



ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ СЕКИРА® 600

Торговое название препарата: Секира® 600

Действующее вещество (МНН): ацетилцистеин

Лекарственная форма: порошок для орального раствора

Состав:

1 саше содержит:

активное вещество: ацетилцистеина 600 мг;

вспомогательные вещества: сорбит (Е 420), аспартам (Е 951), рибофлавин (Е 101), ароматизатор с запахом апельсина.

Описание: порошок светло-желтого цвета с кремовым оттенком, без посторонних механических включений с характерным апельсиновым, слегка серным запахом.

Фармакотерапевтическая группа. муколитические средства.

Код АТХ R05CB01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

N-ацетил-L-цистеин (АЦ) оказывает выраженное муколитическое действие на слизистый и слизисто-гнойный секреты за счет деполимеризации мукопротеиновых комплексов и нуклеиновых кислот, которые придают вязкость гиалиновому и гнойному компонентам мокроты и другим секретам. Дополнительные свойства: снижение индуцированной гиперплазии мукоцитов, повышение выработки сурфактанта за счет стимуляции пневмоцитов типа II, стимуляция активности мукоцилиарного аппарата, что способствует улучшению мукоцилиарного клиренса.

N-ацетил-L-цистеин также оказывает прямое антиоксидантное действие за счет наличия нуклеофильной свободной тиольной группы (SH), которая способна непосредственно взаимодействовать с электрофильными группами окислительных радикалов. АЦ предотвращает инактивацию α -1-антитрипсина – фермента, который ингибирует эластазу, хлорноватистой кислотой (HOCl) – сильным окислителем, который вырабатывается миелопероксидазой активных фагоцитов.

Кроме того, молекулярная структура АЦ дает ему возможность легко проникать через клеточные мембраны. Внутри клетки АЦ деацетируется с образованием L-цистеина, незаменимой аминокислоты для синтеза глутатиона. В дополнение к этому АЦ, который является прекурсором глутатиона, оказывает не прямой антиоксидантный эффект. Глутатион является высокоактивным трипептидом, распространенным в различных тканях животных и незаменимым для сохранения функциональной способности клетки и ее морфологической целостности. Фактически он является частью наиболее важного внутриклеточного механизма защиты от окислительных радикалов, как экзо-, так и эндогенных, и некоторых цитотоксических веществ, включая парацетамол.

Парацетамол оказывает цитотоксическое действие путем прогрессирующего снижения содержания глутатиона. АЦ играет первостепенную роль в сохранении адекватных уровней глутатиона, таким образом усиливая клеточную защиту. В результате этого АЦ представляет собой специфический антидот при отравлении парацетамолом.

У больных ХОЗЛ прием 1200 мг АЦ в сутки в течение 6 недель приводил к значительному повышению объема вдоха и форсированной жизненной емкости легких (ФЖЕЛ), возможно, вследствие уменьшения воздушного захвата.

У больных с идиопатическим фиброзом легких (ИФЛ) применение ацетилцистеина перорально по 600 мг 3 раза в сутки в течение одного года в сочетании со стандартной терапией ИФЛ (преднизолон и азатиоприн) способствовало сохранению жизненной емкости легких (ЖЕЛ) и диффузной способности легких, измеренной методом одиночного вдоха окиси углерода.

В форме ингаляционной терапии в течение одного года АЦ способствовал снижению интенсивности прогрессирования заболевания у больных с ИФЛ.

При применении в очень высоких дозах (до 3000 мг ежедневно в течение 4 недель) больным муковисцидозом АЦ не оказывал значительного токсического действия.

Антиоксидантная эффективность АЦ связана с выраженным снижением активности эластазы в мокроте, что является самым значительным показателем функции легких у больных муковисцидозом. Кроме этого, на фоне лечения отмечалось снижение количества нейтрофилов в дыхательных путях, а также количества нейтрофилов, активно выделяющих богатые эластазой гранулы.

Фармакокинетика

Абсорбция

У человека после перорального приема ацетилцистеин полностью абсорбируется. Из-за метаболизма в стенках кишечника и эффекта первого прохождения биодоступность ацетилцистеина при пероральном приеме очень низкая (около 10 %). Для различных лекарственных форм различий не выявлено. У больных с различными дыхательными и сердечными заболеваниями максимальная концентрация АЦ в плазме крови достигается через 1–3 часа после приема и остается высокой в течение 24 часов.

Распределение

Ацетилцистеин распределяется в организме как в неизмененном виде (20 %), так и в виде метаболитов (активных) (80 %), при этом он определяется в основном в печени, почках, легких и бронхиальном секрете. Объем распределения АЦ – от 0,33 до 0,47 л/кг. Связывание с белками плазмы крови составляет около 50 % через 4 часа после приема и уменьшается до 20 % через 12 часов.

Метаболизм и выведение

После перорального приема АЦ быстро и экстенсивно метаболизируется в стенках кишечника и печени. Образованный метаболит, цистеин, рассматривают как активный. Далее ацетилцистеин и цистеин метаболизируются одним и тем же путем. Около 30 % дозы выводится почками. $T_{1/2}$ АЦ составляет 6,25 часа.

Показания к применению

- Лечение острых и хронических заболеваний бронхолегочной системы, сопровождающихся повышенным образованием мокроты.
- Передозировка парацетамолом.

Способ применения и дозы

Взрослые и дети старше 12 лет

1 саше 600 мг растворить в 1/3 стакана воды и принимать 1 раз в сутки.

Продолжительность курса лечения определяет врач индивидуально в зависимости от характера заболевания (острое или хроническое).

Передозировка парацетамолом

В первые 10 часов после приема токсичного вещества как можно быстрее принимают препарат Секира® 600 из расчета 140 мг/кг, далее – из расчета 70 мг/кг каждые 4 часа в течение 1–3 дней.

Препарат Секира® 600 необходимо принять без промедления, сразу же после приготовления раствора.

Дети.

Применять детям старше 12 лет.

Побочные действия

Далее представлены нежелательные реакции после применения ацетилцистеина для приема внутрь.

Класс систем органов	Побочные реакции			
	Нечасто ($\geq 1/1000$ – $< 1/100$)	Редко ($\geq 1/10000$ – $< 1/1000$)	Очень редко ($< 1/10000$)	Неизвестно
Со стороны иммунной системы	Гиперчувствительность		Анафилактический шок, анафилактические/анафилактоидные реакции	
Со стороны крови и лимфатической системы				Анемия
Со стороны нервной системы	Головная боль			
Со стороны органов слуха и лабиринта	Звон в ушах			
Со стороны дыхательной системы				Ринорея
Со стороны сердца	Тахикардия			
Со стороны сосудов			Геморрагии	
Со стороны органов грудной клетки и средостения		Бронхоспазм, диспноэ		
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Рвота, диарея, стоматиты, абдоминальная боль, тошнота	Диспепсия		Неприятный запах изо рта
Со стороны кожи и подкожных тканей	Крапивница, высыпания, отек Квинке, зуд			Экзема
Общие расстройства и нарушения в месте введения	Гипертермия			Отек лица
Исследования	Снижение артериального давления			

В очень редких случаях в связи с приемом ацетилцистеина сообщалось о тяжелых кожных реакциях, таких как, например, синдром Стивенса–Джонсона и синдром Лайелла. В большинстве случаев, как минимум, еще одно лекарственное средство может с большей вероятностью быть причиной появления кожно-слизистого синдрома. Поэтому при появлении любых новых изменений на коже или слизистых оболочках нужно обратиться к врачу и немедленно отменить прием ацетилцистеина.

Отмечались случаи снижения агрегации тромбоцитов, но клиническое значение этого не определено.

Противопоказания

- Известная гиперчувствительность к ацетилцистеину или к любому из вспомогательных веществ препарата.
- Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, кровохарканье, легочное кровотечение.

Лекарственные взаимодействия

Исследования взаимодействия проводились только с участием взрослых.

Применение вместе с ацетилцистеином противокашлевых средств может усилить застой мокроты из-за подавления кашлевого рефлекса.

Активированный уголь снижает эффективность ацетилцистеина.

При одновременном применении с такими антибиотиками, как тетрациклины (за исключением доксициклина), ампициллин, амфотерицин В, цефалоспорины, аминогликозиды, возможно их взаимодействие с тиоловой группой ацетилцистеина, что приводит к снижению активности обоих препаратов. Поэтому интервал между приемом этих препаратов должен составлять не менее 2-х часов. Это не касается цефиксима и лоракарбефа.

При одновременном приеме нитроглицерина и ацетилцистеина выявлено значительную артериальную гипотензию и расширение височной артерии. При необходимости одновременного применения нитроглицерина и ацетилцистеина у пациентов следует контролировать артериальную гипотензию, которая может иметь тяжелый характер, и следует предупредить их о возможности возникновения головной боли.

Ацетилцистеин может быть донором цистеина и повышать уровень глутатиона, который способствует детоксикации свободных радикалов кислорода и определенных токсичных веществ в организме.

Влияние на лабораторные исследования

Ацетилцистеин может влиять на колориметрические исследования салицилатов и на определение кетоновых тел в моче.

Особые указания

Пациенты, больные бронхиальной астмой, во время лечения препаратом должны находиться под строгим контролем из-за возможного развития бронхоспазма. В случае возникновения бронхоспазма лечение ацетилцистеином следует немедленно прекратить.

Рекомендуется с осторожностью принимать препарат пациентам с язвой желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе, особенно в случае сопутствующего приема других лекарственных средств, раздражающих слизистую оболочку желудка.

Пациентам с заболеваниями печени или почек ацетилцистеин следует назначать с осторожностью во избежание накопления азотсодержащих веществ в организме. Ацетилцистеин влияет на метаболизм гистамина, поэтому не следует назначать длительную терапию пациентам с непереносимостью гистамина, поскольку это может привести к появлению симптомов непереносимости (головная боль, вазомоторный ринит, зуд).

Применение ацетилцистеина, главным образом в начале лечения, может вызвать

разжижение бронхиального секрета и увеличить его объем. Если пациент не способен эффективно откашливать мокроту, необходимы постуральный дренаж и бронхоаспирация. Легкий серный запах не является признаком изменения препарата, а является специфическим для действующего вещества.

Муколитические средства могут вызывать бронхиальную обструкцию у детей в возрасте младше 2 лет. Вследствие физиологических особенностей дыхательной системы у детей этой возрастной группы способность очистки секрета дыхательных путей ограничена.

Поэтому муколитики не следует применять детям младше 2 лет.

Секира® 600 содержит аспартам, источник фенилаланина. Это необходимо учитывать пациентам с фенилкетонурией.

Лекарственное средство содержит сорбитол, поэтому пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы этот препарат принимать не следует.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность

Клинические данные о применении ацетилцистеина беременным женщинам ограничены. Исследования на животных не выявили прямых или косвенных негативных воздействий на беременность, эмбриофетальное развитие, роды и постнатальное развитие.

Период кормления грудью

Информация о проникновении в грудное молоко отсутствует.

Принимать препарат во время беременности и кормления грудью следует только после тщательной оценки соотношения польза/риск.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Нет подтверждения, что ацетилцистеин влияет на способность управлять автомобилем и другими механизмами.

Передозировка

Нет данных о случаях передозировки лекарственных форм ацетилцистеина, предназначенных для приема внутрь.

Добровольцы принимали 11,6 г ацетилцистеина в сутки в течение трех месяцев без возникновения каких-либо серьезных побочных эффектов.

Ацетилцистеин при приеме в дозах 500 мг/кг/сутки не вызывает передозировки.

Симптомы.

Передозировка может проявляться желудочно-кишечными симптомами, такими как тошнота, рвота и диарея.

Лечение.

Специфического антидота при отравлении ацетилцистеином нет, терапия симптоматическая.

Форма выпуска

Порошок для орального раствора по 600 мг/3 г в саше. По 6 или 10 саше вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке из картона.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость

При растворении ацетилцистеина необходимо пользоваться стеклянной посудой, избегать контакта с металлическими и резиновыми поверхностями.

Не рекомендуется растворение в одном стакане ацетилцистеина с другими препаратами.

Срок годности

2 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта

Производитель

АО «Фармак». Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 63

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 74.

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан:

Представительство АО "Фармак" в Узбекистане.

100170 Республика Узбекистан, г. Ташкент, Мирзо-Улугбекский район, ул. Зиелилар 12а, 1/2

e-mail: info@farmak.ua

Тел.: +998 (71) 235-77-13