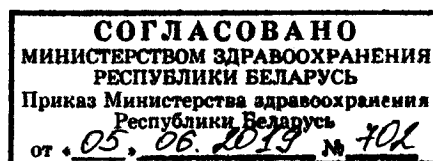


# Министерство здравоохранения Республики Беларусь



## ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства  
**НИМЕСУЛИД ФАРМЛЭНД**  
(информация для специалистов)

**Регистрационное удостоверение РБ:**

**Торговое название:** Нимесулид Фармлэнд

**Международное непатентованное название:** Нимесулид (Nimesulide)

**Химическое название:** N-(4-нитро-2-феноксифенил)метансульфонамид

**Лекарственная форма:** таблетки

**Состав:** каждая таблетка содержит:

*действующее вещество:* нимесулид – 100 мг;

*вспомогательные вещества:* кукурузный крахмал, целлюлоза микрокристаллическая, тальк очищенный, повидон К-30, натрия крахмалгликолят, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

**Описание:** таблетки светло-желтого цвета, круглые, плоские, с фаской, на одной стороне с риской.

**Фармакотерапевтическая группа:** Нестероидные противовоспалительные и противоревматические средства. Код АТС М01А Х17.

### Фармакологические свойства

#### Фармакодинамика

Нимесулид оказывает противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее и антиагрегантное действие. Селективно подавляет ЦОГ2 и тормозит синтез простагландинов в очаге воспаления. Оказывает менее выраженное угнетающее влияние на ЦОГ1 и реже вызывает побочные эффекты, связанные с угнетением синтеза простагландинов в здоровых тканях (особенно в ЖКТ). Нимесулид препятствует активации нейтрофилов и проявляет антиоксидантные свойства, подавляет высвобождение гистамина. Нимесулид также ингибирует высвобождение фактора некроза опухолей альфа, обуславливающего образование цитокинов.

#### Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь высокая. Прием пищи снижает скорость абсорбции, не оказывая влияния на ее степень. Время достижения максимальной концентрации активного вещества в плазме крови - 1-2 ч. Связывание с белками плазмы составляет 95%, с эритроцитами - 2%, с липопротеинами - 1%, с кислыми альфа1-гликопротеидами - 1%. Изменение дозы не влияет на степень его связывания с белками крови. Максимальная концентрация нимесулида в плазме крови достигает 3,5-6,5 мг/л. Доля свободной фракции нимесулида в крови составляет 1%. Объем распределения - 0,19-0,35 л/кг. Хорошо проникает в кислую среду очага воспаления (40% от концентрации в плазме) и в синовиальную жидкость (43%). Легко проникает через гистогематические барьеры. Продолжительность действия около 6-8 ч.

Метаболизируется в печени тканевыми монооксигеназами. Основной метаболит – 4-гидроксинимесулид (25%) обладает сходной фармакологической активностью с нимесулидом. 4-гидроксинимесулид является водорастворимым соединением, для выведения которого не требуются глутатион и реакции конъюгации II фазы метаболизма (сульфатирование, глюкуронирование).

и др.). Экскреция 4-гидроксинимесулида осуществляется почками (65%) и с желчью (35%), при этом подвергается экскреции кишечно-печеночной рециркуляции. Период полувыведения нимесулида составляет 1,56 - 4,95 часа, 4-гидроксинимесулида – 2,89 - 4,78 часа.

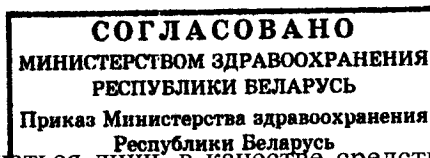
Фармакокинетический профиль нимесулида существенно не меняется у лиц пожилого возраста и детей.

При умеренно выраженной почечной недостаточности (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) максимальная концентрация нимесулида и его основного метаболита в плазме крови не выше, чем у здоровых добровольцев.

При длительном применении нимесулид не кумулируется в организме.

#### Показания для применения

- лечение острой боли;
- первичная дисменорея.



Лекарственное средство может назначаться ~~лицом в качестве средства~~ в качестве средства терапии второй линии. Решение о назначении Нимесулида Фармлэнд должно быть основано на оценке общего риска у каждого конкретного пациента.

#### Способ применения и дозировка

Внутри, после еды.

С целью уменьшения частоты побочных эффектов лекарственное средство необходимо назначать в минимально эффективной дозе при максимальной продолжительности приема не более 15 дней. Рекомендуемая доза для взрослых и подростков в возрасте 12-18 лет составляет 100 мг два раза в сутки после еды.

У пациентов с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина 30-80 мл/мин, а также в пожилом возрасте уменьшение дозы Нимесулида Фармлэнд не требуется.

#### Побочное действие

Следующий список побочных эффектов основан на результатах контролируемых клинических испытаний\* (приблизительно 7800 человек) и фармакологических данных. Случаи побочных реакций классифицируются как очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $> 1/100$ ,  $< 1/10$ ), нечасто ( $> 1/1000$  до  $< 1/100$ ), редко ( $> 1/10\ 000$ ,  $< 1/1000$ ), очень редко ( $< 1/10\ 000$ ), включая отдельные сообщения.

Со стороны системы крови и лимфатической системы	Редко	Анемия*, эозинофилия*
	Очень редко	Тромбоцитопения, панцитопеническая пурпура
Со стороны иммунной системы	Редко	Гиперчувствительность*
	Очень редко	Анафилаксия
Нарушение метаболизма	Редко	Гипергликемия*
Психические нарушения	Редко	Тревога*, нервозность*, кошмары*
	Нечасто	Головокружение*
Со стороны нервной системы	Очень редко	Головная боль, сомнолencia, энцефалопатия (синдром Рейе)
Со стороны органов зрения	Редко	Помутнение зрения*
	Очень редко	Нарушение зрения

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата	Очень редко	Головокружение*
Нарушения со стороны сердца	Редко	Тахикардия*
	Нечасто	Гипертензия*
Со стороны сердечно-сосудистой системы	Редко	Геморрагии*, колебания АД*, приливы*
Со стороны дыхательной системы	Нечасто	Одышка*
	Очень редко	Приступ бронхиальной астмы, бронхоспазм
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Часто	Диарея*, тошнота*, рвота*
	Нечасто	Запор*, метеоризм*, гастрит*, желудочно-кишечное кровотечение, язва и перфорация язвы двенадцатиперстной кишки, язва и перфорация язвы желудка, абдоминальная боль, диспепсия
	Очень редко	Стоматит, мелена
Со стороны гепатобилиарной системы	Часто	Повышение уровня «печеночных ферментов»
	Очень редко	Гепатит, фульминантный гепатит (включая летальные исходы), холестатическая желтуха
Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки	Нечасто	Зуд*, раздражение*, повышенная потливость*
	Редко	Эритема*, дерматит*
	Очень редко	Крапивница, ангионевротический отек Квинке, отек лица, полиморфная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз
Со стороны почек и мочевыводящих путей	Редко	Дизурия*, гематурия*, задержка мочи*
	Очень редко	Почечная недостаточность, олигурия, интерстициальный нефрит
Общие нарушения	Нечасто	Отеки*
	Редко	Общее недомогание*, астения*
	Очень редко	Гипотермия
Лабораторные показатели	Очень часто	Повышенная активность ферментов печени

При появлении каких-либо побочных реакций следует прекратить прием лекарственного средства и проконсультироваться с врачом.

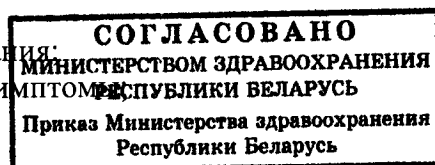
### Противопоказания

Гиперчувствительность в анамнезе к нимесулиду, вспомогательным веществам лекарственного средства «Нимесулид Фармлэнд»;

Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полиноза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных лекарственных средств (в т.ч. в анамнезе);

Эрозивно-язвенные поражения слизистой оболочки желудка или 12-перстной кишки, активное

желудочно-кишечное кровотечение, воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит) в фазе обострения;  
Гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;  
Декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность;  
Гепатотоксические реакции при использовании нимесулида в анамнезе, а также совместное применение с потенциально гепатотоксичными веществами (парацетамолом или другими обезболивающими препаратами), печеночная недостаточность или любое активное заболевание печени;  
Алкоголизм, наркомания, лекарственная зависимость;  
Тяжелые нарушения свёртываемости крови;  
Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек;  
Период после проведения аортокоронарного шунтирования;  
Повышение температуры тела и/или гриппоподобные симптомы;  
Беременность, период лактации;  
Детский возраст (до 12 лет).



*С осторожностью:* ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, хроническая сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 60 мл/мин), анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, пожилой возраст, длительное использование нестероидных противовоспалительных препаратов, тяжелые соматические заболевания, одновременный прием антикоагулянтов (в т.ч. варфарин), антиагрегантов (в т.ч. ацетилсалициловая кислота, клопидогрель), пероральных глюкокортикостероидов, селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

### **Передозировка**

Симптомы: апатия, сонливость, тошнота, рвота, боль в эпигастральной области, которые, как правило, обратимы при поддерживающем лечении. Может возникнуть желудочно-кишечное кровотечение, артериальная гипертензия, острая почечная недостаточность, очень редко - анафилактические реакции, угнетение дыхания, кома.

Лечение: симптоматическая и поддерживающая терапия. Специфического антидота нет. В течение первых 4 часов после передозировки необходимо вызвать рвоту, обеспечить прием активированного угля (60-100 г на взрослого человека), осмотических слабительных средств. Необходим регулярный контроль функции печени и почек. Гемодиализ, а также форсированный диурез, подщелачивание мочи или гемоперфузия могут быть неэффективны по причине высокой степени (до 97,5%) связывания нимесулида с белками плазмы крови.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Одновременное применение Нимесулида Фармлэнд:

- с другими НПВП, болеутоляющими средствами и антикоагулянтами не рекомендуется. Комбинация с варфарином, ацетилсалициловой кислотой или подобными антикоагулянтами не рекомендуется в виду повышенного риска гемморагических осложнений. Если одновременного приема избежать нельзя - необходим постоянный контроль антикоагулянтной активности.

- с препаратами лития снижает клиренс лития с увеличением его концентрации в плазме и повышением токсичности, требуется мониторинг.

- с диуретиками (в частности, с фуросемидом, транзиторно снижает выведение натрия, в меньшей степени калия, и уменьшает диуретический эффект фуросемида).

У больных с нарушенной функцией почек и сердца это сочетание требует осторожности.

- с циклоспорином приводит к увеличению нефротоксичности.

- с метотрексатом: увеличивает уровень метотрексата в сыворотке крови, что приводит к увеличению его токсичности. Необходимо соблюдать осторожность, если Нимесулид Фармлэнд применяется менее чем за сутки до или после применения метотрексата.

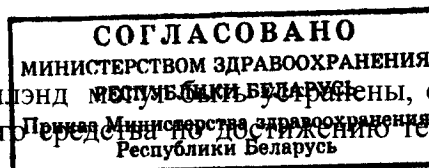
- с глибенкламидом, теofilлином, варфарином, дигоксином, циметидином и антацидами (ком-

бинации соединений алюминия и магния) взаимодействие изучалось in vivo. Клинически значимых взаимодействий не выявлено.

- с противодиабетическими средствами может приводить к вытеснению нимесулида из участков связывания с белками под действием толбутамида, салициловой кислоты и вальпроевой кислоты. Однако, несмотря на возможное повышение концентрации нимесулида в плазме крови, это взаимодействие не продемонстрировало клинической значимости.

### Меры предосторожности

Побочные эффекты применения Нимесулида Фармлэнд могут быть усилены, если проводить лечение коротким курсом, с отменой лекарственного средства по достижению терапевтического действия или из-за неэффективности.



С осторожностью следует назначать Нимесулид Фармлэнд больным с желудочно-кишечными нарушениями, язвенным колитом или болезнью Крона в анамнезе.

При применении нимесулида желудочно-кишечное кровотечение или язва/перфорация могут развиваться в любой момент, с предвестниками или без них, как при наличии желудочно-кишечных осложнений в анамнезе, так и без них. При возникновении желудочно-кишечного кровотечения или язвы прием лекарственного средства следует отменить.

С осторожностью следует назначать Нимесулид Фармлэнд больным с почечной недостаточностью. В случае ухудшения функции почек прием лекарственного средства следует отменить. Лекарственное средство может вызывать задержку жидкости, поэтому у пациентов с высоким АД и с заболеваниями сердца Нимесулид Фармлэнд следует применять также с особой осторожностью.

Каждые 2 недели следует контролировать функциональные пробы печени. Имеются сообщения о гепатотоксических реакциях при приеме нимесулида, в том числе единичных случаях летального исхода. При появлении у больных, принимающих нимесулид, симптомов, указывающих на повреждение печени (например, анорексия, тошнота, рвота, боль в животе, повышенная утомляемость, моча темного цвета), или аномальных результатов функциональных печеночных проб, прием лекарственного средства следует отменить. Таким больным не рекомендуется назначать нимесулид и в дальнейшем.

Учитывая сообщения о нарушениях зрения у пациентов, принимавших др. НПВП, при появлении любого нарушения зрения лечение должно быть немедленно прекращено и проведено офтальмологическое обследование.

Поскольку нимесулид может нарушать функцию тромбоцитов, применять его у больных с геморрагическим диатезом следует с осторожностью, под постоянным контролем. Несмотря на то, что нимесулид может снижать агрегацию тромбоцитов, он не заменяет профилактического действия антиагрегантов (в т.ч. ацетилсалициловая кислота, клопидогрель, тиклопидин) при сердечнососудистых заболеваниях.

Применение НПВП может маскировать повышение температуры, связанное с фоновой бактериальной инфекцией.

Во время лечения Нимесулидом Фармлэнд рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических лекарственных средств, других НПВС, ненаркотических анальгетиков - антипиретиков, в том числе парацетамола, употребления алкоголя.

Применение НПВП может маскировать повышение температуры, связанное с фоновой бактериальной инфекцией.

При приеме Нимесулида Фармлэнд побочные эффекты наиболее часто развиваются у больных пожилого возраста: желудочно-кишечные кровотечения, перфорации, нарушения функции сердца, почек и печени. Поэтому рекомендуется регулярный клинический контроль состояния больного.

### Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

### Применение во время беременности и в период лактации

Нимесулид Фармлэнд противопоказан при беременности. Нимесулид проникает в грудное молоко и его применение в период лактации не рекомендуется.

Как и другие НПВП, угнетающие синтез простагландинов, нимесулид может вызывать преждевременное закрытие артериального протока, легочную гипертензию, олигурию, маловодие. Возрастает риск развития кровотечения, слабости родовой деятельности и периферических отеков. Имеются отдельные сообщения о почечной недостаточности у новорожденных, матери которых принимали нимесулид в конце беременности.

Нимесулид может негативно влиять на женскую фертильность, поэтому лекарственное средство не рекомендуется назначать женщинам, планирующим беременность, особенно, если женщина проходит обследование по поводу бесплодия.

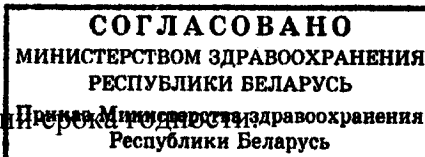
#### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Срок годности**

3 года. Не применять лекарственное средство по истечении срока годности.



#### **Условия отпуска**

По рецепту врача.

#### **Упаковка:**

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке. 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем во вторичной упаковке.

#### **Информация о производителе:**

Произведено, расфасовано и упаковано: Белорусско-голландское совместное предприятие общество с ограниченной ответственностью «Фармлэнд», Республика Беларусь, Минская область, г. Несвиж, ул. Ленинская, 124 – 3, тел./факс (+375 17) 291-31-90.