

# НИМУЛИД



- ННА, Селективный НПВС (ингибитор ЦОГ-2)



# НИМУЛИД®



Это - нестероидное противовоспалительное средство (НПВС), анальгетик-антипиретик, селективный ингибитор ЦОГ-2

Активное (действующее) вещество - *Nimesulid*  
(4-нитро-2-фенокси-метан-сульфонанилид)

# НИМУЛИД®

- ✓ Первый нимесулид, зарегистрированный в России;
- ✓ Рекомендован НИИ ревматологии РАМН;
- ✓ Рекомендован НИИ педиатрии и детской хирургии МЗ РФ.



# НИМУЛИД<sup>®</sup>

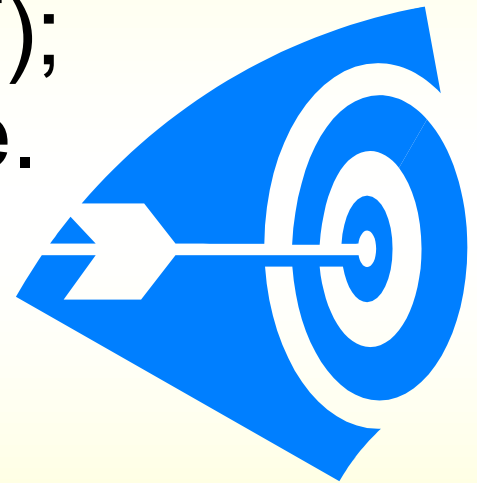
**Не является кислотой** (р<sub>ка</sub> = 6.5),

поэтому:

- ✓ не раздражает ткани (ЖКТ);
- ✓ не кристаллизуется в моче.

**Легко проникает:**

- ✓ в очаг воспаления  
(40% от концентрации в плазме);
- ✓ в синовиальную жидкость (43%);
- ✓ в центр терморегуляции.



# НИМУЛИД®

## Эффект:

- ✓ развивается **быстро** (через 15-30 минут после применения);
- ✓ длится **долго** (8-12 часов);
- ✓ не сопровождается раздражающим и нефротоксическим действием.



# НИМУЛИД®

## В крови:

- ✓ связывается с альбуминами (на 95%)
- ✓ связывается с эритроцитами (2%)
- ✓ связывается с липопротеидами (1%)
- ✓ связывается с гликопротеидами (1%)
- ✓ 1% - в виде свободной фракции.

Не вытесняет другие лекарства из связи с белками плазмы крови.

# НИМУЛИД®

- ✓ **Не гепатотоксичен,** метаболизм (гидролиз в 4-м положении) происходит только в микросомальной системе (на естественном «конвейере» переработки ксено-, и эубиотиков). Риск повышения активности АЛТ, АСТ – менее 0,00006%.
- ✓ **Не кумулирует.**  $T_{1/2}$  не более 5 часов.
- ✓ Фармакокинетика и дозировка (5 мг/кг/сут) не зависят от возраста и состояния почек.
- ✓ Время назначения не зависит от приема пищи.

# НИМУЛИД®

- ✓ Селективно ингибирует ЦОГ-2 (в 58,8 раза сильнее, чем ЦОГ-1).
- ✓ Ингибирует экспрессию гена ЦОГ-2 в хромосоме 1, поэтому степень его селективности не утрачивается при повышении дозы.
- ✓ Общая частота побочных эффектов (диспепсия) составляет 8,2-8,6%, что статистически неотличимо от плацебо-эффекта (7,3%).



# НИМУЛИД®

- ✓ Тормозит апоптоз хондроцитов
- ✓ Ингибирует металлопротеазы (эластазу, гиалуронидазу), разрушающие хрящи.



**Нимулид,  
в отличие от всех  
других НПВС, не  
разрушает, а защищает  
хрящевую ткань.**

# НИМУЛИД®

✓ Ингибирует фосфодиэстеразу IV типа.

Накопление цАМФ стимулирует выброс эндогенного кортизола надпочечниками, и тормозит дегрануляцию клеток и выброс медиаторов аллергии – гистамина, интерлейкинов и пирогенных цитокинов.

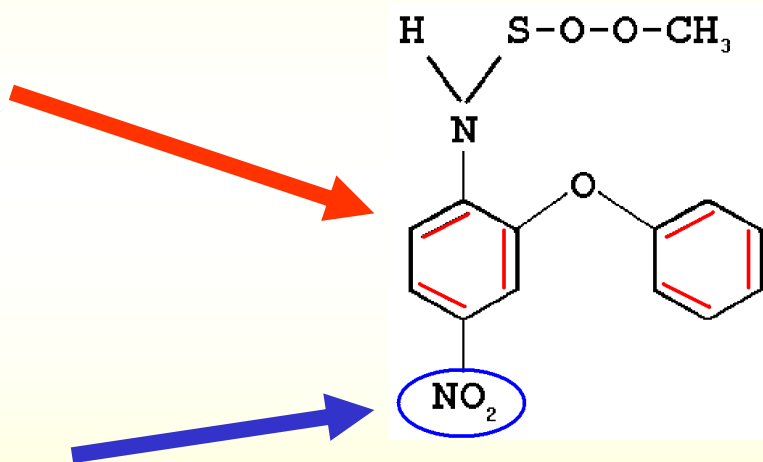
Потенцируется противовоспалительное, обезболивающее и жаропонижающее действие, развивается **противоотечный и антиаллергический эффект.**

# НИМУЛИД®

- ✓ Можно использовать у больных с астмой, аллергиями и непереносимостью других НПВС.
- ✓ Является капилляропротектором (угнетает гиалуронидазу сосудистой стенки).
- ✓ Может усиливать эффекты непрямых антикоагулянтов.

# НИМУЛИД®

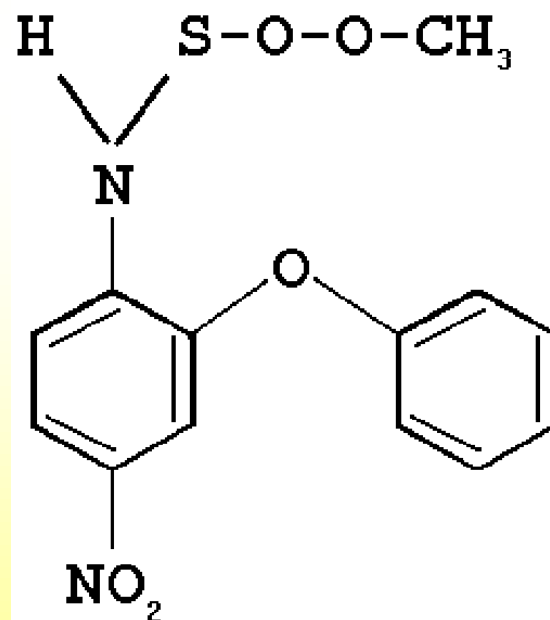
Является неферментным антиоксидантом водной фазы, ограничивает развитие свободно-радикальной патологии



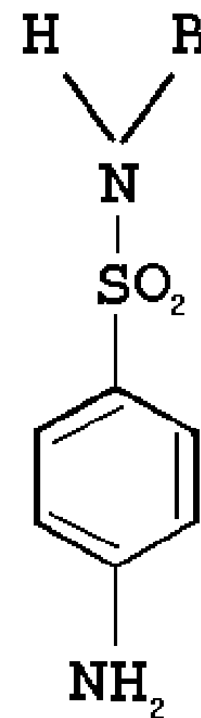
Уменьшает спастические и ишемические боли (при мигрени, альгоменорее, мастопатии и др.), потенцирует противоотечный эффект и улучшает трофику в очаге поражения.

# НИМУЛИД®

Химическая структура активной субстанции Нимулида обеспечивает ему отсутствие перекрестной аллергии к другим медикаментам:



СульфонАНИЛИД



СульфанилАМИД

# НИМУЛИД®

Высокая чистота активной субстанции и запатентованный набор вспомогательных компонентов обеспечивают:

- ✓ Длительный срок хранения
- ✓ Гипоаллергенные свойства
- ✓ Хорошую переносимость  
(в 99,62% наблюдений)

# НИМУЛИД®

Таблетки для приема внутрь НИМУЛИД по 100 мг (№30).

Используются как эффективное противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее средство (в том числе для длительной безопасной терапии).



# НИМУЛИД®

Показания - остеоартрозы I-III стадии, ревматоидный артрит, реактивные артриты, болезнь Бехтерева, синовит, тендинит, тендовагинит, бурсит, невралгия, миалгия, синуситы, отиты, фарингиты, ларингиты, тонзиллиты, грипп и простудные заболевания, и хронический пневмония,

пие

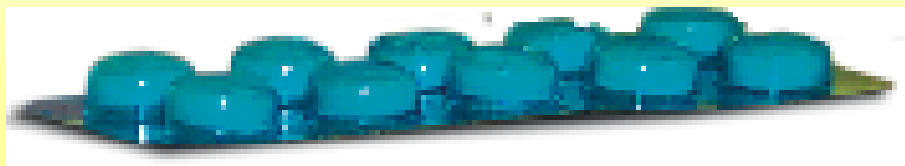




# НИМУЛИД®

Таблетки для приема внутрь НИМУЛИД по 100 мг (№30).

Дозировка – по 1-2 таблетки 2 раза в сутки (до 5/мг/кг массы в сутки, или до 400 мг в сутки)

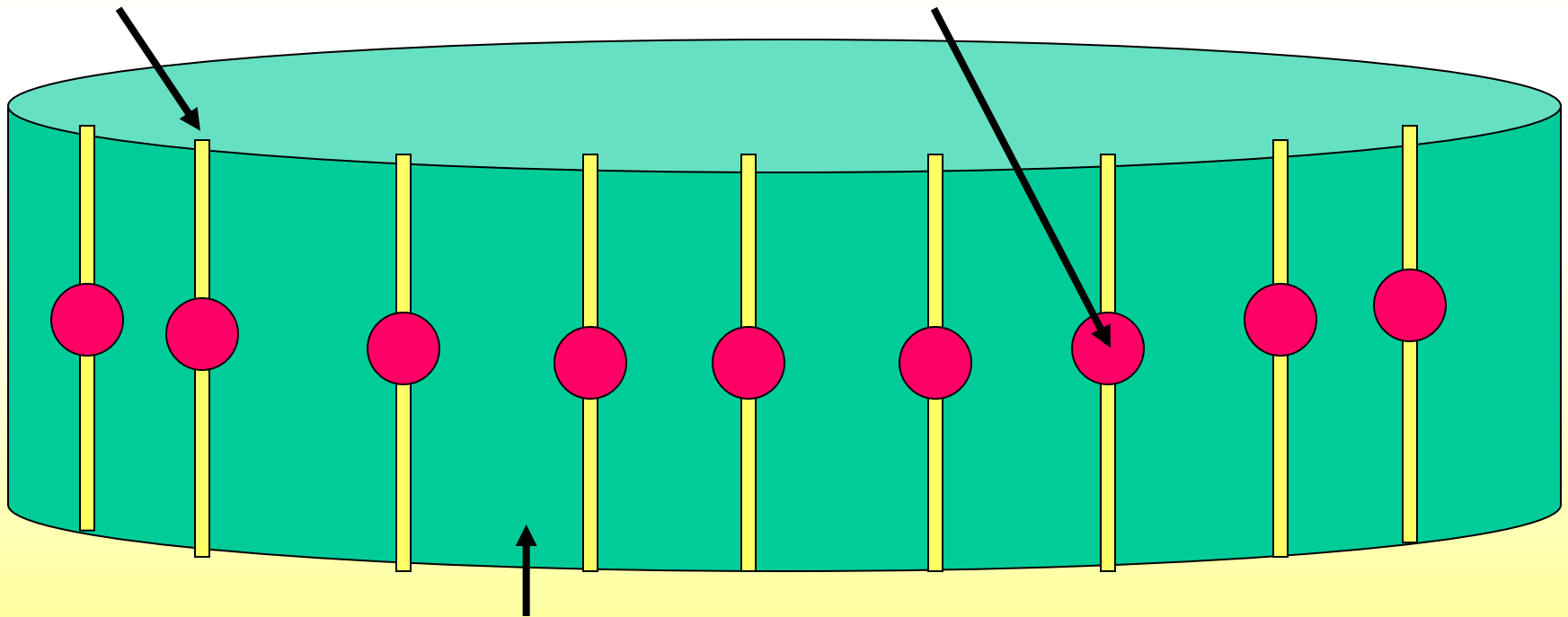


# НИМУЛИД®

## Лингвальные таблетки НИМУЛИД-ЛТ 0,1 №20

- ✓ Разработаны в Исследовательском Центре «Панацея Биотек» в 1999 году
- ✓ Технология лингвальных таблеток запатентована

Микропоры, обеспечивающие доступ слюны к активному веществу



Быстрорастворимый матрикс, стимулирующий выделение слюны

# НИМУЛИД®

**«СКОРАЯ ПОМОЩЬ ПРИ ОСТРОЙ БОЛИ» -**

**Лингвальные таблетки НИМУЛИД-ЛТ 0,1 №20**

- ✓ Если полость рта сухая, то после попадания на язык стимулируется выделение слюны.
- ✓ Для полного растворения таблетки достаточно всего 0,5 мл слюны.
- ✓ Распад таблетки в полости рта за 30 секунд
- ✓ Через 60 секунд активное вещество начинает поступать в кровь, минуя венозную систему печени при первом прохождении.



# НИМУЛИД®

Лингвальные таблетки НИМУЛИД-ЛТ 0,1 №20

Фармакокинетика препарата обеспечивает:

- ✓ Быстрое всасывание (в полости рта) - наступает на 17-20% быстрее, чем при приеме обычной таблетированной формы.
- ✓ Пик концентрации в крови достигается быстрее - **ускорение анальгезии на 25%**.
- ✓ Быстрое достижение пика концентрации обеспечивает **усиление анальгезии на 22%**.

# НИМУЛИД-ЛТ®

- ✓ Применяется при любых болях воспалительной этиологии, при онкологических и травматических болях, а также при менструальных болях, мастопатии, мигрени, при зубной боли и т.д.
- ✓ Не требует глотания и запивания водой.
- ✓ Дозировка – 5 мг/кг/сутки - по 1 таблетке на язык (до 4 таблеток в сутки).



# НИМУЛИД®

Трансдермальный Гель НИМУЛИД 1% 30,0

Уникальная, запатентованная в США, технология местного применения обеспечивает рекордную для мазевых форм биодоступность – 70% поступление активного вещества в местные ткани.



# НИМУЛИД®

**Трансдермальный Гель НИМУЛИД 1% 30,0**  
Используется как эффективное и безопасное местное обезболивающее средство при болезненных, воспалительных или травматических поражениях суставов, связок, хрящей (менисков), сухожилий и мышц при травмах, вывихах, растяжениях, артрозах, артритах, бурситах, болевом синдроме при остеохондрозе, флебитах и др.



# НИМУЛИД®

**Трансдермальный Гель НИМУЛИД 1% 30,0**

Не оставляет пятен на коже и одежде,  
приятно пахнет, бесцветный.

**Дозировка** – наносится на неповрежденную  
кожу в области пораженного участка тела  
(длина выдавливаемого столбика – 3 см) 3-4  
раза в сутки, распределяется в течение 30-60  
секунд





# НИМУЛИД®

## Детская суспензия НИМУЛИД 1% 60 мл

✓ Может использоваться как жаропонижающее и анальгетическое средство даже у недоношенных новорожденных детей.



- ✓ В Российской Федерации клинические испытания проведены на детях в возрасте 2-15 лет.
- ✓ Рекомендована НИИ педиатрии и детской хирургии.



# НИМУЛИД®

## Детская суспензия НИМУЛИД 1% 60 мл

- ✓ Действует всю ночь
- ✓ Обладает привлекательным запахом манго, умеренно сладким индифферентным вкусом.
- ✓ В отличие от других суспензий нимесулида не имеет «мыльного» привкуса и выраженного ощущения горечи после приема
- ✓ Не содержит сахара (фруктоза)

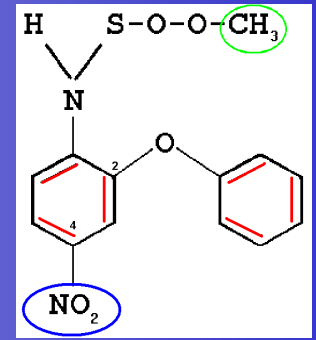


# НИМУЛИД®

**Детская суспензия НИМУЛИД 1% 60 мл**

- ✓ **Дозировка** – 0,25 мл на 1 кг массы однократно (использовать мерную крышку), или в 2-3 приема по 0,5 мл (5 мг) на 1 кг массы в сутки. Можно не запивать.
- ✓ **Перед употреблением взбалтывать!**
- ✓ В отличие от любых суспензий парацетамола – стоимость лечения в несколько раз ниже, жаропонижающий эффект наступает быстрее, длиться дольше и не связан с высоким риском побочных эффектов.

# НИМУЛИД



НПВС, анальгетик-антипиретик,

селективный (58,8:1) ингибитор ЦОГ-2 (1976),

## Отличия от других селективных НПВС:

- ингибитор экспрессии гена ЦОГ-2 в хромосоме 1
- ингибитор металлопротеаз
- ингибитор ФДЭ-IV
- pKa=6,5 – лучшая кинетика !!!



1995

1996

1997

1998

1999

2000

2001

2002...03