

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

НАЙЗ®

Регистрационный номер: ЛП-003413

Торговое название: Найз®

Международное непатентованное название: нимесулид

Лекарственная форма: гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь

Состав

1 пакет содержит:

активное вещество: нимесулид 100 мг;

вспомогательные вещества: ароматизатор апельсиновый 5 мг, кросповидон 140 мг, лимонная кислота безводная 25 мг, мальтодекстрин 15 мг, сахароза 1715 мг.

Описание

Смесь гранул и порошка светло-желтого цвета с запахом апельсина.

Фармакотерапевтическая группа:

нестероидный противовоспалительный препарат (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. Подавляет высвобождение гистамина, угнетает синтез интерлейкина-6 и урокиназы. Препарат подавляет агрегацию тромбоцитов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь препарат хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), достигая максимальной концентрации (C_{max}) в плазме крови через 2-3 часа.

Распределение

Связь с белками плазмы – 95%, с эритроцитами – 2%, с липопротеинами – 1%, с кислыми альфа1-гликопротеидами – 1%. Проникает в ткани женских половых органов, где после однократного приема его концентрация составляет около 40% от концентрации в плазме. Хорошо проникает в кислую среду очага воспаления (40%), синовиальную жидкость (43%). Легко проникает через гистогематические барьеры.

Метаболизм

Метаболизируется в печени при помощи изофермента цитохрома P450 (CYP) 2C9. Основным метаболитом является фармакологически активное парагидроксипроизводное нимесулида – гидроксинимесулид.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) нимесулида около 1,56-4,95 часа, гидроксинимесулида – 2,89-4,78 часа. Нимесулид выводится из организма, в основном почками (около 50% от принятой дозы). Гидроксинимесулид выводится почками (65%) и с желчью (35%), подвергается enteroгепатической рециркуляции.

Фармакокинетический профиль нимесулида у лиц пожилого возраста не изменяется при назначении однократных и многократных/повторных доз.

По данным экспериментального исследования, проводившегося с участием пациентов с легкой и средней степенью тяжести почечной недостаточности (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) и здоровых добровольцев, максимальная концентрация нимесулида и его метаболита в плазме пациентов 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.

Лекарственный препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления; не влияет на прогрессирование заболевания.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к нимесулиду или любому вспомогательному компоненту препарата.
- Дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат Найз[®] содержит сахарозу).
- Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в том числе в анамнезе).
- Эрозивно-язвенные изменения 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 сердечная недостаточность.
- Печеночная недостаточность или любое активное заболевание печени.
- Анамnestические данные о развитии гепатотоксических реакций при использовании препаратов нимесулида.
- Алкоголизм, наркомания.

- Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина <30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия.
- Период после проведения аортокоронарного шунтирования.
- Одновременный прием других гепатотоксических лекарственных средств.
- Беременность и период лактации.
- Детский возраст до 12 лет.

С осторожностью

- Артериальная гипертензия, сахарный диабет, компенсированная сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, заболевания периферических артерий, курение, почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 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 Найз® должно основываться на индивидуальной оценке «риск-польза» при приеме препарата.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата Найз® во время беременности и в период грудного вскармливания противопоказано. При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание следует прекратить.

Применение нимесулида может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность. При планировании беременности необходима консультация с лечащим врачом.

Способ применения и дозы

Препарат Найз® принимают внутрь, по 1 пакетiku (100 мг нимесулида) два раза в сутки. Препарат Найз® рекомендуется принимать после еды. Содержимое пакетика высыпав в стакан и растворяют примерно в 100 мл воды (образуется суспензия от белого до светло-желтого цвета). Приготовленный раствор хранению не подлежит.

Препарат Найз® 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 средней степенью тяжести 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 суток.

Для уменьшения риска возникновения нежелательных побочных эффектов следует использовать минимальную эффективную дозу минимально коротким курсом.

Побочное действие

Классификация ВОЗ частоты развития побочных эффектов:

очень часто – $\geq 1/10$ назначений ($>10\%$)

часто – от $\geq 1/100$ до $< 1/10$ назначений ($>1\%$ и $<10\%$)

нечасто – от $\geq 1/1000$ до $<1/100$ назначений ($>0.1\%$ и $<1\%$)

редко – от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$ назначений ($>0.01\%$ и $<0.1\%$)

очень редко – $<1/10000$ назначений ($<0.01\%$)

частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

Редко – анемия, эозинофилия, геморрагии; очень редко – тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения, пурпура тромбоцитопеническая.

Аллергические реакции:

Редко – реакции гиперчувствительности; очень редко – анафилактические реакции.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Нечасто – зуд, сыпь, усиление потоотделения; редко – эритема, дерматит; очень редко – крапивница, ангионевротический отек, отечность лица, многоформная экссудативная эритема, в том числе синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Нарушения со стороны центральной нервной системы:

Нечасто – головокружение; редко – чувство страха, нервозность, «кошмарные» сновидения; очень редко – головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Нарушения со стороны органов чувств:

Редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы:

Нечасто – повышение артериального давления; редко – тахикардия, лабильность артериального давления, «приливы», ощущение сердцебиения.

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, изъязвление слизистой оболочки и/или перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Часто – повышение «печеночных» трансаминаз; очень редко – гепатит, молниеносный гепатит, желтуха, холестаз.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

Редко – дизурия, гематурия, задержка мочеиспускания, гиперкалиемия; очень редко – почечная недостаточность, олигурия, интерстициальный нефрит.

Общие расстройства:

Нечасто – отеки; редко – недомогание, астения; очень редко – гипотермия.

Передозировка

Симптомы: апатия, сонливость, тошнота, рвота, боль в эпигастральной области. Возможно возникновение желудочно-кишечного кровотечения. В редких случаях возможно повышение артериального давления, острая почечная недостаточность, угнетение дыхания и кома, анафилактоидные 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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

Антитромбоцитарные средства и селективные ингибиторы обратного захвата серотонина: 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 гипотензивных препаратов. У пациентов с легкой и средней степенью тяжести 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 нимесулид 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.

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 препаратов, метаболизирующихся с участием этого изофермента, концентрация данных препаратов в плазме может повышаться.

При одновременном применении с *противоэpileптическими препаратами (вальпроевая кислота), противогрибковыми препаратами (кетоназол), противотуберкулезными препаратами (изониазид), амиодароном, метотрексатом, метилдопой, амоксициллином* в сочетании с *клавулановой кислотой* возможен аддитивный гепатотоксический эффект.

Из-за высокой степени связывания нимесулида с белками плазмы, пациенты, одновременно принимающие *сульфониламиды* должны находиться под наблюдением врача, проходя обследование через короткие промежутки времени.

При назначении нимесулида менее чем за 24 часа до или после приема *метотрексата* требуется соблюдать осторожность, так как в таких случаях концентрация 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 *циклоsporинов*.

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

Особые указания

Препарат Найз® 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/перфорации желудка или двенадцатиперстной кишки повышается с увеличением дозы НПВП у пациентов с наличием язвы желудка или двенадцатиперстной кишки в анамнезе, особенно осложненной кровотечением или прободением, а также 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 желудка, или двенадцатиперстной кишки у пациентов, принимающих препарат Найз®, лечение следует прекратить.

При применении препарата более двух недель необходим контроль показателей функции печени (активности «печеночных» трансаминаз).

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.

Пациентам с артериальной гипертензией, нарушениями сердечной деятельности, цереброваскулярными заболеваниями препарат Найз® следует назначать с осторожностью. В случае ухудшения состояния, лечение препаратом Найз® необходимо прекратить.

Поскольку препарат Найз® частично выводится почками, его дозу для пациентов с нарушениями функции почек следует уменьшать, в зависимости от показателей клиренса креатинина. В случае ухудшения функции почек препарат следует отменить.

В состав препарата входит сахароза (0,15-0,18 ХЕ на 100 мг препарата), это следует учитывать пациентам, страдающим сахарным диабетом и лицам, соблюдающим низкокалорийную диету.

Препарат Найз® не рекомендуется назначать пациентам с редкими наследственными заболеваниями непереносимости фруктозы, мальабсорбции глюкозы-галактозы или недостаточностью сахаразы-изомальтазы.

Препарат 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.

Во время лечения препаратом Найз® рекомендуется избегать одновременного применения гепатотоксических препаратов, анальгетиков, других НПВП (за исключением низких доз ацетилсалициловой кислоты, применяемой в антиагрегантных дозах) и употребления этанола.

Пожилые пациенты особенно подвержены неблагоприятным реакциям на НПВП, в том числе в риске возникновения желудочно-кишечных кровотечений и перфораций ЖКТ, угрожающих жизни пациента, а также ухудшению функции почек, печени и сердца. При приеме препарата Найз® для данной категории пациентов необходим регулярный клинический контроль за состоянием этих пациентов.

Риск желудочно-кишечных кровотечений, язв или перфорации повышен при приеме высоких доз нимесулида, у пациентов с язвой желудка или двенадцатиперстной кишки в анамнезе, у пожилых людей. Эти пациенты должны начинать лечение с самой низкой дозы. У данных пациентов, а также лиц, которые принимают нимесулид совместно с кардиологическими дозами ацетилсалициловой кислоты, должна применяться комбинированная терапия совместно с гастропротекторами (ингибиторы протонного насоса или мизопростол).

Для снижения риска нежелательных явлений следует применять минимально эффективную дозу нимесулида минимально возможным коротким курсом.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Влияние препарата Найз® на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами не изучалось, поэтому в период лечения препаратом Найз® 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 в пакет из комбинированного материала (бумага / фольга / полиэтилен).

По 9, 15 или 30 пакетов вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускается по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ООО “Др.Редди’с Лабораторис”,

Россия 115035, г. Москва, Овчинниковская наб., д. 20, стр. 1

тел.: +7 (495) 783-29-01

Производитель

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия

141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

тел: (495) 797-99-54,

факс: (495) 797-96-63

www.canonpharma.ru

Сведения о рекламациях и нежелательных лекарственных реакциях направлять по адресу:

ООО “Др.Редди’с Лабораторис”, Россия

115035, г. Москва, Овчинниковская наб., д. 20, стр. 1

тел.: +7 (495) 783-29-01