

Состав

действующее вещество: nimesulide;

1 таблетка содержит нимесулида 100 мг;

вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, натрия крахмала (тип А), кремния диоксид коллоидный, тальк, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: круглые гладкие двояковыпуклые таблетки от белого до желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные препараты.

Код АТХ М01А Х17.

Фармакодинамика

Нимесулид - НПВП (НПВС) группы метансульфонанилидов, который проявляет противовоспалительное, обезболивающее и жаропонижающее действие.

Лечебное действие нимесулида обусловлена тем, что он взаимодействует с каскадом арахидоновой кислоты. Нимесулид селективно ингибирует ЦОГ II (циклооксигеназу II) и угнетает синтез простагландинов в очаге воспаления.

Нимесулид ингибирует освобождение фермента миелопероксидазы, а также угнетает образование свободных радикалов кислорода, не влияя на процессы фагоцитоза и хемотаксиса, угнетает образование фактора некроза опухолей и других медиаторов воспаления.

Фармакокинетика

После приема внутрь нимесулид быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 2-3 часа. До 97,5% нимесулида связывается с белками плазмы крови.

Препарат активно метаболизируется в печени с участием CYP2C9, фермента цитохрома P450. Основным продуктом метаболизма является гидроксинимесулид - фармакологически активное вещество. Период полувыведения - от 3,2 до 6 часов. Нимесулид выводится из организма с мочой - около 50% от принятой дозы. Около 29% от принятой дозы выводится с калом в метаболизированном виде. Только 1-3% выводится из организма в неизмененном виде. Фармакокинетический профиль у лиц пожилого возраста не меняется.

Показания

Лечение острой боли. Лечение первичной дисменореи.

Нимесулид следует применять только в качестве препарата второй линии.

Решение о назначении нимесулида следует принимать на основе оценки всех рисков для конкретного пациента.

Противопоказания

1. Повышенная чувствительность к нимесулида, в любой другой НПВП или к любому компоненту препарата. Гиперергические реакции, которые имели место в прошлом (бронхоспазм, ринит, крапивница) в связи с применением ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов.
2. Гепатотоксичные реакции на нимесулид, которые имели место в прошлом.
3. Одновременное применение других веществ с потенциальной гепатотоксичностью.
4. Алкоголизм и наркотическая зависимость.
5. Подозрение на острую хирургическую патологию.
6. Желудочно-кишечные кровотечения или перфорации в анамнезе, связанные с предыдущим применением нестероидных противовоспалительных средств.
7. Язва желудка или двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, наличие в анамнезе язвы, перфорации или кровотечения в пищеварительном тракте.
8. Наличие в анамнезе цереброваскулярных кровотечений или других кровоизлияний, а также заболеваний, сопровождающихся кровоточивостью.
9. Тяжелые нарушения свертывания крови.
10. Тяжелая сердечная недостаточность.
11. Тяжелые нарушения функции почек.
12. Нарушение функции печени.
13. Повышенная температура тела и/или гриппоподобные симптомы.
14. Возраст пациента до 12 лет.
15. III триместре беременности и кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Фармакодинамические взаимодействия.

Кортикостероиды: повышается риск возникновения язвы пищеварительного тракта или кровотечения. Антитромбоцитарные средства и селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС): повышается риск возникновения язв или кровотечений в пищеварительном тракте.

Антикоагулянты: НПВС могут усиливать действие антикоагулянтов, таких как варфарин или ацетилсалициловая кислота, из-за чего такая комбинация противопоказана больным с тяжелыми расстройствами коагуляции. Если такой комбинированной терапии нельзя избежать, необходимо проводить тщательный контроль показателей свертывания крови.

Диуретики, ингибиторы АПФ (АПФ) и антагонисты ангиотензина II: НПВП могут ослаблять действие диуретиков и других антигипертензивных препаратов. У некоторых больных с нарушением функции почек (например, у больных с обезвоживанием или пациентов пожилого возраста) одновременное применение ингибиторов АПФ, антагонистов ангиотензина II или веществ, угнетающих систему циклооксигеназы, может вызвать дальнейшее ухудшение функции почек и возникновения острой почечной недостаточности, которая, как правило, бывает обратимой. Эти взаимодействия следует учитывать тогда, когда больной применяет нимесулид совместно с ингибиторами АПФ или антагонистами ангиотензина II. Следует быть очень осторожным, применяя такую комбинацию, особенно у пациентов пожилого возраста. Больным следует получать достаточное количество жидкости, а функцию почек следует тщательно контролировать после начала применения такой комбинации. Нимесулид временно ослабляет действие фуросемида по выведению натрия и в меньшей степени - выведение калия, а также уменьшает диуретический эффект. Совместное применение фуросемида и нимесулида больным с нарушением почечной или сердечной функции требует осторожности.

У здоровых лиц нимесулид быстро снижает эффект фуросемида, направленный на выведение натрия и в меньшей степени на выведение калия, а также снижает мочегонное действие. Одновременное применение нимесулида и фуросемида приводит к уменьшению (примерно на 20%) площади под кривой «концентрация - время (AUC)» и снижение кумулятивной экскреции фуросемида без изменений почечного клиренса фуросемида.

Другие НПВП. Совместное применение лекарственных средств, содержащих нимесулид (см. Раздел «Клинические характеристики»), с другими НПВП, в том

числе с ацетилсалициловой кислотой в противовоспалительных дозах (≥ 1 г в виде однократного приема или ≥ 3 г в сутки), не рекомендуется.

Фармакокинетические взаимодействия с другими лекарственными средствами.

Были сообщения о том, что НПВП уменьшают клиренс, что приводит к увеличению уровня лития в плазме крови и токсичности лития. При назначении нимесулида больным, получающим терапию препаратами лития, следует часто контролировать уровень лития в плазме крови.

Есть клинически значимого взаимодействия с глибенкламидом, теофиллином, варфарином, дигоксином, циметидином и антацидными препаратами (комбинация алюминия и магния гидроксида). Нимесулид ингибирует активность фермента CYP2C9. При одновременном применении с нимесулидом лекарств, являющихся субстратами этого фермента, концентрация их в плазме крови может повышаться.

Нужна осторожность в случае, когда нимесулид необходимо применить менее чем через 24 часа до или менее чем за 24 часа после приема метотрексата, поскольку возможно повышение уровня последнего в сыворотке крови и увеличение его токсичности.

Через влияние на почечные простагландины, ингибиторы синтетазы, к которым относится нимесулид, возможно повышение нефротоксичности циклоспорина.

Эффекты других препаратов на нимесулид.

Толбутамид, салициловая кислота, вальпроевая кислота вытесняют нимесулид из участков связывания. Однако, несмотря на возможное влияние на уровень препарата в плазме крови, эти взаимодействия не считаются клинически значимыми.

Особенности применения

Нимесулид следует применять только как препарат второй линии. Решение о назначении нимесулида необходимо принимать на основе оценки всех рисков для отдельного пациента.

Для снижения риска развития побочных эффектов необходимо применять минимально эффективную дозу с наименьшей продолжительностью курса лечения. В случае отсутствия эффективности лечения (уменьшение симптоматики заболевания) терапию следует прекратить.

Были сообщения о случаях тяжелых реакций со стороны печени, в том числе с летальным исходом при применении нимесулида. В случае роста уровней печеночных ферментов или выявления признаков повреждения печени (например, анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, ощущение повышенной утомляемости, моча темного цвета) или при отклонении данных лабораторных анализов функции печени от нормы препарат нужно отменить. Повторное назначение нимесулида таким больным противопоказано.

Во время лечения нимесулидом рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических препаратов, анальгетиков, других НПВП, в том числе селективных ингибиторов циклооксигеназы-2, а также воздерживаться от употребления алкоголя.

У больных пожилого возраста повышенная частота нежелательных реакций на НПВП, особенно это касается возможных кровотечений и перфораций в пищеварительном тракте, которые могут быть летальными. Язва, кровотечение или перфорация ЖКТ могут угрожать жизни больного, особенно если в анамнезе имеются данные о том, что подобные явления возникали у больного при применении любых других НПВП (без срока давности). Риск подобных явлений увеличивается вместе с увеличением дозы НПВС у больных, имеющих в анамнезе язву в пищеварительном тракте, особенно осложненной кровотечением или перфорацией, а также у больных пожилого возраста. Таким больным лечение следует начинать с наименьшей возможной эффективной дозы. Для этих больных, а также для тех, кто принимает параллельно низкие дозы ацетилсалициловой кислоты или других препаратов, увеличивающих риск возникновения осложнений со стороны пищеварительного тракта, следует рассмотреть возможность применения комбинированной терапии с применением защитных веществ, например, мисопростол или ингибиторов протонного насоса.

Больным с токсическим поражением пищеварительного тракта, особенно у лиц пожилого возраста, следует сообщать о любых необычных симптомах, возникающих в области пищеварительного тракта, особенно о кровотечении. Это особенно важно на начальных стадиях лечения. Больных, принимающих сопутствующие препараты, которые могут повысить риск возникновения язвы или кровотечения, такие как кортикостероиды, антикоагулянты, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, антитромбоцитарные средства (ацетилсалициловая кислота), необходимо проинформировать о необходимости соблюдать осторожность при применении нимесулида.

В случае возникновения у больного, получающего нимесулид, кровотечения или язвы пищеварительного тракта лечения следует прекратить.

НПВС с осторожностью следует назначать больным с болезнью Крона или с неспецифическим язвенным колитом в анамнезе, поскольку нимесулид может привести к их обострению.

Одновременное применение нимесулида с другими лекарственными средствами, такими как оральные контрацептивы, антикоагулянты, антиагреганты, могут вызвать обострение болезни Крона и других заболеваний пищеварительного тракта.

Больные с артериальной гипертензией и/или сердечной недостаточностью в анамнезе, а также больные с задержкой жидкости в организме и отеками вследствие применения НПВП требуют соответствующего контроля состояния и консультации врача.

Клинические исследования и эпидемиологические данные позволяют сделать вывод о том, что некоторые НПВП, особенно в высоких дозах и при длительном применении, могут привести к незначительному риску возникновения артериальных тромботических эпизодов, например, инфаркта миокарда и инсульта. Для исключения риска возникновения таких явлений при применении нимесулида данных недостаточно. Больным с неконтролируемой артериальной гипертензией, острой сердечной недостаточностью, установленной ишемической болезнью сердца, заболеваниями периферических артерий и/или цереброваскулярными заболеваниями нимесулид нужно назначать после тщательной оценки состояния. Также следует тщательно оценить состояние больных с факторами риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, например, при артериальной гипертензии, гиперлипидемии, сахарном диабете, при курении, перед назначением препарата.

Больным с почечной или сердечной недостаточностью препарат следует назначать с осторожностью вследствие возможного ухудшения функции почек. В случае ухудшения состояния лечение следует прекратить. За лицами пожилого возраста необходимо проводить тщательный клинический контроль за возможности развития кровотечений и перфораций пищеварительного тракта, нарушение функции почек, печени или сердца. Поскольку нимесулид может влиять на функцию тромбоцитов, его следует с осторожностью назначать больным с геморрагическим диатезом. Однако нимесулид не заменяет ацетилсалициловую кислоту при профилактике сердечно-сосудистых заболеваний.

Применение нестероидных противовоспалительных средств может маскировать повышение температуры тела, связанное с фоновой бактериальной инфекцией. В случае повышения температуры тела или появления гриппоподобных симптомов у пациентов, принимающих нимесулид, прием препарата следует отменить.

Были сообщения о редких случаях тяжелых кожных реакций при применении НПВП, некоторые из них могут быть летальными, например эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса - Джонсона, токсический эпидермальный некролиз. У больных возникает очень высокий риск таких реакций, если при ранее назначенном курсе лечения реакция в большинстве случаев возникала в течение первого месяца лечения. Нимесулид необходимо отменить при появлении первых признаков кожной сыпи, поражения слизистых оболочек и других аллергических проявлений.

Применение нимесулида может нарушать женскую фертильность и не рекомендуется применять женщинам, планирующим беременность. Женщинам, которым сложно забеременеть или если они находятся на обследовании по поводу бесплодия, не рекомендуется назначать нимесулид.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Влияние нимесулида на способность управлять автомобилем и выполнять работы, требующие повышенного внимания, не изучали. Однако пациентам, которые после применения нимесулида испытывают головокружение, вертиго или сонливость, следует воздержаться от управления автотранспортом или работы с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Подавление синтеза простагландинов может неблагоприятно повлиять на беременность и/или развитие плода. Данные, полученные при эпидемиологических исследованиях, позволяют сделать вывод о том, что на ранних сроках беременности применение препаратов, подавляющих синтез простагландина, может увеличить риск самопроизвольного аборта, возникновение у плода пороков сердца и гастрошизис. Абсолютный риск развития аномалии сердечно-сосудистой системы повысился менее 1% примерно до 1,5%. Считается, что риск увеличивается с увеличением дозы и длительности применения.

Не следует принимать нимесулид в I и II триместре беременности без крайней необходимости. В случае необходимости применения препарата, которые пытаются забеременеть, или в I и II триместре беременности следует выбирать наименьшее возможное дозу и наименьшее возможное длительность лечения.

В III триместре беременности все ингибиторы синтеза простагландинов могут привести к развитию у плода:

- пневмокардиального токсического поражения (с преждевременным закрытием артериального протока и гипертензией в системе легочной артерии);
- дисфункцию почек, которая может прогрессировать до почечной недостаточности с развитием маловодие;

У матери и плода в конце беременности возможно:

- увеличение времени кровотечения, антиагрегационный эффект, который может возникнуть даже при применении очень низких доз препарата;
- подавление сократительной деятельности матки, что может привести к задержке или удлинению периода родов.

Поэтому нимесулид противопоказан в III триместре беременности.

Применение нимесулида может ухудшить фертильную функцию у женщин, поэтому не рекомендуется назначать женщинам, которые пытаются забеременеть. Для женщин, которые испытывают трудности с наступлением беременности или проходят исследования по поводу бесплодия, следует прекратить прием нимесулида. Если беременность установлена при применении нимесулида, то врач должен быть об этом проинформирован.

Как НПВС, что подавляет синтез простагландина, нимесулид может вызывать преждевременное закрытие Баталова протока, легочную гипертензию, олигурию, маловодие. Риск развития кровотечения, слабости родовой деятельности и периферического отека. Существуют отдельные сообщения о почечной недостаточности у новорожденных, матери которых применяли нимесулид в конце беременности. Исследования на животных показали атипичную репродуктивной токсичности препарата, но достоверных данных по применению нимесулида беременным не существует.

Поскольку неизвестно, проникает ли нимесулид в грудное молоко, его применение противопоказано в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Чтобы снизить нежелательные побочные эффекты, следует применять минимальную эффективную дозу в течение короткого времени.

Максимальная продолжительность курса лечения - 15 суток.

Взрослые. По 1 таблетке (100 мг) 2 раза в сутки - утром и вечером.

Лица пожилого возраста. Коррекция дозы не требуется.

Дети в возрасте от 12 лет. Коррекция дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек. Для пациентов с легкой или умеренной степенью нарушения функции почек (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) коррекция дозы не требуется, в то время как тяжелое нарушение функции почек (клиренс креатинина <30 мл/мин) является противопоказанием к применению.

Препарат принимают внутрь после еды, запивая достаточным количеством жидкости.

Побочные эффекты могут быть минимизированы путем короткого срока лечения, которое необходимо для контроля симптомов.

Дети

Лекарственный препарат противопоказан детям до 12 лет.

Передозировка

Симптомы острой передозировки НПВП (НПВС) обычно ограничиваются такими проявлениями: апатия, сонливость, тошнота, рвота, боль в эпигастральной области. Эти симптомы, как правило, обратимы при поддерживающей терапии. Возможно возникновение желудочно-кишечного кровотечения, артериальной гипертензии, острой почечной недостаточности, угнетение дыхания, коме, однако такие явления встречаются редко. Были сообщения про анафилактоидные реакции при применении терапевтических доз НПВС и при их передозировке. Специфического антидота нет. Лечение передозировки - симптоматическое и поддерживающее. Данных о выведении нимесулида с помощью гемодиализа нет, но если принять во внимание высокую степень связывания нимесулида с белками плазмы крови (до 97,5%), то маловероятно, что диализ окажется эффективным. При наличии симптомов передозировки или после применения большой дозы препарата в течение 4 часов после приема пациентам могут быть назначены: искусственное вызывание рвоты и/или прием активированного угля (60-100 г для взрослых) и/или прием осмотического слабительного средства. Форсированный диурез, повышение щелочности мочи, гемодиализ и гемоперфузия могут быть неэффективными вследствие высокой степени связывания нимесулида с белками плазмы крови. Следует контролировать функции почек и печени.

Побочные реакции

Со стороны крови: анемия, эозинофилия, тромбоцитопения, панцитопения, пурпура.

Со стороны иммунной системы: реакции повышенной чувствительности, анафилаксия.

Метаболические нарушения: гиперкалиемию.

Со стороны психики: чувство тревоги, нервозность, ночные кошмары.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Со стороны органа зрения: нечеткость зрения, расстройства зрения.

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: вертиго (головокружение).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, геморрагия, лабильность артериального давления, приливы, артериальная гипертензия.

Со стороны дыхательной системы: одышка, астма, бронхоспазм.

Со стороны пищеварительного тракта: диарея, тошнота, рвота, запор, метеоризм, гастрит, боль в животе, диспепсия, стоматит, стул черного цвета, кровотечения в пищеварительном тракте, язва и перфорация двенадцатиперстной кишки или желудка.

Со стороны пищеварительной системы: гепатит, мгновенный (фульминантный) гепатит с летальным исходом в том числе, желтуха, холестаз, повышение уровня ферментов печени.

Со стороны кожи: зуд, кожные высыпания, повышенная потливость, эритема, дерматит, крапивница, ангионевротический отек, отек лица, полиморфная эритема, синдром Стивенса - Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, гематурия, задержка мочеиспускания, отеки, почечная недостаточность, олигурия, интерстициальный нефрит.

Общие нарушения: отеки, недомогание, астения, гипотермия.

Лабораторные показатели: повышение уровня печеночных ферментов.

Чаще всего при применении нестероидных противовоспалительных средств (НПВС) наблюдаются побочные реакции со стороны пищеварительного тракта. Возможно возникновение пептических язв, перфораций или кровотечений в пищеварительном тракте, иногда угрожающих жизни, особенно у больных пожилого возраста. Были сообщения о таких побочных реакциях после

применения этой группы препаратов: тошнота, рвота, диарея, вздутие живота, запор, диспепсия, боль в животе, стул черного цвета, рвота с примесью крови, язвенный стоматит, обострение колитов и болезни Крона, гастриты, возникновение отека, артериальной гипертензии и сердечной недостаточности, такие реакции кожи как образование пузырей, синдром Стивенса - Джонсона и токсический эпидермальный некролиз.

Клинические и эпидемиологические исследования свидетельствуют о том, что некоторые НПВП, особенно в высоких дозах и при длительном применении, могут привести к незначительному повышению риска возникновения артериальных тромботических осложнений, например, инфаркта миокарда или инсульта.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд, Производственный участок - II.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Участок № 42, 45, 46, с. Бачупали, округ Медчал Малкайгири, штат Телангана, Бачупали Мандал, Индия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника —

Государственного реестра лекарственных средств Украины.