

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению препарата

Нимесил[®]

Торговое патентованное название препарата: Нимесил[®]

Международное непатентованное название (МИН): нимесулид

Лекарственная форма: гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь.

Состав:

В 1 пакете содержится:

Действующее вещество: нимесулид 100 мг;

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

Описание: светло-желтый зернистый порошок с апельсиновым запахом.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП).

Код АТХ: M01AX17

Фармакологические свойства

Фармакодинамика Нимесулид является нестероидным противовоспалительным препаратом (НПВП) 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 желудочно-кишечного тракта, достигая максимальной концентрации в плазме крови через 2-3 часа; связь с белками плазмы - 97,5%; период полувыведения составляет 3,2-6 часов. 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, проводившемся с участием пациентов с легкой и умеренной степенью почечной недостаточности (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) и здоровых добровольцев, максимальная концентрация нимесулида и его метаболита в плазме больных не превышала концентрации нимесулида у здоровых добровольцев. Площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) и период полувыведения 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.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к нимесулиду или к одному из компонентов препарата.
- Гиперергические реакции (в анамнезе) например, бронхоспазм, ринит, крапивница, связанные с приемом ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов, в том числе 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.
- Лихорадочный синдром при простуде и острых респираторно-вирусных инфекциях.
- Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух с непереносимостью ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в т.ч. в анамнезе);
- Язвенная болезнь желудка или двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, наличие в анамнезе язвы, 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 (клиренс креатинина <30 мл/мин), подтвержденная гиперкалиемия.
- Печеночная недостаточность или любое активное заболевание печени.
- Дети в возрасте до 12 лет.
- Беременность и период лактации.
- Алкоголизм, наркозависимость.

С осторожностью: тяжелые формы артериальной гипертензии, сахарного диабета 2 типа, сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина менее 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, пароксетин, 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 пакетик (100 мг нимесулида) два раза в день. 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 (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 (клиренс креатинина 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.

Побочные действия

Частота классифицируется по рубрикам, в зависимости от встречаемости случая: очень часто (>10), часто (<10-<100), нечасто (<100-<1000), редко (<1000-<10000), очень редко (<10000).

Нарушения со стороны кровеносной и лимфатической систем: редко - анемия, эозинофилия, геморрагии; очень редко - тромбоцитопения, панцитопения, пурпура тромбоцитопеническая.

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

Нарушения со стороны центральной нервной системы: нечасто - головокружение; редко - чувство страха, нервозность, ночные кошмарные сновидения; очень редко - головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Нарушения со стороны органов чувств: редко - нечеткое зрение.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - артериальная гипертензия, тахикардия, лабильность артериального давления, «приливы».

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

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - диарея, тошнота, рвота; нечасто - запор, метеоризм, гастрит; очень редко - боли в животе, диспепсия, стоматит, дегтеобразный стул, желудочно-кишечное кровотечение, язва и/или перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящей системы: очень редко - гепатит, молниеносный гепатит, желтуха, холестаз, повышение активности печеночных ферментов.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящей 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, анафилактикоидные реакции.

Лечение: Симптоматическое. Специфического антидота нет. В случае, если передозировка произошла в течение последних 4 часов, необходимо вызвать рвоту и/или обеспечить прием активированного угля (от 60 до 100 г на взрослого человека) и/или осмотического слабительного. Форсированный диурез, гемодиализ - неэффективны из-за высокой связи препарата с белками (до 97,5 %). Показан контроль функции почек и печени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Фармакодинамические взаимодействия:

Глюкокортикостероиды: повышают риск возникновения желудочно-кишечной язвы или кровотечения.

Антитромбоцитарные средства и селективные ингибиторы повторного поглощения серотонина (SSRIs), например, флуоксетин: увеличивают риск возникновения желудочно-кишечного кровотечения.

Антикоагулянты: 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 снижать 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 фуросемида.

Совместное назначение фуросемида и нимесулида требует осторожности у пациентов с нарушениями почечной или сердечной функций.

Ингибиторы АПФ и антагонисты рецепторов ангиотензина-II

НПВП могут снижать действие антигипертензивных препаратов. У пациентов с легкой и умеренной степенью почечной недостаточности (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) при совместном назначении ингибиторов АПФ, антагонистов рецепторов ангиотензина II или веществ, подавляющих систему циклооксигеназы (НПВП, антиагреганты), возможно дальнейшее ухудшение функции почек и возникновение острой почечной недостаточности, которая, как правило, бывает обратимой. 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 синтеза простагландинов, к которым относится нимесулид, могут повышать нефротоксичность циклоспоринов.

Взаимодействие других препаратов с нимесулидом :

Исследования *in vitro* показали, что нимесулид вытесняется из мест связывания толбутаамидом, 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

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 эпидемиологические 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 в риске возникновения желудочно-кишечных кровотечений и перфораций, угрожающим 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 олигогидрамнией, к повышению риска кровотечений, снижению контрактильности матки, возникновению периферических отеков. В связи с этим, нимесулид противопоказан во время 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.

Форма выпуска

Гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь, 100 мг.

По 2 г гранулята в трехслойные пакеты (бумага/ алюминий/ полиэтилен).

По 9,15 или 30 пакетов с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Список Б.

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

2 года

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Отпуск из аптек

По рецепту врача.

Заявитель/производитель:

«Лаборатория Гуидотти С.П.А.», Италия, произведено «Лабораторное Менарини С.А.», Испания

Дистрибьютор: Берлин - Хеми /Менарини Фарма ГмбХ Глиникер Вег 125, 12489, Берлин, Германия

Адрес для предъявления претензий: 115162, г. Москва, ул. Шаболовка, дом 31 , стр. Б