Нимесулид



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:

Таблетки	**1 таб.**
нимесулид	100 мг

1000 шт. - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры полиэтиленовые.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВП, оказывает противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее и антиагрегантное действие. В отличие от других НПВП селективно подавляет циклооксигеназу-2 (ЦОГ-2), тормозит синтез простагландинов (Pg) в очаге воспаления; оказывает менее выраженное угнетающее влияние на циклооксигеназу-1 (ЦОГ-1) (реже вызывает побочные эффекты, связанные с угнетением синтеза Pg в здоровых тканях).

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь - высокая (прием пищи снижает скорость абсорбции, не влияя на ее степень). Время достижения C_{max} - 1.5-2.5 ч. Связывание с белками плазмы - 95%, с эритроцитами - 2%, с липопротеинами - 1%, с кислым альфа1-гликопротеидом - 1%. Изменение дозы не влияет на степень связывания. C_{max} - 3.5-6.5 мг/л. V_d - 0.19-0.35 л/кг. Хорошо проникает в кислую среду очага воспаления (40%), синовиальную жидкость (43%). Легко проникает через гистогематические барьеры. Метаболизируется в печени тканевыми монооксигеназами. Основной метаболит -4-гидроксинимесулид (25%), обладает сходной фармакологической активностью, но вследствие уменьшения размера молекул способен быстро диффундировать по гидрофобному каналу ЦОГ-2 к активному центру связывания метильной группы. 4-гидроксинимесулид является водорастворимым соединением, для выведения которого не требуются глутатион и реакции конъюгации II фазы метаболизма (сульфатирование, глюкуронирование и др.). $T_{1/2}$ нимесулида - 1.56-4.95 ч, 4-гидроксинимесулида - 2.89-4.78 ч. 4 - Гидроксинимесулид выводится почками

(65%) и с желчью (35%), подвергается энтерогепатической рециркуляции.

Показания к применению:

— ревматоидный артрит;

— остеоартроз;

— артриты различной этиологии;

— артралгии;

— миалгии;

— послеоперационные и посттравматические боли;

— бурсит;

— тендинит;

— альгодисменорея;

— зубная и головная боль.

Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшая боль и воспаление на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Миалгия
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Ревматоидный артрит
- Тендинит

Противопоказания:

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

— эрозивно-язвенные поражения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки;

— активное желудочно-кишечное кровотечение;

— цереброваскулярное или иное кровотечение;

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

— гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;

— декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность (ХСН);

— печеночная недостаточность или любое активное заболевание печени;

— гепатотоксические реакции при использовании нимесулида в анамнезе;

— алкоголизм;

— наркомания;

— выраженная хроническая почечная недостаточность (ХПН) (КК менее 30 мл/мин);

— прогрессирующие заболевания почек;

— подтвержденная гиперкалиемия;

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— одновременный прием других гепатотоксических лекарственных средств;

— детский возраст до 12 лет;

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность.

С *осторожностью:* ИБС, цереброваскулярные заболевания, ХСН, дислипидемия/гиперлилидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, почечная недостаточность (КК менее 30-60 мл/мин), анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, наличие инфекции Helicobacter pylori, пожилой возраст, длительное использование НПВП, тяжелые соматические заболевания, одновременный прием антикоагулянтов (в т.ч. варфарин), антиагрегантов (в т.ч. АСК, клопидогрел), пероральных ГКС, селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Содержимое 1 пакетика гранулята растворяют в 80-100 мл воды. Рекомендуемая доза для **взрослых и подростков в возрасте 12-18 лет** составляет 100 мг (1 пакетик) 2 раза/сут после еды. Максимальная суточная доза для **взрослых и подростков в возрасте 12-18 лет** составляет - 200 мг.

Не требуется снижения дозы для **пациентов пожилого возраста**.

Пациентам с хронической почечной недостаточностью требуется снижение суточной дозы до 100 мг.

Минимально эффективная доза должна назначаться на протяжении как можно более короткого периода времени с тем, чтобы минимизировать риск развития побочных реакций. Максимальная продолжительность приема препарата не должна превышать 15 дней.

Побочное действие:

Аллергические реакции: реакции гиперчувствительности, анафилактоидные реакции.

Со стороны ЦНС: головокружение, ощущение страха, нервозность, кошмарные сновидения, головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Со стороны кожных покровов: зуд, кожная сыпь, усиление потоотделения, эритема, дерматит, крапивница, ангионевротический отек, отечность лица, многоформная экссудативная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

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

Со стороны пищеварительной системы: диарея, тошнота, рвота, запор, метеоризм, гастрит, боли в животе, стоматит, дегтеобразный стул, желудочно-кишечное кровотечение, язва и/или перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки.

Со стороны печени и желчевыводящей системы: повышение печеночных трансаминаз, гепатит, молниеносный гепатит, желтуха, холестаз.

Со стороны системы кроветворения: анемия, эозинофилия, тромбоцитопения, панцитопения, пурпура, удлинение времени кровотечения.

Со стороны дыхательной системы: одышка, обострение бронхиальной астмы, бронхоспазм.

Со стороны органов чувств: нечеткость зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипертензия, тахикардия, геморрагии, приливы.

Прочие: общая слабость, гипотермия.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, сонливость, апатия, желудочно-кишечное кровотечение, повышение АД, острая почечная недостаточность, угнетение дыхания;

Лечение: рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение. Специфического антидота Нимесулида нет. Больным, поступившим в стационар с симптомами передозировки препаратом (в течение 4 ч после его приема или после приема высокой дозы) рекомендуется промывание желудка, прием активированного угля (взрослым - 60-100 мг) и/или слабительного средства осмотического типа. Необходим регулярный контроль функции печени и почек. Данных о возможности выведения нимесулида с помощью гемодиализа нет. Формированный диурез, гемодиализ неэффективны из-за высокой связи препарата с белками.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Имеются данные о том, что нимесулид может снижать биодоступность фуросемида, выступать конкурентом по связыванию белков плазмы с фенофибратом, салициловой кислотой, толбутамидом.

Нимелид может замещать салициловую кислоту и фуросемид (но не варфарин) в плазменных белках.

Он не оказывает никакого влияния на препараты, воздействующие на концентрацию глюкозы крови и толерантность к глюкозе у больных сахарным диабетом, леченных различными препаратами, содержащими производные сульфонилмочевины.

Не рекомендуется прием нимесулида одновременно с мочегонными, оказывающими повреждающий эффект на почечную гемодинамику.

Физиологические концентрации ненасыщенных жирных кислот не влияют на связывание нимесулида с сывороточным альбумином.

В терапевтических концентрациях на связывание нимесулида не влияли варфарин, фуросемид, глибенкламид, дигитоксин.

В присутствии нимесулида могут значительно возрасти свободные фракции метотрексата.

Прием нимесулида в терапевтических дозах внутрь в течение короткого периода не изменяет сывороточный профиль дигоксина у больных со слабо выраженной сердечной недостаточностью.

Концентрация лития в плазме повышается при одновременном приеме препаратов лития и нимесулида. Нимесулид может усиливать действие циклоспорина на почки.

Использование с ГКС, ингибиторами обратного захвата серотонина увеличивает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Особые указания и меры предосторожности:

Для снижения риска развития побочных эффектов необходимо применять препарат в минимальной эффективной дозе с наименьшей продолжительностью. Если состояние больного не улучшается, лечение необходимо прекратить.

Необходимо прекратить прием препарата в случае повышения температуры или развития на фоне его приема гриппоподобных симптомов.

При появлении у больных, принимающих Нимесулид, симптомов, указывающих на повреждение печени (например, анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, повышенная утомляемость, темная моча), или повышения уровня печеночных трансаминаз, препарат следует отменить. Таким больным не рекомендуется назначать Нимесулид и в дальнейшем.

Желудочно-кишечное кровотечение или язва/перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки могут развиться в любой момент при применении препарата, которые могут не сопровождаться клинически выраженными симптомами (в т.ч. болевой синдром). При возникновении желудочно-кишечного кровотечения или язвы препарат следует

отменить.

В случае ухудшения функции почек препарат следует отменить.

В случае использования препарата более 2-х недель необходим контроль показателей функции печени.

У больных циррозом печени или с почечной недостаточностью с гипоальбуминемией или гипербилирубинемией связывание нимесулида снижается.

У больных пожилого возраста наиболее часто развиваются побочные эффекты при приеме препарата, в том числе желудочно-кишечные кровотечения, перфорации, нарушение функции сердца, почек и печени. Поэтому рекомендуется регулярный клинический контроль состояния больного.

Применение нимесулида может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В случае, если при использовании препарата возникают нежелательные явления со стороны ЦНС и органов чувств необходимо воздержаться от вождения автотранспортом и занятий видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженной хронической почечноой недостаточности (ХПН) (КК менее 30 мл/мин); при прогрессирующих заболеваниях почек.

С осторожностью: почечная недостаточность (КК менее 30-60 мл/мин).

Пациентам с хронической почечной недостаточностью требуется снижение суточной дозы до 100 мг.

В случае ухудшения функции почек препарат следует отменить.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности или любом активном заболевании печени.

При появлении у больных, принимающих Нимесулид, симптомов, указывающих на повреждение печени (например, анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, повышенная утомляемость, темная моча), или повышения уровня печеночных трансаминаз, препарат следует отменить. Таким больным не рекомендуется назначать Нимесулид и в дальнейшем.

Применение в пожилом возрасте

Применять с осторожностью у пациетов пожилого возраста.

У больных пожилого возраста наиболее часто развиваются побочные эффекты при приеме препарата, в том числе желудочно-кишечные кровотечения, перфорации, нарушение функции сердца, почек и печени. Поэтому рекомендуется регулярный клинический контроль состояния больного.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 12 лет.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не использовать по истечении срока годности.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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