, dyskomfort w jamie ustnej, zgaga, podrażnienia lub owrzodzenia jamy ustnej,
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	wrzód trawienny, refluks żołądkowo-przełykowy, przepuklina rozworu przełykowego, zapalenie przełyku, suchość w gardle, ból zębów
Zaburzenia układu nerwowego	
Często ≥1/100; <1/10	ból głowy*, zawroty głowy*
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	miejscowe odrętwienie, zaburzenia smaku
Zaburzenia psychiczne	
Często ≥1/100; <1/10	bezsenność*, niepokój,
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	zły nastrój, wzmożony niepokój, koszmary senne, zmiany nastroju
Częstość nieznana	nietypowe sny
Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia	
Często ≥1/100 ; <1/10	zapalenie gardła, kaszel*, ból gardła i krtani
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	kurcz krtani, astma, infekcje dolnych dróg oddechowych, podrażnienie nosa lub gardła, zatkanie nosa
Zaburzenia krwi i układu chłonnego	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	zaburzenia krzepliwości i związane z nimi krwawienie (krwawienie z dziąseł i nosa)
Zaburzenia naczyniowe	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	zaczerwienienie skóry
Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	rumień, świąd, wysypka, miejscowe reakcje

	skórne, wzmożone pocenie
Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	ból szczęki
Zaburzenia nerek i dróg moczowych	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	moczenie nocne
Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania	
Niezbyt często ≥1/1000 do <1/100	efekt przedawkowania, ból nogi, obrzęk nóg, uczucie głodu,
Zaburzenia metabolizmu i odżywiania	
Często ≥1/100; <1/10	wzmożony apetyt

*Mogą być związane z objawami odstawiennymi po zaprzestaniu palenia
♦ Osoby ze skłonnościami do niestrawności mogą mieć niestrawność lub zgagę niewielkiego stopnia w przypadku użycia leku w dawce 4 mg - stosowanie dawki 2 mg (w razie konieczności częściej) zwykle rozwiązuje problem

Dane po wprowadzeniu leku do obrotu

Tabela 2 przedstawia działania niepożądane pochodzące z danych po wprowadzeniu doustnej nikotynowej terapii zastępczej do obrotu. Częstość występowania tych działań niepożądanych nie może być określona na podstawie dostępnych danych.

Tabela 2

Zaburzenia serca
kołatanie serca, tachykardia
Zaburzenia żołądka i jelit
utrudnienie połykania, odbijanie, regurgitacje, nadmierne wydzielanie śliny, wrzodziejące zapalenie błony śluzowej jamy ustnej
Dolegliwości ogólne i stany w miejscu podania
osłabienie*, zmęczenie*, złe samopoczucie*, objawy grypopodobne*
Zaburzenia układu immunologicznego
nadwrażliwość, obrzęk naczynioruchowy, pokrzywka i, bardzo rzadko, reakcje anafilaktyczne
Zaburzenia układu nerwowego
drżenie
Drgawki**
Zaburzenia psychiczne
nerwowość*
Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia
duszność

*Mogą być związane z objawami odstawiennymi po zaprzestaniu palenia
**U osób przyjmujących leczenie przeciwdrgawkowe lub z padaczką w wywiadzie

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych
Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania

Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: 22 49-21-301, fax: 22 49-21-309
strona internetowa: https://smz.ezdrowie.gov.pl
Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Objawy
Dzieci i młodzież
Nawet niewielkie ilości nikotyny mogą być niebezpieczne dla dzieci i mogą okazać się śmiertelne. Podejrzenie zatrucia nikotyną u dziecka należy uznać za naglący stan medyczny i natychmiast leczyć. Objawy przedmiotowe i podmiotowe po przedawkowaniu pastylek zawierających nikotynę byłyby takie same jak objawy ostrego zatrucia nikotyną
i obejmowałyby: bladość, zimne poty, ślinotok, wymioty, bóle w jamie brzusznej, biegunkę, ból głowy, zawroty głowy, zaburzenia słuchu i widzenia, drżenie, stany splątania i osłabienie.
Po znacznym przedawkowaniu mogą wystąpić stan wyczerpania, niskie ciśnienie krwi, niewydolność oddechowa i drgawki.

Postępowanie po zatruciu nikotyną
W przypadku przedawkowania (np. połknięcia zbyt wielu pastylek) pacjent powinien niezwłocznie zgłosić się do lekarza. Należy natychmiast przerwać podawanie nikotyny i rozpocząć leczenie objawowe. W razie konieczności zastosować sztuczne oddychanie z jednoczesnym podawaniem tlenu i prowadzić je przez niezbędny okres wynikający ze stanu przedawkowania.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki stosowane w uzależnieniu od nikotyny
Kod ATC: N07B A01

Mechanizm działania

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 odstawienne 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. Pastylki do ssania zastępują część nikotyny dostarczanej przez tytoń i pomagają zmniejszyć natężenie objawów odstawiennych 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

Wchłanianie

Pastylki 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.

Dystrybucja

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.

Metabolizm

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.

Eliminacja

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 zalecanym dawkowaniu. 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 (E401)
Guma ksantanowa (E415)
Wodorowęglan potasu (E501)
Węglan sodu bezwodny
Aspartam (E951)
Magnezu stearynian (E407b)
Aromat mięty pieprzowej (zawiera maltodekstrynę i skrobię modyfikowaną)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie stwierdzono.

6.3 Okres ważności

24 miesiące

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25˚C.
Przechowywać w oryginalnym opakowaniu.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Przezroczyste blistry z PCTEF/PVC/AL lub PVC/PVdC/PVC/AL w pudełkach tekturowych zawierających 12, 24, 36 lub 72 pastylki.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania leku do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Perrigo Poland Sp. z o.o.
ul. Domaniewska 48
02-672 Warszawa
tel. +48 (22) 852 55 51

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

9491

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

Pierwsze pozwolenie na dopuszczenie do obrotu 20.09.2002

Data przedłużenia pozwolenia 28.05.2013

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

22.08.2024