

Німедар

БІЛЬ? Буває інакше!

- 😊 Німесулід в саше від Дарниці
- 😊 Знеболює
- 😊 Допомагає подолати запалення та жар



ФАРМАЦЕВТИЧНА ФІРМА
Дарниця

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця». 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

Склад: діюча речовина: nimesulide; 1 однодозовий пакет по 2 г гранул містить німесулід 100 мг; допоміжні речовини: поліетиленгліколю цетостеариловий ефір, мальтодекстрин, кислота лимонна безводна, ароматизатор апельсиновий, цукор кристалічний. **Лікарська форма.** Гранули для оральної суспензії. Основні фізико-хімічні властивості: гранули від світло-жовтого до жовтого кольору. **Фармакотерапевтична група.** Неселективні нестероїдні протизапальні засоби. Код АТХ M01A X17. **Фармакологічні властивості.** Фармакодинаміка. Препарат Німедар – нестероїдний протизапальний засіб групи метансульфонанлідів, який виявляє протизапальну, знеболювальну та жарознижувальну дію. Лікувальна дія препарату Німедар зумовлена тим, що він взаємодіє з каскадом арахідонової кислоти і знижує біосинтез простагландинів шляхом інгібіції циклооксигенази. Фармакокінетика. В організмі людини Німедар добре всмоктується при пероральному прийомі, досягаючи максимальної концентрації у плазмі через 2-3 години. До 97,5% німесулід у зв'язується з білками плазми. Німесулід активно метаболізується у печінці за участю CYP2C9, ізоферменту цитохрому Р 450. Основним метаболітом є парагідроксипохідна, яка також має фармакологічну активність. Період напіввиведення – від 3,2 до 6 годин. Німесулід виводиться із організму з сечею – близько 50 % від прийнятої дози. Близько 29 % від прийнятої дози виводиться з калом у метаболізованому вигляді. Лише 1-3 % виводиться із організму у незміненому стані. Фармакокінетичний профіль у пацієнтів літнього віку не змінюється. **Клінічні характеристики. Показання.** Лікування гострого болю, первинної дисменореї. Німесулід слід застосовувати тільки як препарат другої лінії. Рішення про призначення німесулід потрібно приймати на основі оцінки усіх ризиків для конкретного пацієнта. **Протипоказання.** Гіперчутливість до німесулід або до будь-якого компонента препарату. Гіперергічні реакції у анамнезі (бронхоспазм, риніт, кропив'янка) у зв'язку із застосуванням ацетилсаліцилової кислоти чи інших нестероїдних протизапальних препаратів. Гепатотоксичні реакції на німесулід в анамнезі. Супутнє застосування інших речовин з потенційною гепатотоксичністю. Шлунково-кишкові кровотечі або перфорації в анамнезі, пов'язані із попереднім застосуванням нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ). Виразка шлунка або дванадцятипалої кишки у фазі загострення, наявність в анамнезі виразки, перфорації або кровотечі у травному тракті. Наявність в анамнезі цереброваскулярних кровотеч або інших крововиливів, а також захворювань, що супроводжуються кровоточивістю. Тяжкі порушення згортання крові. Тяжка серцева недостатність. Тяжкі порушення функції нирок. Порушення функції печінки. Підвищена температура тіла у хворого та/або грипоподібні симптоми. Алкоголізм та наркотична залежність. Дитячий вік до 12 років. Третій триместр вагітності та період годування груддю. **Спосіб застосування та дози.** Для того, щоб мінімізувати можливі небажані побічні ефекти, потрібно застосовувати мінімально ефективну дозу протягом найкоротшого часу. Рекомендується вживати після прийому їжі. Максимальна тривалість курсу лікування препаратом Німедар – 15 діб. Дорослі. 100 мг німесулід (1 однодозовий пакет) 2 рази на добу після їжі. Пацієнти літнього віку. Корекція дози не потрібна. Діти віком від 12 років. Корекція дози не потрібна. Пацієнти з порушенням функції нирок. Для пацієнтів із легким або помірним порушенням функції нирок (кліренс креатиніну 30–80 мл/хв) корекція дози не потрібна, у той час як тяжке порушення функції нирок (кліренс креатиніну < 30 мл/год) є протипоказанням до застосування Німедару. Вміст пакета висипають у склянку, розчиняють водою і приймають перорально. Діти. Препарат Німедар дітям віком до 12 років протипоказаний. **Термін придатності.** 2 роки. **Умови зберігання.** Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці. **Упаковка.** По 2 г гранул в однодозовому пакеті; по 9 або по 15, або по 30 пакетів у коробці. **Категорія відпуску.** За рецептом. **Реєстраційне посвідчення** МОЗ України № UA/15433/01/01 від 01.09.2016 р.

Повна інформація міститься в інструкціях для медичного застосування лікарських засобів. Інформація виключно для розміщення в спеціалізованих виданнях, призначених для медичних установ та лікарів, а також для розповсюдження на семінарах, конференціях, симпозіумах з медичної тематики.

Німедар — вітчизняний німесулід у гранулах та гелі для лікування захворювань опорно-рухового апарату

Захворювання опорно-рухового апарату (ЗОРА) досить поширені в Україні та світі. У США щороку реєструється 130 млн випадків ЗОРА, а майже 1 млн працівників тимчасово втрачають працездатність унаслідок подібних хвороб. Що стосується фінансового навантаження, то страхові виплати працівникам через ЗОРА становлять 15 млрд доларів щорічно (Bhattacharya A., 2014). В Україні у 2012 р. захворюваність на ЗОРА становила 3182 на 100 тис. населення, що вдвічі перевищує рівень захворюваності на патології нервової системи та в 1,2 раза – на інфекційні та паразитарні хвороби (Фартушна О.Є., 2014).

Не викликає сумнівів, що найбільш широко застосовуваною при ЗОРА групою медикаментів є нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП), які виступають засобами вибору для стартової терапії та основними симптом-модифікуючими препаратами (Борткевич О.П. і соавт., 2006). R.S. Rasu та співавт. (2013) стверджують, що НПЗП є найбільш часто призначуваними в США ліками для усунення хронічного болю.

Відомим НПЗП є німесулід. Застосування німесуліду в лікуванні гострого болю та в симптоматичній терапії остеоартриту (ОА) схвалено в більше ніж 50 країнах світу (Rainsford K.D., 2006). Коефіцієнт селективності цього препарату становить більше 1000, що перевищує аналогічний показник, наприклад, для мелоксикаму (Rabaseda X., 1996).

Подвійне сліпе дослідження T. Duffy та співавт. (2003) показало, що німесулід характеризується швидким пригніченням продукції простагландину E₂, яка є показником активності циклооксигенази (ЦОГ) 2. Однак препарат продемонстрував затримку в досягненні терапевтичної концентрації в синовіальній рідині, тому автори вважають, що швидкий початок дії німесуліду пов'язаний не з місцевим пригніченням вивільнення простагландинів, а, ймовірно, з центральним механізмом дії.

W. Kullich та співавт. (2002, 2007) виявили, що застосування німесуліду (100 мг 2 р/день протягом 3 тиж) за наявності ОА колінного суглоба супроводжувалося зростанням концентрації антиоксиданта глутатіон-S-трансфери та збільшенням співвідношення тканинного інгібітора матричної металопротеази 3 і власне цієї металопротеази. Під впливом німесуліду також знижувався рівень олігомерного матричного білка хряща – основного маркера прискореної деструкції хрящової тканини суглоба, що свідчить про хондропротекторну дію препарату. Ці зміни супроводжувалися вираженим клінічним покращенням, а саме зниженням інтенсивності скутості та болю за шкалою WOMAC, а також поліпшенням функції суглобів. Вищенаведені результати підтверджують наявність у німесуліді антиоксидантних властивостей, що додатково обумовлює важливість його застосування в лікуванні ОА.

Як відомо, протизапальна активність НПЗП в основному пов'язана з пригніченням ЦОГ-2, однак деякі НПЗП реалізують протизапальні властивості іншими шляхами. Німесулід, що характеризується високоселективним впливом на ЦОГ-2 та коротким періодом напіввиведення, діє також через низку ЦОГ-незалежних механізмів, що обумовлює надзвичайно високу потужність протизапального та знеболювального впливу препарату. Зокрема, шляхи, на які впливає німесулід, включають пригнічення вивільнення фактора некрозу пухлин та гістаміну, продукції активних форм кисню, апоптозу хондроцитів. Мультифакторний механізм дії та швидке знеболення роблять німесулід оптимальним препаратом для лікування ревматологічних хвороб (Dallegrì F. et al., 2007; Bennet A. et al., 2000).

Німесулід показав свою перевагу над іншими НПЗП у численних випробуваннях. M. Bianchi та співавт. (2007) рандомізували пацієнтів з ОА колінного суглоба до груп застосування німесуліду (100 мг 2 р/день) та цефекоксибу (200 мг 1 р/день). Інтенсивність суглобового болю оцінювалася за допомогою візуальної аналогової шкали (ВАШ). Пацієнти також заповнювали анкети стосовно аналгетичної ефективності та загальної переносимості терапії. Авторами вивчалися зразки синовіальної рідини до початку лікування, через 30 хв після першого прийому препарату та через 30 хв після останнього прийому засобу (на 14-й день лікування). У групі із суглобовим випотом ефекти німесуліду були більш вираженими, ніж дія цефекоксибу; також спостерігався швидший початок аналгезії. І після першого прийому, і після курсу лікування німесулід істотно знижував рівень субстанції Р (одного з основних медіаторів болю) та інтерлейкіну-6 у синовіальній рідині. У свою чергу цефекосиб не змінював концентрацію субстанції Р та істотно зменшував рівень інтерлейкіну-6 тільки через 2 тиж застосування.

I. Zgradie (1999) порівняв ефективність і переносимість німесуліду (100 мг 2 р/день) та диклофенаку (50 мг 3 р/день) при різноманітних дегенеративних захворюваннях суглобів та виявив перевагу німесуліду за всіма параметрами ефективності. Подвійне сліпе дослідження B. Omololu та співавт. (2005) також стосувалося порівняння німесуліду та диклофенаку в амбулаторних пацієнтів з ОА кульшових та колінних суглобів. Значна частка пацієнтів групи диклофенаку (50 проти 17,6% групи німесуліду) мала т. зв. «прориви» болю, які призвели до застосування щонайменше 1000 мг парацетамолу на тиждень. Зафіксована істотно вища частота побічних ефектів (ПЕ) у групі диклофенаку (p<0,05).

Хороша переносимість німесуліду обумовлена його хімічною структурою, а саме відсутністю кислотних властивостей, на відміну від інших НПЗП, а також коротким періодом напіввиведення (1,5–5 годин) та відсутністю здатності до кумуляції (Bennett A., 1996). Дослідження A. Conforti та співавт. (n=10 608), виконане у 2001 р., показало, що частота ПЕ з боку травної системи на фоні прийому німесуліду становила 10,4%, при цьому для кетопрофену аналогічний показник становив 21,7%, для диклофенаку – 21,2%, а для піроксикаму – 18,6%.

Крім традиційної таблетованої форми, німесулід доступний і у вигляді гранул для приготування суспензії. При застосуванні гранульованої форми досягнення максимальної концентрації діючої речовини відбувається через 1,22–2 години, а за умов щоденного перорального прийому 2 р/добу стабільна концентрація препарату зберігається протягом 24–48 годин (Bennet A. et al., 2000). Ф.М. Кудашова та співавт. (2007) порівняли швидкість аналгетичної та протизапальної дії гранульованого та таблетованого німесуліду (обидва – 200 мг/день) і диклофенаку натрію (150 мг/день) при подагричному артриті. Пацієнти групи застосування розчинного німесуліду відзначили полегшення болю через 20 хв, таблетованого – у межах 1 год. Інтенсивність болю в спокої та під час руху знижувалася швидше в групі розчинного німесуліду, ніж таблетованого, а також швидше – в обох групах використання німесуліду порівняно з групою терапії диклофенаком. Ліквідація нападу артрити була досягнута у 80% пацієнтів групи розчинного німесуліду, 36% хворих групи таблетованого німесуліду та 13% представників групи диклофенаку.

Однак значна кількість досліджень системних НПЗП показала високу частоту серйозних гастроінтестинальних та кардіоваскулярних ПЕ (Lanza F.L. et al., 2009; Trelle S. et al., 2011; Garcia Rodriguez L.A. et al., 2008). Вважається, що топічні НПЗП асоціюються з меншою частотою ПЕ (Baraf H.S. et al., 2011), але їх ефективність порівняно з такою системних НПЗП залишається одним з найбільш суперечливих питань алгології (Klinge S.A. et al., 2013). Останнім часом вказівки Національного інституту здоров'я та клінічного вдосконалення (NICE, Великобританія), Європейської ліги проти ревматизму (EULAR) та Міжнародного товариства дослідження остеоартриту (OARSI) включають рекомендації щодо призначення топічних НПЗП, зокрема, у пацієнтів високого гастроінтестинального чи кардіоваскулярного ризику (Conaghan P.G. et al., 2008; Smolen J.S. et al., 2010; Zhang W. et al., 2008). Метааналіз S. Derry та співавт. (2012), який включав 34 дослідження за участю 7688 дорослих пацієнтів із хронічним м'язово-скелетним болем, виявив, що топічні НПЗП забезпечували адекватне полегшення болю при ОА суглобів верхніх кінцівок та колін, еквівалентне пероральним НПЗП. Топічні НПЗП забезпечують достатню локальну аналгезію та меншу частоту системних ПЕ (Stanos S.P., 2013; Miyatake S. et al., 2009).

Місцева терапія НПЗП дозволяє досягнути ефектної концентрації діючої речовини безпосередньо в місці нанесення на тлі незначної системної абсорбції (Бадокин В.В., 2011). R.A. Moore та співавт. (1998) показали, що НПЗП місцевої дії ефективно зменшують біль та сприяють ліквідації запалення при гострих та хронічних станах, що супроводжуються больовим синдромом. Жодне з включених в огляд досліджень

не продемонструвало переваг пероральних препаратів над топічними. M. Underwood та співавт. (2008) порівнювали топічні та пероральні НПЗП при хронічному болю в коліні та зробили висновок, що топічні препарати є такими ж ефективними, як пероральні.

F. Erdogan та співавт. (2006) також виявили, що після місцевого застосування німесулід проникає в синовіальну рідину та періартикулярні м'які тканини в необхідній терапевтичній концентрації. Подвійне сліпе рандомізоване плацебо-контрольоване дослідження H. Ergun та співавт. (2007) показало ефективність та безпечність топічного німесуліду в лікуванні ОА колінного суглоба. У дослідженні група активної терапії отримувала топічний 1% гель німесуліду 3 р/день протягом 30 днів, а група плацебо – гель ідентичного вигляду. На відміну від групи плацебо в групі німесуліду спостерігалася істотне покращення згідно з індексом WOMAC (p=0,03) та показниками Ноттінгемського профілю здоров'я. Слід зауважити, що ОА виникають переважно в людей похилого та старечого віку, які є більш чутливими до ПЕ класичних НПЗП, що пояснює потребу в призначенні селективних ліків місцевої дії.

Проспективне обсерваційне дослідження A.I. Dimassi та співавт. (2016) порівнювало результативність використання топічних форм НПЗП при лікуванні м'язово-скелетного болю незначної/помірної інтенсивності з системними препаратами та комбінацією обох форм. Ефективність НПЗП у лікуванні болю становила 82% для топічних препаратів, 92% – для засобів системної дії, 100% – для комбінованої терапії. Середня швидкість початку аналгетичного ефекту становила 17,3±7,19 хв для ліків місцевої дії, 30,0±10,3 хв – для засобів системного впливу, 14,5±3,87 хв – для комбінованого лікування. Дія топічних препаратів та комбінації реалізувалася істотно швидше, ніж дія системних НПЗП (p<0,05). Середня тривалість знеболення була найвищою в групі комбінованого лікування: 11±2,05 проти 10±3,74 хв у групі системних НПЗП та 7±3,46 хв для топічних засобів. Цікаво, що частота ПЕ в групі комбінованого лікування виявилася меншою, ніж у групі системного застосування НПЗП. На думку авторів, це можна пояснити тим, що за умов поєднання засобів різної дії системні НПЗП застосовуються в нижчій дозі та з меншою частотою.

С.Х. Тер-Вартанян та співавт. (2007) порівнювали монотерапію вітчизняним німесулідом (ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця») з комплексним лікуванням цим препаратом у сполученні з німесулідом у формі гелю того ж виробника. Було виявлено, що в групі монотерапії тривалість ранкової скутості після курсу лікування скоротилася на 50,1% (до лікування – 96,4±18,4 хв, після – 48,1±15,8 хв), а в групі комплексної терапії – на 60,6% (89,9±17,3 та 35,4±16,8 хв відповідно). Зменшення вираженості болю за ВАШ у спокої на ≥50% було виявлено в 66,7% хворих 1-ї групи та 72,2% – 2-ї. На тлі лікування німесулідом спостерігалася істотне зменшення кількості болючих суглобів: у 1-й групі – у 55,6% хворих, у 2-й – у 66,7%. Збільшення об'єму активних рухів в уражених суглобах відзначило 66,7% пацієнтів групи монотерапії та 83,3% хворих групи комбінованого лікування. Таким чином, за наявності ЗОРА (зокрема тих, що супроводжуються вираженим больовим синдромом) поєднане використання німесуліду системної та топічної дії дозволяє досягти оптимальної аналгезії на фоні меншої кількості ПЕ.

Німедар (ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця») – німесулід українського виробництва – представлений у 2 формах: гранули для приготування оральної суспензії (100 мг/2 г у саше) та гель (10 мг/г у тубі). Одночасне застосування обох лікарських форм дозволяє інтенсифікувати режим призначення НПЗП і досягти максимально швидкого та результативного знеболення. Варто зауважити, що порівняно з мазями гелі є більш ефективною лікарською формою, оскільки вони краще проникають в органи-мішені (Бадокин В.В., 2011).

Оскільки ЗОРА частіше спостерігаються в осіб похилого та старечого віку, серед яких значна частка – соціально незахищені верстви населення, особливе значення має вартість призначуваного препарату. Німесулід вітчизняного виробництва Німедар (ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця») має невисоку вартість порівняно з аналогами («Моріон», станом на січень 2017 р.), що дозволяє отримати адекватне лікування усім категоріям пацієнтів.

Підготувала **Лариса Стрільчук**