

Состав

действующее вещество: nimesulide;

1 таблетка содержит нимесулида в пересчете на 100 % вещество 100 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал картофельный, гипромеллоза, кремния диоксид коллоидный безводный, кросповидон, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки желтоватого или желтовато-зеленоватого цвета с двояковыпуклой поверхностью. На поверхности таблеток допускается мраморность.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные и противоревматические препараты. Код АТХ М01А Х17.

Фармакодинамика

Нимесулид – активное вещество, обладающее противовоспалительными, анальгезирующими и жаропонижающими свойствами. Нимесулид селективно ингибирует ЦОГ II (циклооксигеназу II) и угнетает синтез простагландинов в очаге воспаления.

Нимесулид ингибирует высвобождение 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

При приеме внутрь нимесулид быстро всасывается в желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 2-3 часа. Связывание нимесулида с белками плазмы крови достигает 97,5 %.

Препарат метаболизируется в печени, основным продуктом метаболизма является гидроксинимесулид – фармакологически активное вещество.

Около 65 % принятой дозы нимесулида выделяется с мочой, остальные 35 % – с калом.

Показания

- Лечение острой боли, первичной дисменореи.
- Ремесулид следует применять только как препарат второй линии.
- Решение о назначении нимесулида нужно принимать на основе оценки всех рисков для конкретного пациента.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к нимесулиду или к любому компоненту препарата.
- Гиперергические реакции в анамнезе (бронхоспазм, ринит, крапивница) на применение ацетилсалициловой кислоты или других НПВС. Гепатотоксичные реакции на нимесулид в анамнезе.
- Одновременное применение других веществ с потенциальной гепатотоксичностью.
- Алкоголизм и наркотическая зависимость.
- Желудочно-кишечные кровотечения или перфорации в анамнезе, связанные с предыдущим приемом НПВС.
- Язва желудка или двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, наличие в анамнезе язвы, перфорации или кровотечения в пищеварительном тракте.
- Наличие в анамнезе цереброваскулярных кровотечений или других кровоизлияний, а также заболеваний, сопровождающихся кровоточивостью.
- Тяжелые нарушения свертывания крови.
- Тяжелая сердечная недостаточность.
- Тяжелое нарушение функции почек.
- Нарушение функции печени.
- Больные с повышенной температурой тела и/или гриппоподобными симптомами.
- Детский возраст до 12 лет.
- III триместр беременности или период 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 (SSRIs): увеличивается риск возникновения 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.

Диуретические средства, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента и антагонисты ангиотензина II. НПВС могут ослаблять действие диуретиков и других антигипертензивных препаратов. У некоторых больных с нарушением функции почек (например у обезвоженных больных или пациентов пожилого возраста) одновременное применение ингибиторов АПФ, антагонистов ангиотензина II или веществ, угнетающих систему циклооксигеназы, возможно дальнейшее ухудшение функции почек и возникновение острой почечной недостаточности, которая, как правило, является обратимой. Эти взаимодействия следует учитывать тогда, когда больной применяет нимесулид одновременно с ингибиторами АПФ или антагонистами ангиотензина II. Следует быть очень осторожным, применяя такую комбинацию, особенно для пациентов пожилого возраста. Больные должны получать достаточное количество жидкости, а почечную функцию нужно тщательно контролировать после начала применения такой комбинации. Ремесулид временно ослабляет действие фуросемида по выведению натрия и в меньшей степени – выведению калия, а также уменьшает диуретический эффект. Одновременное применение фуросемида и нимесулида больным с нарушением почечной или сердечной функции требует осторожности.

У здоровых добровольцев 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 снижению кумулятивной экскреции фуросемида без изменений почечного клиренса фуросемида.

Фармакокинетические взаимодействия с другими лекарственными средствами.

Были сообщения о том, что НПВС уменьшают клиренс лития, что приводит к увеличению уровня лития в плазме крови и токсичности лития. При назначении Ремесулида больным, получающим терапию препаратами лития, следует часто проводить контроль уровня лития в плазме крови.

Нет клинически значимого взаимодействия с глибенкламидом, теофиллином, варфарином, дигоксином, циметидином и антацидными препаратами (комбинация алюминия и магния гидроксида) *in vivo*. Ремесулид подавляет активность фермента CYP2C9. При одновременном применении с Ремесулидом лекарственных средств, являющихся субстратами этого фермента, концентрация их в плазме крови может повышаться. Нужна осторожность в случае, если нимесулид назначать менее чем за 24 часа до или менее чем через 24 часа после приема метотрексата, поскольку возможно повышение уровня последнего в сыворотке крови и увеличение его токсичности.

Через влияние на почечные простагландины ингибиторы синтетаз, к которым относится нимесулид, могут повышать нефротоксичность циклоспоринов.

Влияние других препаратов на нимесулид.

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

Особенности применения

Нежелательные побочные эффекты можно свести к минимуму, применяя минимальную эффективную дозу в течение самого короткого периода времени, необходимого для контроля симптомов заболевания.

При отсутствии эффективности лечения (уменьшения симптоматики заболевания) терапию препаратом следует прекратить.

Во время лечения нимесулидом рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических препаратов, а также воздерживаться от употребления алкоголя. Применение нестероидных противовоспалительных средств может маскировать повышение температуры тела, которая связана с фоновой бактериальной инфекцией. В случае повышения температуры тела или появления гриппоподобных симптомов у пациентов, принимающих нимесулид, прием препарата следует отменить.

Были сообщения о серьезных реакциях со стороны печени во время лечения нимесулидом, в том числе с летальным исходом. Больным, у которых наблюдаются симптомы, похожие на симптомы поражения печени, такие как анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, повышенная утомляемость, темный цвет мочи, или больным, у которых данные лабораторных анализов функции печени отклоняются от нормы, следует прекратить прием препарата. Повторное

назначение нимесулида таким больным противопоказано. Во время лечения нимесулидом больному следует воздерживаться от применения других анальгетиков. Следует избегать совместного применения других НПВС, в том числе селективных ингибиторов циклооксигеназы-2.

Больным, которые применяют нимесулид и у которых появились гриппоподобные симптомы, следует прекратить его применение.

У больных пожилого возраста повышена частота нежелательных реакций на НПВП, особенно это касается возможных кровотечений и перфораций в пищеварительном тракте, которые могут быть летально опасными.

Язва, кровотечение или перфорация в желудочно-кишечном тракте могут угрожать жизни больного, особенно если в анамнезе имеются данные о том, что подобные явления возникали у больного при применении любых других НПВС (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 использованием защитных средств, например мисопростола или ингибиторов протонного насоса.

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

В случае возникновения у больного, получающего Ремесулид, кровотечения или язвы пищеварительного тракта лечение препарата 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.

Пациентам 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. Таким же образом действовать перед назначением препарата больным с факторами риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, например при артериальной гипертензии, гиперлипидемии, сахарном диабете, при курении.

Больным с нарушением функции почек или сердечной недостаточностью препарат следует назначать с осторожностью в связи с возможностью ухудшения функции почек. В случае ухудшения состояния больного лечение следует прекратить.

Пациенты пожилого возраста нуждаются в тщательном наблюдении из-за возможности развития кровотечений и перфораций пищеварительного тракта, нарушения почечной функции, 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.

Были сообщения о редких случаях тяжелых кожных реакций при применении НПВП, некоторые из них могут быть летально опасными, например эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз. В большинстве случаев, если в течение первого

месяца при ранее назначенном курсе лечения возникали данные реакции, то риск их возникновения у пациентов значительно увеличивается. Ремесулид необходимо отменить при появлении первых признаков кожной сыпи, поражения слизистых оболочек и других аллергических проявлений.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью Lapp-лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять препарат.

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

Исследований влияния нимесулида на способность управлять автотранспортом или другими механическими средствами не проводили, но если при применении нимесулида у пациентов возникали головные боли, головокружение или сонливость, то им следует отказаться от управления автотранспортом или другими 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 простагландинов, может увеличить риск самопроизвольного аборта, возникновение у плода пороков сердца и гастрошизиса. Абсолютный риск развития аномалии сердечно-сосудистой системы повысился менее чем на 1 % примерно до 1,5 %. Считается, что риск увеличивается с увеличением дозы и длительности применения.

Не следует принимать нимесулид в период I и II триместра беременности без крайней необходимости. В случае применения препарата женщинам, которые пытаются забеременеть, или в I и II триместре беременности следует выбирать наименьшую возможную дозу и наименьшую возможную длительность лечения.

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

- пневмокардиального токсического поражения (с преждевременным закрытием артериальных протоков и гипертензией в системе легочной артерии);
- дисфункции почек, которая может прогрессировать до почечной недостаточности с развитием маловодия.

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.

Как НПВС, угнетающие синтез простагландина, нимесулид может вызывать преждевременное закрытие ботталова протока, легочную гипертензию, олигурию, маловодие. Увеличивается риск развития кровотечения, слабости родовой деятельности и периферических отеков. Существуют отдельные сообщения о почечной недостаточности у новорожденных, матери которых применяли нимесулид в конце беременности. Потенциальный риск для человека не определен, следовательно, назначать нимесулид в I и II триместрах беременности не рекомендуется. Поскольку неизвестно, проникает ли нимесулид в грудное молоко, его применение противопоказано в период кормления грудью.

Нимесулид может ухудшить фертильную функцию у женщин, поэтому его не рекомендуется применять женщинам, которые пытаются забеременеть. Женщины, которые не могут забеременеть или женщины, которым проводится обследование относительно бесплодия, должны рассмотреть вопрос о прекращении применения нимесулида. Если беременность установлена при применении нимесулида, то врач должен быть об этом проинформирован.

Способ применения и дозы

С целью предотвращения возникновения и для ослабления проявления побочных реакций препарат следует принимать в течение короткого времени и в минимально эффективной дозе. Назначать препарат следует только после тщательной оценки соотношения риск/польза.

Препарат принимать внутрь после еды, запивая достаточным количеством жидкости.

Для взрослых и детей старше 12 лет – по 1 таблетке (100 мг) 2 раза в сутки – утром и вечером. Максимальная продолжительность лечения – 15 дней.

Для пациентов пожилого возраста указанная схема дозирования в коррекции не нуждается.

Для пациентов с легкой или умеренной степенью почечной недостаточности (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

Дети

Ремесулид детям до 12 лет противопоказан.

Передозировка

Симптомы острой передозировки нестероидными противовоспалительными средствами обычно ограничиваются следующими: 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, угнетения дыхания, комы, однако такие явления встречаются редко. Были сообщения про анафилактикоидные 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 системы крови: анемия, эозинофилия, тромбоцитопения, панцитопения, пурпура.

Со стороны иммунной системы: повышенная чувствительность, анафилаксия.

Метаболические нарушения: гиперкалиемия.

Со стороны психики: чувство страха, нервозность, кошмарные сновидения.

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

Со стороны органов зрения: нечеткость зрения, расстройства зрения.

Со стороны органов слуха: вертиго.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, геморрагия, лабильность артериального давления, приливы, артериальная гипертензия, повышение риска возникновения артериальных тромботических осложнений, например инфаркта миокарда или инсульта, сердечная недостаточность.

Со стороны дыхательной системы: одышка, астма, бронхоспазм.

Со стороны пищеварительного тракта: диарея, тошнота, рвота, в том числе кровавая рвота; запор; метеоризм; гастрит; боль в животе; диспепсия; стоматит; стул черного цвета, кровотечения в пищеварительном тракте; язва и перфорация двенадцатиперстной кишки/желудка; обострение колитов и болезни Крона.

Со стороны гепатобилиарной системы: гепатит; молниеносный (фульминантный) гепатит, с летальным исходом, в том числе желтуха; холестаз.

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

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

Общие нарушения: отек, недомогание, астения, гипотермия.

Лабораторные показатели: повышение уровня печеночных ферментов.

Срок годности

5 лет.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере. По 3 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПАО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 74.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).