Нимесил



Код АТХ:

- M01AX17

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Нимесулид

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь в виде светло-желтого зернистого порошка с апельсиновым запахом.

	1 пак. (2 г)
Нимесулид	100 мг

Вспомогательные вещества: кетомакрогол 1000, сахароза, мальтодекстрин, лимонная кислота безводная, апельсиновый ароматизатор.

2 г - пакетики бумажные ламинированные (9) - пачки картонные.
2 г - пакетики бумажные ламинированные (15) - пачки картонные.
2 г - пакетики бумажные ламинированные (30) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат из класса сульфонамидов. Оказывает противовоспалительное, обезболивающее и жаропонижающее действие. Нимесулид действует как ингибитор фермента циклооксигеназы, отвечающего за синтез простагландинов, и ингибирует, главным образом, циклооксигеназу-2.

Фармакокинетика

После приема внутрь препарат хорошо всасывается из ЖКТ, достигая C_{max} в плазме крови через 2-3 ч. Связывание с белками плазмы - 97.5%. $T_{1/2}$ составляет 3.2-6 ч. Легко проникает через гистогематические барьеры.

Метаболизируется в печени при помощи изофермента цитохрома P450 (CYP) 2C9. Основным метаболитом является

фармакологически активное парагидроксипроизводное нимесулида - гидроксинимесулид. Гидроксинимесулид выводится с желчью в метаболизированном виде (обнаруживается исключительно в виде глюкуроната - около 29%).

Нимесулид выводится из организма, в основном почками (около 50% от принятой дозы). Фармакокинетический профиль нимесулида у лиц пожилого возраста не изменяется при назначении однократных и многократных/повторных доз.

По данным экспериментального исследования, проводившегося с участием пациентов с легкой и умеренной степенью почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) и здоровых добровольцев, C_{max} нимесулида и его метаболита в плазме больных не превышала концентрации нимесулида у здоровых добровольцев. AUC и $T_{1/2}$ у пациентов с почечной недостаточностью были выше на 50%, но в пределах фармакокинетических значений. При повторном приеме препарата кумуляции не наблюдается.

Показания к применению:

— лечение острых болей (боль в спине, пояснице; болевой синдром в костно-мышечной системе, включая травмы, растяжения связок и вывихи суставов, тендениты, бурситы; зубная боль);

— симптоматическое лечение остеоартроза с болевым синдромом;

— альгодисменорея.

Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Вывих
- Вывихи
- Зубная боль
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Растяжение
- Травмы

Противопоказания:

— гиперергические реакции в анамнезе, например, бронхоспазм, ринит, крапивница, связанные с приемом ацетилсалициловой кислоты или других НПВП, в т.ч. нимесулида;

— гепатотоксические реакции на нимесулид в анамнезе;

— сопутствующий (одновременный) прием лекарственных средств с потенциальной гепатотоксичностью, например, парацетамола или других анальгезирующих или нестероидных противовоспалительных препаратов;

— воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит) в фазе обострения;

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— лихорадка при инфекционно-воспалительных заболеваниях;

— полное или частичное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух с непереносимостью ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в т.ч. в анамнезе);

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, наличие язвы в анамнезе, перфорации или кровотечения в желудочно-кишечном тракте;

— наличие в анамнезе цереброваскулярных кровотечений или других кровотечений, а также заболеваний, сопровождающихся кровоточивостью;

— тяжелые нарушения свертывания крови;

— тяжелая сердечная недостаточность;

— тяжелая почечная недостаточность (КК < 30 мл/мин), подтвержденная гиперкалиемия;

— печеночная недостаточность или любое активное заболевание печени;

— детский возраст до 12 лет;

— беременность и период грудного вскармливания;

— алкоголизм, наркозависимость;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: тяжелые формы артериальной гипертензии, сахарного диабета 2 типа, сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, заболевания периферических артерий, курение, КК < 60 мл/мин, анамнестические данные о наличии язвенного поражения ЖКТ, инфекции, вызванной Helicobacter pylori; пожилой возраст; длительное предшествующее использование НПВП; тяжелые соматические заболевания; сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин), антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, сертралин).

Решение о назначении препарата Нимесил должно основываться на индивидуальной оценке "риск-польза" при приеме препарата.

Способ применения и дозы:

Нимесил принимают внутрь, по 1 пакетику (100 мг нимесулида) 2 раза/сут. Препарат рекомендуется принимать после еды. Содержимое пакетика высыпают в стакан и растворяют примерно в 100 мл воды. Приготовленный раствор хранению не подлежит.

Нимесил применяется только для лечения пациентов старше 12 лет.

Подростки (в возрасте от 12 до 18 лет): на основе фармакокинетического профиля и фармакодинамических характеристик нимесулида необходимости в корректировке дозы у подростков нет.

Пациенты с нарушенной функцией почек: на основании фармакокинетических данных необходимости в корректировке дозы у пациентов с легкой и умеренной формами почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) нет.

Пациенты пожилого возраста: при лечении пожилых пациентов необходимость корректировки суточной дозы определяется врачом исходя из возможности взаимодействия с другими лекарственными средствами.

Максимальная длительность лечения нимесулидом составляет 15 дней.

Для уменьшения риска возникновения нежелательных побочных эффектов следует использовать минимальную эффективную дозу минимально коротким курсом.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, эозинофилия, геморрагический синдром; очень редко - тромбоцитопения, пацитопения, тромбоцитопеническая пурпура.

Аллергические реакции: нечасто - зуд, сыпь, повышенная потливость; редко - реакции гиперчувствительности, эритема, дерматит; очень редко - анафилактоидные реакции, крапивница, ангионевротический отек, полиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны ЦНС: нечасто - головокружение; редко - чувство страха, нервозность, ночные кошмарные сновидения; очень редко - головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Со стороны органа зрения: редко - нечеткое зрение.

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

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка; очень редко - обострение бронхиальной астмы, бронхоспазм.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, тошнота, рвота; нечасто - запор, метеоризма, гастрит; очень редко - боли в животе, диспепсия, стоматит, дегтеобразный стул, желудочно-кишечное кровотечение, язва и/или перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки; очень редко - гепатит, молниеносный гепатит, желтуха, холестаз, повышение активности печеночных ферментов.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - дизурия, гематурия, задержка мочеиспускания; очень редко -

почечная недостаточность, олигурия, интерстициальный нефрит.

Общие нарушения: редко - недомогание, астения; очень редко - гипотермия.

Прочие: редко - гиперкалиемия.

Передозировка:

Симптомы: апатия, сонливость, тошнота, рвота, боль в эпигастральной области. При поддерживающей терапии гастропатии эти симптомы обычно обратимы. Возможно возникновение желудочно-кишечного кровотечения. В редких случаях возможно повышение артериального давления, острая почечная недостаточность, угнетение дыхания и кома, анафилактоидные реакции.

Лечение: проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет. В случае, если передозировка произошла в течение последних 4 часов, необходимо вызвать рвоту и/или обеспечить прием активированного угля (взрослым от 60 до 100 г) и/или осмотического слабительного. Форсированный диурез, гемодиализ - неэффективны из-за высокой связи препарата с белками (до 97.5%). Показан контроль функции почек и печени.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Как и другие препараты класса НПВП, которые ингибируют синтез простагландинов, нимесулид может отрицательно влиять на протекание беременности и/или на развитие эмбриона и может приводить к преждевременному закрытию артериального протока, гипертензии в системе легочной артерии, нарушению функции почек, которое может переходить в почечную недостаточность с олигодирамнией, к повышению риска кровотечений, снижению контрактильности матки, возникновению периферических отеков. В связи с этим препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакодинамические взаимодействия:

При совместном применении с глюкокортикостероидами повышается риск возникновения желудочно-кишечной язвы или кровотечения.

При совместном применении с антитромбоцитарными средствами и селективными ингибиторами повторного поглощения серотонина (SSRIs), например, флуоксетином увеличивается риск возникновения желудочно-кишечного кровотечения.

НПВП могут усиливать действие антикоагулянтов, таких как варфарин. Из-за повышенного риска кровотечений такая комбинация не рекомендуется и противопоказана пациентам с тяжелыми нарушениями коагуляции. Если комбинированной терапии все же нельзя избежать, необходимо проводить тщательный контроль показателей свертываемости крови.

Диуретики:

НПВП могут ослаблять действие диуретиков.

У здоровых добровольцев нимесулид временно снижает выведение натрия под действием фуросемида, в меньшей степени - выведение калия, и снижает собственно диуретический эффект.

Совместный прием нимесулида и фуросемида приводит к уменьшению (приблизительно на 20%) площади под кривой "концентрация-время" (AUC) и снижению кумулятивной экскреции фуросемида без изменения почечного клиренса фуромесида.

Совместное назначение фуросемида и нимесулида требует осторожности у пациентов с нарушениями функции почек и сердца.

Ингибиторы АПФ и антагонисты рецепторов ангиотензина II:

НПВП могут снижать действие антигипертензивных препаратов. У пациентов с легкой и умеренной степенью почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) при совместном назначении ингибиторов АПФ, антагонистов рецепторов ангиотензина II или веществ, подавляющих систему циклоксигеназы (НПВП, антиагреганты), возможно дальнейшее ухудшение функции почек и возникновение острой почечной недостаточности, которая, как правило, носит обратимый характер. Эти взаимодействия следует учитывать у пациентов, принимающих Нимесил в сочетании с ингибиторами АПФ или антагонистами рецепторов ангиотензина II. Поэтому совместный прием этих препаратов следует назначать с осторожностью, особенно для пожилых пациентов. Пациенты должны получать достаточное количество жидкости, а почечную функцию следует тщательно контролировать после начала совместной терапии.

Фармакокинетические взаимодействия с другими лекарственными средствами:

Имеются данные о том, что НПВП уменьшают клиренс лития, что приводит к повышению концентрации лития в плазме крови и его токсичности. При назначении нимесулида пациентам, получающим терапию препаратами лития, следует осуществлять регулярный контроль концентрации лития в плазме.

Клинически значимых взаимодействий с глибенкламидом, теофиллином, дигоксином, циметидином и антацидными препаратами (например, комбинация алюминия и магния гидроксидов) не наблюдалось.

Нимесулид подавляет активность изофермента CYP2C9. При одновременном приеме с нимесулидом лекарств, являющихся субстратами этого фермента, концентрация данных препаратов в плазме может повышаться.

При назначении нимесулида менее чем за 24 часа до или после приема метотрексата требуется соблюдать осторожность, так как в таких случаях уровень метотрексата в плазме и, соответственно, токсические эффекты данного препарата могут повышаться.

В связи с действием на почечные простагландины, ингибиторы синтетаз простагландинов, к каким относится нимесулид, могут повышать нефротоксичность циклоспоринов.

Взаимодействие других препаратов с нимесулидом:

Исследования in vitro показали, что нимесулид вытесняется из мест связывания толбутамидом, салициловой кислотой и вальпроевой кислотой. Несмотря на то, что данные взаимодействия были определены в плазме крови, указанные эффекты не наблюдались в процессе клинического применения препарата.

Особые указания и меры предосторожности:

Нежелательные побочные эффекты можно свести к минимуму при использовании минимальной эффективной дозы препарата минимально возможным коротким курсом.

Нимесил следует применять с осторожностью у пациентов с желудочно-кишечными заболеваниями в анамнезе (язвенный колит, болезнь Крона), поскольку возможно обострение этих заболеваний.

Риск возникновения желудочно-кишечного кровотечения, язвы или прободения язвы повышается с увеличением дозы НПВП у пациентов с наличием язвы в анамнезе, особенно осложненной кровотечением или прободением, а так же у пожилых пациентов, поэтому лечение следует начинать с наименьшей возможной дозы. У пациентов, получающих лекарственные средства, уменьшающие свертываемость крови или подавляющие агрегацию тромбоцитов, также повышается риск возникновения желудочно-кишечного кровотечения. В случае возникновения желудочно-кишечного кровотечения или язвы у пациентов, принимающих Нимесил, лечение препаратом следует отменить.

Поскольку Нимесил частично выводится почками, дозировку его для пациентов с нарушениями функции почек следует уменьшать, в зависимости от уровня мочевыделения.

Имеются данные о возникновении редких случаев реакций со стороны печени. При появлении признаков поражения печени (кожный зуд, пожелтение кожных покровов, тошнота, рвота, боли в животе, потемнение мочи, повышение активности "печеночных" трансаминаз) следует прекратить прием препарата и обратиться к лечащему врачу.

Несмотря на редкость возникновения нарушений зрения у пациентов, принимавших нимесулид одновременно с другими НПВП, лечение должно быть немедленно прекращено. Если появляется любое нарушение зрения, пациента должен обследовать врач-окулист.

Препарат может вызвать задержку жидкости в тканях, поэтому пациентам с высоким артериальным давлением и с нарушениями сердечной деятельности Нимесил следует применять с особой осторожностью.

У пациентов с почечной или сердечной недостаточностью применять препарат Нимесил следует с осторожностью, поскольку возможно ухудшение функции почек. В случае ухудшения состояния, лечение препаратом Нимесил необходимо прекратить.

Клинические исследования и эпидемологические данные позволяют сделать вывод о том, что НПВП, особенно в высоких дозах и при длительном применении, могут привести к незначительному риску возникновения инфаркта миокарда или инсульта. Для исключения риска возникновения таких событий при применении нимесулида данных недостаточно.

В состав препарата входит сахароза, это следует учитывать пациентам, страдающим сахарным диабетом (0.15-0.18 ХЕ на 100 мг препарата) и лицам, соблюдающим низкокалорийную диету. Нимесил не рекомендуется назначать пациентам с редкими наследственными заболеваниями непереносимости фруктозы, мальабсорбции глюкозы-галактозы или недостаточностью сахарозы-изомальтозы.

При возникновении признаков "простуды" или острой респираторно-вирусной инфекции в процессе лечения препаратом Нимесил прием препарата должен быть прекращен.

Не следует применять Нимесил одновременно с другими НПВП.

Нимесулид может изменять свойства тромбоцитов, поэтому необходимо соблюдать осторожность при применении препарата у лиц с геморрагическим диатезом, однако препарат не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях.

Пожилые пациенты особенно подвержены неблагоприятным реакциям на НПВП, в том числе возникновению желудочно-кишечных кровотечений и перформаций, угрожающих жизни пациента, ухудшению функции почек, печени и сердца. При приеме препарата Нимесил для данной категории пациентов необходим надлежащий клинический контроль.

Как и другие препараты класса НПВП, которые ингибируют синтез простагландинов, нимесулид может отрицательно влиять на протекание беременности и/или на развитие эмбриона и может приводить к преждевременному закрытию артериального протока, гипертензии в системе легочной артерии, нарушению функции почек, которое может переходить в почечную недостаточность с олигодирамнией, к повышению риска кровотечений, снижению контрактильности матки, возникновению периферических отеков. В связи с этим, нимесулид противопоказан при беременности и в период лактации. Применение препарата Нимесил может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность. При планировании беременности необходима консультация с лечащим врачом.

Имеются данные о возникновении в редких случаях кожных реакций (таких как эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз) на нимесулид так же, как и на другие НПВП. При первых признаках кожной сыпи, поражении слизистых оболочек или других признаках аллергической реакции прием препарата Нимесил следует прекратить.

Влияние препарата на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

Влияние препарата Нимесил на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами не изучалось, поэтому в период лечения препаратом Нимесил следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью применять препарат Нимесил следует с осторожностью, поскольку возможно ухудшение функции почек. В случае ухудшения состояния, лечение препаратом Нимесил необходимо прекратить. Препарат противопоказан при тяжелой почечной недостаточности (КК < 30 мл/мин).

У пациентов с легкой и умеренной формами почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) необходимости в корректировке дозы нет.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при печеночной недостаточности или любом активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

Препарат с осторожностью назначается пациентам пожилого возраста. Пожилые пациенты особенно подвержены неблагоприятным реакциям на НПВП, в том числе возникновению желудочно-кишечных кровотечений и перформаций, угрожающих жизни пациента, ухудшению функции почек, печени и сердца. При приеме препарата Нимесил для данной категории пациентов необходим надлежащий клинический контроль.

При лечении пожилых пациентов необходимость корректировки суточной дозы определяется врачом исходя из возможности взаимодействия с другими лекарственными средствами.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям в возрасте до 12 лет.

Подростки (в возрасте от 12 до 18 лет): на основе фармакокинетического профиля и фармакодинамических характеристик нимесулида необходимости в корректировке дозы у подростков нет.

Условия хранения:

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25 °С.

Срок годности:

2 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Nimesil