

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
АЦИСТЕЇН
(ACISTEIN)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: ацетилцистеїн; N-ацетил-L-цистеїн;

основні фізико-хімічні властивості: гранульований порошок кремово-білого кольору з характерним апельсиновим та слабким сірчаным запахом з оранжевими включеннями;
приготований сироп: опалесцентний розчин оранжево-жовтого кольору з характерним апельсиновим та слабким сірчаным запахом;

склад: 5 мл приготованого сиропу містять ацетилцистеїну 200 мг;

допоміжні речовини: натрію цитрат, натрію метилпарагідроксибензоат, натрію пропілпарагідроксибензоат, динатрій едетат, бетакаротен, сорбіт, апельсиновий ароматизатор.

Форма випуску. Гранули для приготування сиропу для перорального застосування.

Фармакотерапевтична група. Муколітичні засоби.

Код АТС R05C B01.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Ацетилцистеїн є муколітичним засобом, N-ацетильованим похідним природної амінокислоти L-цистеїну.

За рахунок сульфгідрильної групи ацетилцистеїн розриває дисульфідні зв'язки глікопротеїнів мокротиння, що призводить до муколітичної дії на слизоподібний та слизисто-гнійний секрет. Ця дія є вираженою при рН 6-8. Ацетилцистеїн досягає високих концентрацій у тканинах організму, особливо в легеневій. Він швидко зменшує щільність і в'язкість мокротиння, що накопичується у дихальних шляхах, і сприяє відхаркуванню та відходженню бронхіального секрету.

Ацетилцистеїн не деполімеризує білки та не впливає на фібринову або живу тканину, а також на активність ДНК.

Ацетилцистеїн є антиоксидантом. Він бере участь у синтезі глутатіону у клітинах легенів та печінки як донор цистеїну. Ацетилцистеїн та глутатіон вступають у реакцію з вільними радикалами кисню, що продукуються нейтрофілами під час легневих інфекцій, вдихання тютюнового диму та токсичних речовин. Таким чином, ацетилцистеїн захищає клітини від ушкодження та проявляє цитопротекторну дію.

Ацетилцистеїн зменшує можливість гепатотоксичної дії препаратів, до складу яких входить парацетамол. Зазвичай невеликі кількості парацетамолу метаболізуються за участю мікросомальних ферментів системи цитохрому P₄₅₀ до реактивного проміжного метаболіту, який далі метаболізується шляхом кон'югації з глутатіоном та остаточно виводиться з сечею. Високі дози парацетамолу знижують концентрацію глутатіону, що призводить до зменшення інактивації його токсичного метаболіту. Ацетилцистеїн захищає печінку від токсичного впливу, підтримуючи або відновлюючи рівень глутатіону або його кон'югацію з проміжним метаболітом.

Фармакокінетика. Ацетилцистеїн добре абсорбується із ШКТ після прийому внутрішньо. Біодоступність ацетилцистеїну є низькою через те, що він піддається метаболізму „першого проходження”. 50% речовини зв'язується з білками плазми та добре проникає у легеневу тканину. Після прийому внутрішньо у легеневу тканину проникає 48% застосованої дози ацетилцистеїну. Період напіввиведення ацетилцистеїну становить 6,25 год, речовина виводиться через нирки у вигляді ацетилцистеїну та метаболітів.

Показання для застосування.

Препарат показаний при станах, що потребують зменшення в'язкості мокротиння, покращання його

відходження та відхаркування:

- гострі та хронічні бронхолегеневі захворювання, такі як пневмонія, гострий бронхіт, емфізема легенів, хронічний обструктивний бронхіт, туберкульоз легенів, бронхоектатична хвороба, первинний амілоїдоз легенів;
- ателектаз внаслідок обструкції дихальних шляхів, спричиненої слизом;
- легеневі ускладнення торакальних та серцево-судинних хірургічних втручань;
- профілактика ушкодження легеневої тканини внаслідок інфекційних захворювань, вдихання тютюнового диму або впливу токсичних речовин.

Спосіб застосування та дози.

Застосування у якості муколітичного засобу

Дорослі та діти старше 7 років: 600 мг/день (15 мл/день) приймають один раз на день або добову дозу ділять на три рівні дози та приймають тричі на день після вживання їжі.

Діти віком від 2 до 7 років: 400 мг/день (10 мл/день) ділять на дві рівні дози та приймають двічі на день після вживання їжі.

Діти молодше 2 років: 200 мг/день (5 мл/день) ділять на дві рівні дози та приймають двічі на день після вживання їжі.

Приготування сиропу для перорального застосування

Сироп слід готувати щонайменше за півгодини до застосування.

Додати свіжозакип'яченої та охолодженої води до позначки на флаконі та енергійно струшувати протягом 1-2 хвилин. Дати відстоятися. Через півгодини додати води до позначеного рівня та знову кілька разів енергійно струснути до повного розчинення гранул.

Побічна дія.

Можливі порушення з боку ШКТ, включаючи нудоту та блювання, стоматит, ринорею (виділення з носа), кропив'янку, головний біль, шум у вухах. Рідко виникають алергічні реакції з проявами на шкірі.

Протипоказання.

Ацестейн протипоказаний пацієнтам з гіперчутливістю до ацетилцестейну в анамнезі.

Передозування.

Спеціального антидоту до ацетилцестейну не існує. У випадках передозування рекомендується симптоматичне та підтримуюче лікування.

Особливості застосування.

Ацетилцестейн слід з обережністю застосовувати у пацієнтів, які страждають на виразку шлунка та дванадцятипалої кишки.

Після застосування ацетилцестейну може суттєво посилитися бронхіальна секреція. Тому у випадках, коли кашель або кашльовий рефлекс недостатні, слід стежити, щоб дихальні шляхи залишалися відкритими.

Під час лікування ацетилцестейном рекомендується вживати достатню кількість рідини.

Вагітність і лактація

Оскільки остаточно невідомо, чи потрапляє ацетилцестейн до материнського молока або плода, застосовувати препарат під час вагітності та лактації слід лише за суворими показаннями.

Вплив на здатність керувати автомобілем і механізмами

Не представлено.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Взаємодія ацетилцистеїну з іншими лікарськими засобами трапляється рідко.

Лікарські засоби, що посилюють утворення мокротиння, не слід застосовувати разом з протикашльовими та протисекреторними препаратами.

Глютатіон

Глютатіон є трипептидом, який утворюють глютамат, гліцин та цистеїн. Відновлений глютатіон сприяє детоксифікації радикалів кисню та певних токсичних речовин в організмі. Ацетилцистеїн може виступати в ролі донора цистеїну та підвищувати рівень глютатіону.

Парацетамол

Ацетилцистеїн приєднується до структури глютатіону, що кон'югується з реактивним метаболітом парацетамолу, і таким чином зменшує можливість гепатотоксичної дії препаратів, до складу яких входить парацетамол. Пряма взаємодія між парацетамолом та ацетилцистеїном відсутня.

Нітрогліцерин

При одночасному прийомі з нітрогліцерином може потенціювати його вазодилатуючий ефект.

Умови та термін зберігання.

Гранули для приготування сиропу для перорального застосування зберігати в оригінальній упаковці при температурі нижче 30°C.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Термін зберігання – 2 роки.

Приготований сироп для перорального застосування зберігати при кімнатній температурі протягом 12 днів.

Умови відпуску. Без рецепта.

Упаковка. По 60 г гранул для приготування 150 мл сиропу для перорального застосування у скляному флаконі з 1 мірною скляночкою у картонній коробці.

Виробник/Заявник.

Заявник. Дельта Медікел Промоушнз АГ/Delta Medical Promotions AG

Виробник. Білім Фармасьютікалз А.С./Bilim Pharmaceuticals A.S.

Адреса.

Заявник. 26 Отенбахгассе, Цюрих 8001, Швейцарія/
26 Oetenbachgasse, Zurich 8001, Switzerland.