

## **Состав**

*действующее вещество:* nimesulide;

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

*вспомогательные вещества:* гидроксипропилцеллюлоза; натрия докузат; целлюлоза микрокристаллическая; лактоза, моногидрат; натрия крахмалгликолят (тип А); магния стеарат.

## **Лекарственная форма**

Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, с риской с одной стороны, бледно-желтого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Нестероидные противовоспалительные и противоревматические средства.

Код АТХ М01А Х17.

## **Фармакодинамика**

Нимесулид – активное вещество, имеющее противовоспалительные, анальгезирующие и жаропонижающие свойства. 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 опухоли и других медиаторов воспаления.

## **Фармакокинетика**

При применении внутрь нимесулид быстро всасывается в пищеварительном тракте.

Максимальная концентрация в плазме крови определяется 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. Первичная дисменорея.

Нимелган следует применять в качестве препарат второй линии.

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

## **Противопоказания**

Известная повышенная чувствительность к нимесулиду или к любому компоненту препарата. Гипераллергические реакции, которые наблюдались в прошлом (бронхоспазм, ринит, крапивница) в связи с применением ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных средств (НПВС); гепатотоксические реакции на нимесулид, которые наблюдались в прошлом; язва желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, рецидивирующие язвы или кровотечения в пищеварительном тракте, желудочно-кишечное кровотечение в анамнезе, цереброваскулярные кровотечения или кровотечение, сопровождающее другие заболевания; тяжелые нарушения свертываемости крови; тяжелая сердечная недостаточность; тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина < 30 мл/мин); печеночная недостаточность; повышенная температура тела и гриппоподобные симптомы, подозрение на острую хирургическую патологию.

Не применять одновременно с другими препаратами, которые потенциально могут быть причиной гепатотоксических реакций.

Алкоголизм и наркотическая зависимость.

## **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.* Увеличивается риск возникновения кровотечений в пищеварительном тракте.

*Антикоагулянты.* НПВС могут усиливать действие антикоагулянтов, таких как варфарин или ацетилсалициловая кислота, поэтому такая комбинация не рекомендуется или противопоказана больным с тяжелыми расстройствами коагуляции. Если такой комбинированной терапии невозможно избежать, необходимо проводить тщательный контроль показателей свертываемости крови.

*Диуретические средства, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента и антагонисты ангиотензина II.* НПВС могут уменьшать действие диуретиков и других антигипертензивных препаратов. У некоторых пациентов с нарушенной функцией почек (например у больных с обезвоживанием или пациентов пожилого возраста) одновременное применение ингибиторов АПФ, антагонистов ангиотензина II или веществ, угнетающих систему циклооксигеназы, может привести к дальнейшему ухудшению функции почек и возникновению острой почечной недостаточности, которая, как правило, бывает 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 пациентам пожилого возраста. Больным необходимо получать достаточное количество жидкости, а почечную функцию нужно тщательно контролировать после начала применения такой комбинации. Нимесулид временно снижает действие фуросемида на выведение натрия, в меньшей степени – на выведение калия и снижает диуретический эффект. Одновременное применение фуросемида и нимесулида требует осторожности относительно пациентов с нарушением почечной или сердечной функции.

У здоровых пациентов 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 (приблизительно на 20 %) площади под кривой «концентрация-время» 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 нимесулида 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). Нимесулид угнетает активность фермента CYP2C9. При одновременном применении с нимесулидом лекарственных средств, являющихся субстратами этого фермента, концентрация их в плазме крови может повышаться. Необходима осторожность в случае, если нимесулид назначать меньше чем за 24 часа до или меньше чем через 24 часа после приема метотрексата, так как возможно повышение уровня последнего в сыворотке крови и увеличение его токсичности.

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

#### Влияние других препаратов на нимесулид

Из-за влияния на почечные простагландины ингибиторы синтетаз, к которым относится нимесулид, могут повышать нефротоксичность циклоспоринов.

Исследования *in vitro* засвидетельствовали, что нимесулид вытесняется из мест связывания толбутамидом, салициловой кислотой и вальпроевой кислотой. Несмотря на то, что эти взаимодействия были определены в плазме крови, обозначенные эффекты не наблюдались в процессе клинического применения лекарственного средства.

#### **Особенности применения**

Нежелательные побочные эффекты можно свести к минимуму, применяя самую меньшую эффективную дозу в течение самого короткого периода времени, необходимого для контроля симптомов заболевания. При отсутствии эффективности лечения (уменьшение симптоматики заболевания) терапию препаратом следует прекратить. Нимесулид следует применять только в качестве лекарственного средства второй линии. Решение о назначении нимесулида необходимо принимать на основании оценки всех рисков для отдельного пациента.

Во время лечения нимесулидом рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических препаратов, а также воздерживаться от употребления алкоголя. Применение НПВС может маскировать повышение температуры тела, связанное с фоновой бактериальной инфекцией. В случае

повышения температуры тела или появления гриппоподобных симптомов у пациентов, применяющих нимесулид, прием препарата необходимо отменить.

Были сообщения о серьезных реакциях со стороны печени во время лечения нимесулидом, в том числе с летальным исходом. Пациенты, у которых наблюдаются симптомы, похожие на симптомы поражения печени, такие как анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, утомляемость, темный цвет мочи, или пациенты, у которых данные лабораторных анализов функции печени отклоняются от нормы, должны прекратить прием препарата. Повторное назначение нимесулида таким больным противопоказано. Во время лечения нимесулидом пациент должен воздерживаться от применения других анальгетиков. После кратковременного применения лекарственного средства в большинстве случаев наблюдалось обратимое повреждение печени.

Следует избегать сопутствующего применения и других НПВС, в том числе селективных ингибиторов циклооксигеназы-2.

У пациентов пожилого возраста повышена частота нежелательных реакций на НПВС, особенно это касается возможных кровотечений и перфорации в пищеварительном тракте, которые могут привести к летальному исходу.

Язва, кровотечение или перфорация в пищеварительном тракте могут угрожать жизни пациента, особенно если в анамнезе есть данные о том, что подобные явления возникали у больного при применении каких-либо других НПВС (без срока давности). Риск подобных явлений увеличивается вместе с увеличением дозы НПВС у больных, имеющих в анамнезе язву в пищеварительном тракте, особенно осложненную кровотечением или перфорацией, а также у пациентов пожилого возраста. Таким пациентам лечение следует начинать с наименьшей возможной эффективной дозы. Для этих больных, а также для тех, которые принимают 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 веществ, например, мисопростола или ингибиторов протонного насоса. Пациенты с токсическим поражением пищеварительного тракта, особенно пациенты пожилого возраста, должны сообщать о любых необычных симптомах, возникающих в области пищеварительного тракта, особенно о кровотечениях. Это особенно важно на начальных стадиях лечения. Больных, принимающих сопутствующие лекарственные средства, которые могут повышать риск возникновения язвы или кровотечения, такие как кортикостероиды, антикоагулянты (варфарин), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС), антитромбоцитарные средства (ацетилсалициловая кислота), нужно

проинформировать о необходимости придерживаться осторожности при применении нимесулида. В случае возникновения у пациентов, получающих нимесулид, кровотечения или язвы пищеварительного тракта лечение препаратом следует прекратить.

Во время лечения препаратом рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических лекарственных средств, анальгетиков, других НПВС, в том числе селективных ингибиторов циклооксигеназы-2, а также алкоголя.

НПВС с осторожностью нужно назначать пациентам с болезнью Крона или с неспецифическим язвенным колитом в анамнезе, так как 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.

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

Есть данные, что некоторые НПВС, особенно в высоких дозах и при длительном применении, могут привести к незначительному риску возникновения артериальных тромботических эпизодов, например, инфаркту миокарда и инсульту. 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 следует назначать после тщательной оценки состояния. Таким же образом следует действовать перед назначением препарата больным с факторами риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, например, при артериальной гипертензии, гиперлипидемии, сахарном диабете, при курении.

Пациентам с почечной или сердечной недостаточностью препарат следует назначать с осторожностью в связи с возможностью ухудшения почечной функции. В случае ухудшения состояния лечение нужно прекратить.

Пациентам пожилого возраста необходимо проводить тщательный клинический контроль из-за возможности развития кровотечения и перфорации пищеварительного тракта, ухудшения функции почек, печени или сердца. Так как 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 очень редких случаях тяжелых кожных реакций при применении НПВС, 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. Препарат необходимо отменить при появлении первых признаков кожных высыпаний, поражении слизистых оболочек и других аллергических проявлений.

Применение нестероидных противовоспалительных средств может маскировать повышение температуры тела, связанное с фоновой бактериальной инфекцией.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с такими редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или нарушения мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует применять этот препарат.

### **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 изучалось. Однако пациентам, которые после применения нимесулида ощущают головокружение или сонливость, следует воздерживаться от управления автомобилем и выполнения работы, требующей повышенного внимания.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

#### *Беременность*

Угнетение синтеза простагландина может неблагоприятно повлиять на беременность и/или развитие плода. Данные, полученные во время эпидемиологических исследований, позволяют сделать вывод о том, что на ранних сроках беременности применение лекарственных средств, угнетающих синтез простагландина, увеличивает риск непроизвольного аборта,

возникновение у плода пороков сердца и гастрошизиса. Абсолютный риск развития аномалии сердечно-сосудистой системы повышался с менее чем 1 % приблизительно до 1,5 %. Считается, что риск увеличивается с увеличением дозы и длительности применения.

Не следует принимать нимесулид в I и II триместрах беременности без крайней необходимости. И в случае необходимости применение лекарственного средства женщинам, которые пытаются забеременеть, или в I и II триместрах беременности следует выбирать как можно меньшую дозу и самую короткую возможную длительность лечения.

Было показано, что у животных введение ингибитора синтеза простагландинов приводит к увеличению пре- и постимплантационных потерь и летальности эмбриона/плода.

Кроме того, у животных, которые получали ингибитор синтеза простагландинов в период органогенеза, была зарегистрирована повышенная частота разных пороков развития, в том числе со стороны сердечно-сосудистой системы.

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 возможны:

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

Поэтому нимесулид противопоказан в III триместре беременности.

Как и другие НПВС, угнетающие синтез простагландина, нимесулид может вызывать преждевременное закрытие боталловой протоки, легочную гипертензию, олигурию, маловодие. Увеличивается риск развития кровотечения, слабости родовой деятельности и периферического отека. Существуют отдельные сообщения о почечной недостаточности у новорожденных, родившихся у женщин, которые применяли нимесулид в конце беременности.

## *Кормление грудью*

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

*Фертильность.* Применение нимесулида может нарушать женскую фертильность и не рекомендуется применять женщинам, планирующим беременность. Женщинам, которые не могут забеременеть или проходят обследования по причине бесплодия, не рекомендуется назначать нимесулид. Если беременность установлена во время применения нимесулида, то врач должен быть проинформирован об этом.

## **Способ применения и дозы**

С целью избежания возникновения и для ослабления проявлений побочных реакций препарат следует принимать в течение самого короткого времени и в минимальной эффективной дозе. Назначать препарат следует только после тщательной оценки соотношения риск/польза.

Препарат принимать внутрь после еды и запивать достаточным количеством жидкости.

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

Для больных пожилого возраста указанная схема дозирования не требует коррекции дозы.

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

## **Дети**

Препарат противопоказан детям младше 12 лет.

## **Передозировка**

*Симптомы.* При передозировке наблюдаются апатия, сонливость, летаргия, тошнота, рвота, боль в надбрюшинной области, также могут возникать желудочно-кишечное кровотечение, артериальная гипертензия, острая почечная недостаточность, угнетение дыхания, анафилактикоидные реакции и кома.

*Лечение.* Специфического антидота нет. В случае передозировки следует проводить симптоматическую и поддерживающую терапию. Больным в течение

первых 4 часов необходимо промыть желудок, принять активированный уголь (60–100 г для взрослых) и осмотическое слабительное средство. Форсированный диурез, повышение щелочности мочи, гемодиализ и гемоперфузия могут быть неэффективными из-за высокой степени связывания нимесулида с белками плазмы крови. Необходим тщательный контроль функции почек и печени.

### **Побочные реакции**

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

*Со стороны иммунной системы:* повышенная чувствительность, анафилаксия.

*Метаболические нарушения:* гиперкалиемию.

*Со стороны психики:* чувство страха, нервозность, ночные кошмары.

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

*Со стороны органов зрения:* нечеткость зрения.

*Со стороны органов слуха:* вертиго (головокружение).

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

*Со стороны дыхательной системы:* одышка, астма, бронхоспазм.

*Со стороны пищеварительного тракта:* диарея; тошнота; рвота; запор; метеоризм; гастрит; боль в животе; диспепсия; язвенный стоматит; вздутие живота; рвота с примесью крови; испражнения черного цвета; пептические язвы; перфорация или кровотечение в пищеварительном тракте, которые иногда угрожают жизни, особенно у пациентов пожилого возраста; обострение колитов и болезнь Крона.

*Со стороны гепатобилиарной системы:* гепатит, молниеносный (фульминантный) гепатит с летальным исходом, 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, образование волдырей.

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

*Общие нарушения:* отеки, недомогание, астения, гипотермия.

*Лабораторные показатели:* повышение уровня печеночных ферментов.

### **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 10 блистеров в коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

ООО «АСТРАФАРМ».

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

08132, Украина, Киевская обл., Киево-Святошинский р-н, г. Вишневое, ул. Киевская, 6.

### **Источник инструкции**

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