

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

НЕОЛИН 100 mg гранули за перорална суспензия в саше
NEOLIN 100 mg granules for oral suspension in sachet

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяко саше съдържа 100 mg Нимезулид (Nimesulide).

Помощно вещество с известно действие: захароза.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Гранули за перорална суспензия в саше.
Жълти гранули с цитрусов аромат.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. № 20250179	
Разрешение №	30-05-2025
ВГ/МА/МР -	69006
Одобрение №	

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лечение на остра болка (вижте точка 4.2).

НЕОЛИН е нестероидно противовъзпалително лекарство (НСПВС) с аналгетични (обезболяващи, болкоуспокояващи) и антипиретични (понижаващи температурата) свойства.

Прилага се за лечение на остра болка, както и за лечение на менструални болки.

НЕОЛИН трябва да се предписва само като лечение от втора линия. Решението да се предприше нимезулид трябва да се основава на оценка на общите рискове при отделните пациенти (вижте точки 4.3 и 4.4).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка



НЕОЛИН трябва да се прига за възможно най-кратък период от време, в зависимост от клиничната ситуация.

Минималната ефективна доза трябва да се прилага за възможно най-краткия период от време, за да се намалят нежеланите реакции (вижте точка 4.4). Максималната продължителност на лечебния курс с НЕОЛИН е 15 дни.

За възрастни

Препоръчителната доза е едно сашедва пъти дневно след хранене.

Пациенти в напреднала възраст

При тях е необходимо да се намали дневната доза (вижте точка 5.2).

Педиатрична популация

Деца (под 12 години): НЕОЛИН е противопоказан при тези пациенти (вижте точка 4.3).

Младежи (от 12 до 18 години): на базата на кинетичния профил при възрастни и на фармакодинамичните характеристики на нимезулид, не е необходима промяна на дозировката при тези пациенти.

Пациенти с увредена бъбречна функция:

На базата на фармакокинетиката, не е необходимо понижение на дозировката при пациенти с леко до средно бъбречно увреждане (креатинов клирънс 30-80 ml/min).

НЕОЛИН е противопоказан в случай на тежка бъбречна недостатъчност (креатининов клирънс <30 ml/min) (вижте точки 4.3 и 5.2).

Пациенти с нарушена чернодробна функция:

Употребата на НЕОЛИН е противопоказна при пациенти с чернодробна недостатъчност (вижте точки 4.3 и 5.2).

Начин на приложение

Изсипете съдържанието на сашето в чаша вода и разбъркайте добре. Изпийте суспензията веднага след приготвянето и`.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- пациенти с анамnestични данни за реакции на свръхчувствителност (напр. бронхоспазм, ринити, уртикария) към ацетилсалицилова киселина или към други нестероидни противовъзпалителни лекарствени продукти;
- пациенти с анамnestични данни за хепатотоксични реакции към нимезулид.



- едновременно приложение с други потенциално хепатотоксични лекарствени вещества;
- алкохолизъм, лекарствена зависимост;
- анамнеза за стомашно-чревно кървене или перфорация, свързани с предишна терапия с НСПВС;
- активна язва на стомаха или на дванадесетопръстника или анамнеза на рецидивираща язва/кръвоизлив на/от храносмилателните органи (два или повече изяви епизода на доказано образуване на язва или кървене);
- цереброваскуларно кървене или друго активно кървене или нарушения свързани с кървенето;
- пациенти с тежки смущения в кръвосъсирването;
- пациенти с тежка сърдечна недостатъчност;
- пациенти с тежка бъбречна недостатъчност;
- пациенти с чернодробна недостатъчност;
- пациенти с повишена температура и/или грипоподобни симптоми;
- деца под 12 години;
- трети триместър на бременността и при кърмене (вижте точки 4.6 и 5.3).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Едновременната употреба на НЕОЛИН с други НСПВС, включително циклооксигеназа-2 селективни инхибитори, не се препоръчва. В допълнение по време на лечение с НЕОЛИН пациентите трябва да бъдат съветвани да се въздържат от употребата на други аналгетици. Нежеланите лекарствени реакции могат да бъдат намалени като за контролиране на симптомите се употребява възможно най-ниската ефективна доза за възможно най-кратък период от време (вижте точка 4.2).

Лечението трябва да бъде прекратено, ако не се наблюдава положителен ефект.

Чернодробни реакции

В редки случаи е установено, че нимезулид е свързан със сериозни чернодробни реакции, включително много редки случаи с фатален изход (вижте също точка 4.8). Пациентите, при които се наблюдават симптоми съответстващи на чернодробно увреждане по време на лечение с нимезулид (напр. анорексия, гадене, повръщане, болки в корема, умора, тъмна урина) или пациенти, чиито тестове показват анормална функция на черния дроб, трябва да прекратят лечението. Тези пациенти не трябва да бъдат подлагани отново на лечение с нимезулид. Има съобщения за увреждане на черния дроб след кратко приемане на лекарството, но в повечето случаи обратимо.

При повишаване на температурата и/или при поява на грипоподобни симптоми при пациенти лечението с нимезулид трябва да се прекрати.



Гастроинтестинални реакции

Съобщава се за стомашно-чревно кървене, образуване на язва и перфорация, която може да бъде фатална при всички НСПВС, по всяко време на терапията, с или без предупредителни симптоми или анамнеза за стомашно-чревни заболявания.

Рискът от стомашно-чревно кървене, образуване на язва или перфорация се повишава с увеличаване на дозите на НСПВС при пациенти с анамнеза за язва, особено ако е усложнена с кръвоизлив или перфорация (вижте точка 4.3) и при пациенти в напреднала възраст. Тези пациенти следва да започнат лечение с възможно най-ниската доза.

Комбинирана терапия със защитни агенти (напр. микопростол или инхибитори на протонната помпа) е подходяща за тези пациенти, както и за пациенти, нуждаещи се от съпътстващи малки дози аспирин или други лекарствени средства, които биха могли да повишат стомашно-чревния риск (вижте точка 4.5).

Пациенти с анамнеза за стомашно-чревна токсичност, особено в напреднала възраст, следва да съобщават за всички необичайни коремни симптоми (особено стомашно-чревно кървене) и особено в началните стадии на лечение.

Стомашно-чревно кървене или образуване на язва/перфорация може да се появи по всяко време на лечението с или без предупредителни симптоми или анамнеза за гастроинтестинални заболявания. Ако се появи стомашно-чревно кървене или язва нимезулид трябва да бъде спрял. Нимезулид следва да се прилага с повишено внимание при пациенти със стомашно-чревни заболявания, включително анамнеза за пептична язва, гастроинтестинално кървене, язвен колит или болест на Крон.

Пациенти, приемащи съпътстващи медикаменти, които биха могли да повишат риска от образуване на язва или кървене, като например перорални кортикостероиди, антикоагуланти като варфарин, селективни инхибитори на обратния захват на серотонина или анти-тромбоцитни агенти като аспирин, следва да бъдат посъветвани да са внимателно (вижте точка 4.5).

При поява на стомашно-чревно кървене или образуване на язва при пациенти, приемащи нимезулид, лечението следва да бъде преустановено.

НСПВС следва да се дават с повишено внимание на пациенти с анамнеза за стомашно-чреви заболявания (язвен колит, болест на Крон), тъй като състоянието им може да се влоши (вижте точка 4.8).

Пациенти в напреднала възраст: при пациентите в напреднала възраст се наблюдава увеличение на честотата на нежеланите реакции към НСПВС, по-специално стомашно-чревно кървене и перфорация, които могат да бъдат фатални (вижте точка 4.2).

Следователно е необходимо подходящо клинично проследяване.

Кардиоваскуларни и цереброваскуларни реакции

Необходимо е да се осигури подходящо наблюдение и съвет за пациенти с анамнеза за хипертония и/или лека до умерена конгестивна сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за отоци и задръжка на течности, свързани с лечението на НСПВС.



Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на някои НСПВС (особено във високи дози и при продължително приложение) може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт). Няма достатъчно данни, за да се изключи такъв риск при Нимезулид.

Пациенти с неконтролирана хипертония, конгестивна сърдечна недостатъчност, установена исхемична болест на сърцето, заболяване на периферните артерии и/или мозъчно-съдова болест трябва да се лекуват с нимезулид само след внимателно обмисляне. Такова мислене трябва да се прави преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови събития (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене).

Тъй като нимезулид може да повлияе функцията на тромбоцитите, той трябва да се използва внимателно при пациенти с хеморагична диатеза (вижте точка 4.3). Но нимезулид не е заместител на ацетилсалициловата киселина за сърдечно-съдовата профилактика.

Бъбречни реакции

При пациенти с бъбречно или сърдечно увреждане се изисква особено внимание, тъй като в резултат на употреба на нимезулид може да се наблюдава влошаване на бъбречната функция. В случай на влошаване лечението трябва да бъде преустановено (вижте точка 4.5).

Кожни реакции

Много рядко се съобщава за сериозни кожни реакции, някои от тях фатални, като ексфолиращ дерматит, синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза, свързани с използването на НСПВС (вижте точка 4.8). По-висок риск от тези реакции се наблюдава в началото на терапията, като в повечето случаи реакцията се проявява в рамките на първия месец от лечението. Приемът на НЕОЛИН следва да се преустанови при първата поява на кожен обрив, рани по лигавицата или други признаци на свръхчувствителност.

Репродуктивни функции

Употребата на нимезулид може да увреди репродуктивната функция при жени и не се препоръчва при жени, които се опитват да заченат. При жени, изпитващи трудности при зачеване или подложени на следване за безплодие, се препоръчва прекъсване на употребата на НЕОЛИН (вижте точка 4.6).

НЕОЛИН съдържа захароза и следователно пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или суфраза-изоматазна недостатъчност не трябва да приемат това лекарство.



4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Фармакодинамични взаимодействия

Други нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС):

Комбинация на НЕОЛИН (вижте точка 4.4) с други нестероиди противовъзпалителни лекарства, включително ацетилсалицилова киселина, предписани в противовъзпалителни дози (≥ 1 g като еднократен прием или ≥ 3 g като дневна доза) не се препоръчва.

Кортикостероиди:

Повишен риск от стомашно-чревно кървене или образуване на язви (вижте точка 4.4).

Антикоагуланти:

НСПВС може да засилят ефекта на антикоагулантите, като варфарин (вижте точка 4.4). Пациентите третирани с варфарин, или подобни антикоагуланти, са изложени на повишен риск от усложнения с кървене при употреба на НЕОЛИН. Затова тази комбинация не се препоръчва (вижте точка 4.4) и е противопоказна при пациенти с остри смущения в кръвосъсирването (вижте точка 4.3). Ако комбинацията не може да бъде избегната, антикоагулантната дейност трябва да бъде следена отблизо.

Антитромбоцитни агенти и селективни инхибитори на обратния захват на серотонина (SSRI):

Повишен риск от стомашно-чревно кървене (вижте точка 4.4).

Диуретици, инхибитори на ангиотензин конвертиращия ензим (АЦЕ инхибитори и ангиотензин II антагонисти (АIIА)):

НСПВС може да намалят ефикасността на диуретиците и на други лекарства за контрол на кръвното налягане. При някои пациенти с намалена бъбречна функция (напр. дехидратирани пациенти или хора в старческа възраст с нарушена бъбречна функция), едновременният прием на АЦЕ инхибитор и инхибитори на цикло-оксигената могат да доведат до прогресиращо влошаване на бъбречната функция, включително до вероятност от остра бъбречна недостатъчност, която обикновено е обратима.

Появата на тези взаимодействия следва да се има предвид при пациенти, които трябва да приемат НЕОЛИН заедно с АЦЕ инхибитори или АIIА. Ето защо тази комбинация от лекарствени продукти трябва да се дава предпазливо, особено на пациенти в напреднала възраст. Пациентите следва да бъдат добре хидратирани и да се анализира необходимостта от проследяване на бъбречната функция при започване на съответната терапия и периодически след това.

Фармакокинетични взаимодействия: влияние на нимезулид върху фармакокинетиката на други лекарствени продукти

Фуроземид:



При здрави индивиди нимезулид намалява ефекта на Фуросемид върху отделянето на натрий, в по-малка степен, върху отделянето на калий и редуцира диуретичния ефект. В резултат на едновременното приемане на нимезулид и Фуросемид се наблюдава намаляване (с около 20%) на AUC, както и до кумулативното отделяне на Фуросемид, без да се повлияе неговия бъбречен клирънс.

Едновременната употреба на Фуросемид и нимезулид изисква внимание при пациенти, предразположени към бъбречни и сърдечни смущения, описани в точка 4.4.

Литий:

Установено е, че НСПВС намаляват отделянето на литий, в резултат на което се повишават плазмените нива и токсичността му. Ако нимезулид се предпише на пациент, подложен на литиева терапия, концентрацията на литий трябва редовно да се проследява. Потенциалните фармакокинетични взаимодействия с глибенкламид, теофилин, варфарин, дигоксин, циметидин и антиацидни средства (напр. комбинация на алуминиев с магнезиев хидроксид) също са изследвани *in vivo*. Не са наблюдавани никакви взаимодействия с клинично значение.

Нимезулид инхибира CYP2C9. Плазмените концентрации на лекарства, които са субстрати на този ензим, могат да се увеличат при едновременната употреба с нимезулид. Трябва да се обърне специално внимание ако нимезулид е използван по-малко от 24 часа преди или след лечение с метотрексат, защото серумното ниво на метотрексат може да се увеличи, а следователно и токсичността на лекарството също може да нарасне.

Заради ефекта си върху бъбречните простагландини, инхибиторите на простагландиновата синтеза, като НЕОЛИН, могат да увеличат нефротоксичността на циклоспорините.

Фармакокинетични взаимодействия: влияние на други лекарствени продукти върху фармакокинетиката на НЕОЛИН

Изследвания *in vitro* показват изместване на нимезулид от местата на свързване от страна на толбутамид, салицилова киселина и валпроева киселина. Но въпреки възможния ефект върху плазмените нива, тези взаимодействия не са с доказано клинично значение.

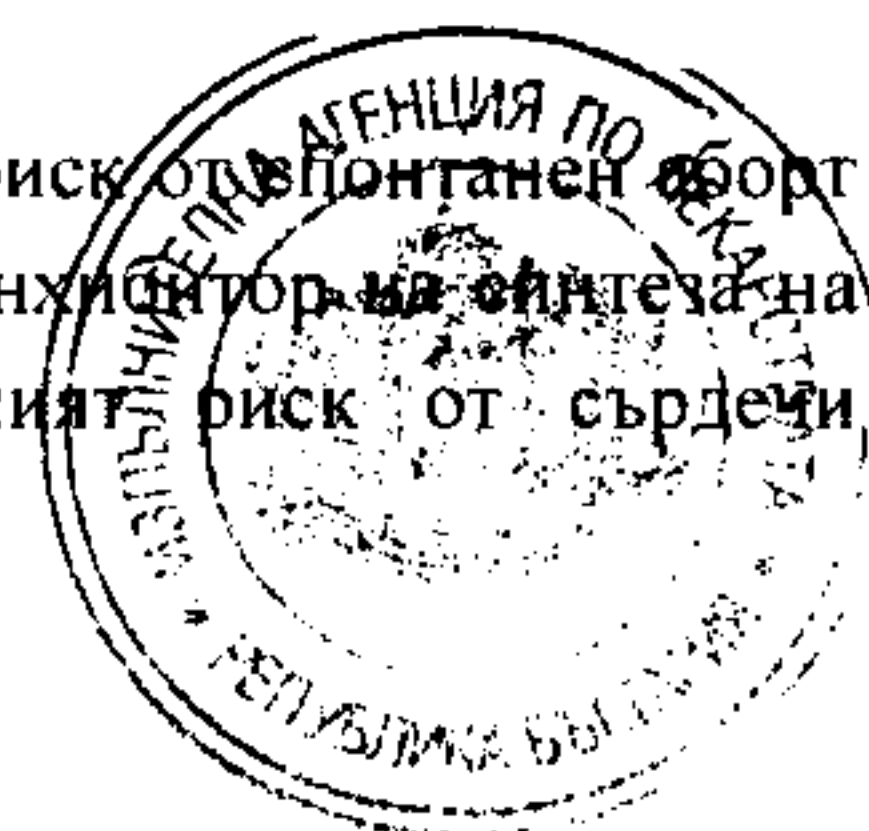
4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Употребата на НЕОЛИН е противопоказна през третото тримесечие на бременността (вижте точка 4.3).

Подобно на останалите НСПВС, НЕОЛИН не бива да се приема от жени, опитващи се да забременеят (вижте точка 4.4).

Възпрепятстването на синтеза на простагландин може да има негативен ефект върху бременността и/или развитието на плода.

Резултатите от епидемиологични изследвания показват повишен риск от спонтанен аборт и от сърдечна малформация и гастрошизис след използване на инхибитор на синтеза на простагландин в началния стадий на бременност. Абсолютният риск от сърдечни



малформации се повишава от <1% до около 1,5%. Счита се, че рискът се увеличава с увеличаване на дозата и продължителността на терапията.

При животните приемането на инхибитори на синтеза на простагландин провокира повишаване на пред- и следимплантационната загуба и смъртност на плода.

Освен това се съобщава и за увеличен брой случаи на различни малформации, включително сърдечно-съдови, при животни, на които в периода на органогенеза са приложени инхибитори на синтеза за простагландин.

Изследванията на зайци показват атипична репродуктивна токсичност (вижте точка 5.3), но няма на пазположение достатъчно данни за употребата на НЕОЛИН, от бременни жени. Така че потенциалният риск за хора не е установен с точност, затова не се препоръва предписването на лекарството през първите две тримесечия на бременността, освен в случаите, когато е абсолютно необходимо.

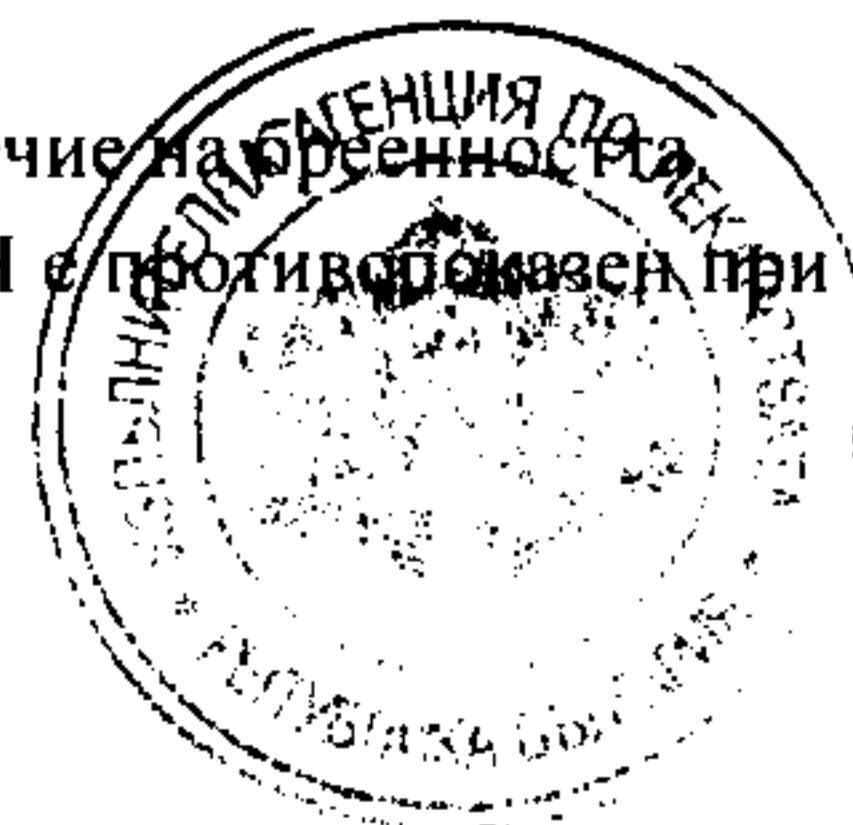
От 20-та гестационна седмица на бременността, нататък употребата на НЕОЛИН може да причини олигохидрамнион в резултат от бъбречна дисфункция на плода. Това може да възникне непосредствено след започване на лечението и обикновено е обратно след прекратяването му. Има съобщения за стесняване на ductus arteriosus след лечение през втория триместър, повечето от които отминават след прекратяване на лечението. По време на първия и втория триместър на бременността, НЕОЛИН не трябва да се прилага, освен ако не е абсолютно необходимо.

Ако НЕОЛИН се използва от жена, която се опитва да зачене или по време на първото и второто тримесечие на бременността, дозата и продължителността на лечение следва да бъдат възможно най-малки. Трябва да се обмисли антенатално наблюдение за олигохидрамнион и за стесняване на ductus arteriosus след прием на НЕОЛИН в продължение на няколко дни след 20-та гестационна седмица. Трябва да се прекрати приема на НЕОЛИН, ако се установи олигохидрамнион или стесняване на ductus arteriosus.

През третото тримесечие на бременността, всички инхибитори на синтеза на простагландин могат да изложат:

- плодът на риск от:
 - сърдечно-белодробна токсичност (с преждевременно затваряне на Боталовия канал и белодробна хипертензия);
 - бъбречна дисфункция, която може да прогресира до бъбречна недостатъчност с олигохидрамнион (недостатъчно количество околоплодни води);
- майката и новороденото, в края на бременността, на риск от:
 - възможно удължаване на времето на кървене и антитромбоцитен ефект, който може да се прояви дори и при много ниски дози;
 - потискане на маточните контракции, което води до забавяне или удължаване на родилния процес.

Ето защо Нимезулид е противопоказан по време на третото тримесечие на бременността. Няма данни дали НЕОЛИН се отделя в майчиното мляко. НЕОЛИН е противопоказан при кърмене (вижте точки 4.3 и 5.3).



4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са проведени изследвания относно ефекта на НЕОЛИН върху способността за шофиране и работа с машини. Но пациенти, при които се наблюдава замаяност, виене на свят или сънливост след употреба на НЕОЛИН трябва да се въздържат от шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

а) Общо описание

Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на някои НСПВС (особено във високи дози и при продължително приложение) може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт) (вижте точка 4.4).

Има съобщения за едем, хипертензия и сърдечна недостатъчност във връзка с приложение на НСПВС.

Докладвани са много редки случаи на кожни реакции, включително синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза.

Най-често наблюдаваните нежелани лекарствени реакции са гастроинтестинални по характер. Може да се появи пептична язва, перфорация или гастроинтестинално кървене, понякога фатални, предимно при пациенти в напреднала възраст (вижте точка 4.4).

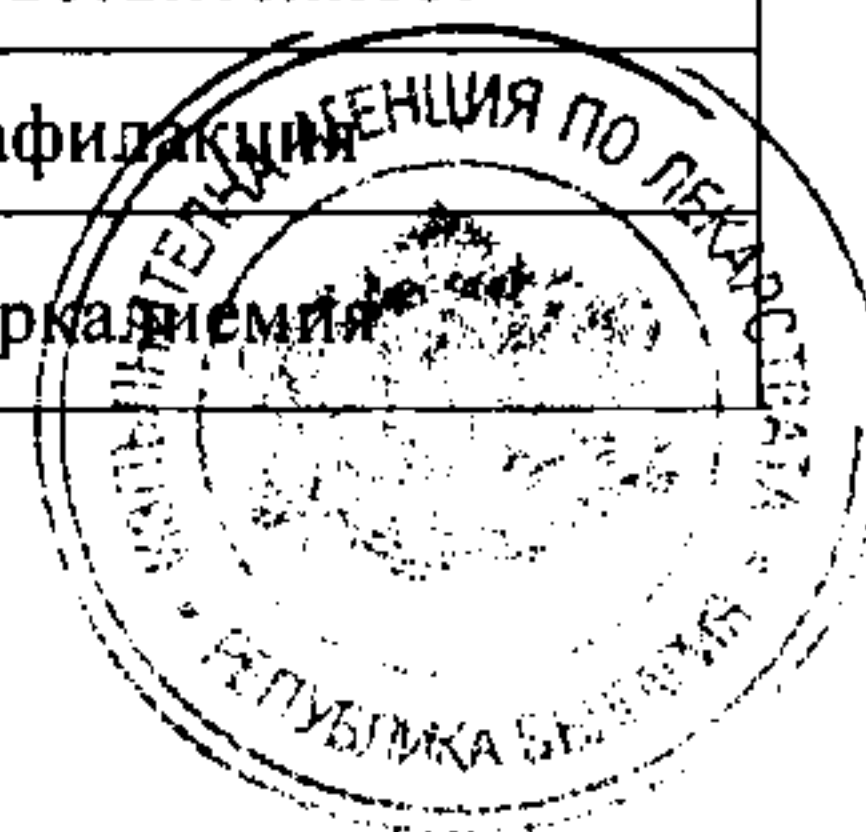
Съобщава се за улцеративен стоматит, гадене, повръщане, коремна болка, мелена, диария, флатуленция, констипация, диспепсия, хематемеза, екзацербация на колит и болест на Крон след прием (вижте точка 4.4). По-рядко се наблюдава гастрит.

б) Таблица на нежелани лекарствени реакции

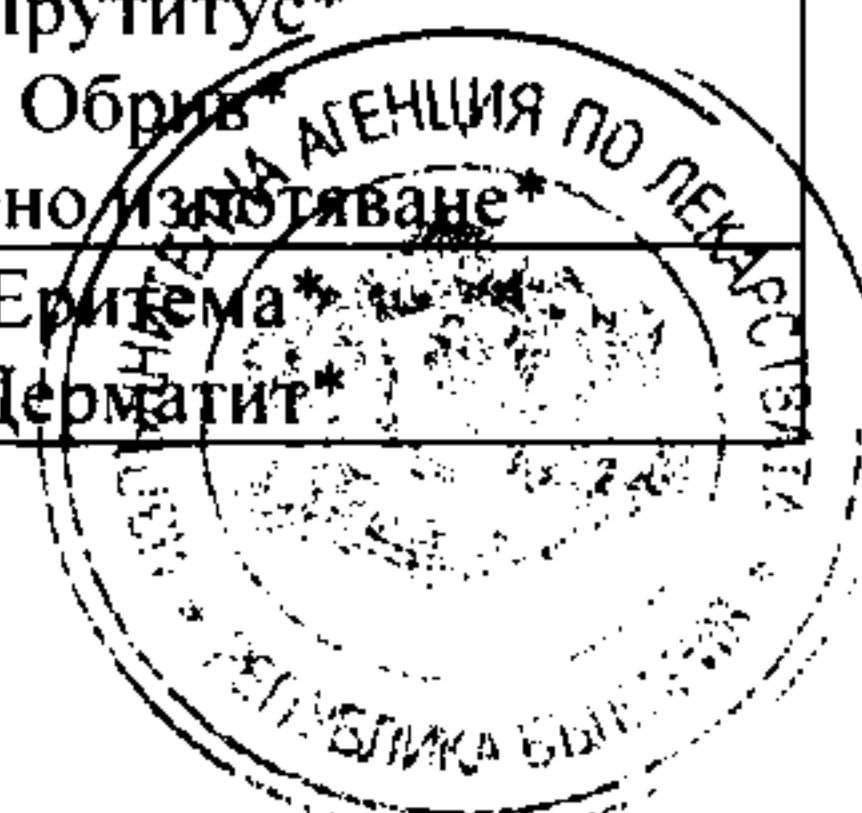
Настоящият списък с нежелани лекарствени реакции се базира на данни от контролирани клинични проучвания (приблизително на 7800 пациента), както и от пост-маркетингово проучване, като получените резултати са класифицирани по следния начин:

Много чести ($\geq 1/10$); Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); Нечести ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$); Редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1000$); Много редки ($\leq 1/10\,000$); Неизвестна честота (не може да бъде установена от наличните данни).

Нарушения на кръвта	Редки	Анемия* Азофилия*
	Много редки	Тромбоцитопения Панцитопения Пурпура
Нарушения на имунната система	Редки	Свръхчувствителност*
	Много редки	Анафилактични реакции*
Нарушения на метаболизма и	Редки	Хиперкалемия*



храненето		
Психични нарушения	Редки	Безпокойство* Изнервеност* Кошмари*
Нарушения на нервната система	Нечести	Замаяност*
	Много редки	Главоболие Сънливост Енцефалопатия (Синдром на Рей)
Нарушения на очите	Редки	Замъглено зрение*
	Много редки	Нарушено зрение
Нарушения на ухото и лабиринта	Много редки	Виене на свят
Сърдечни нарушения	Редки	Тахикардия*
Съдови нарушения	Нечести	Хипертензия*
	Редки	Кръвоизлив* Нестабилност на кръвното налягане* Горещи вълни*
Редпираторни нарушения	Нечести	Диспнея*
	Много редки	Астма Бронхоспазм
Стомашно-чревни нарушения	Чести	Диария* Гадене* Повръщане*
	Нечести	Запек* Флатуленция* Гастро-интестинално кървене Дуоденална язва и перфорация Стомашна язва и перфорация
	Много редки	Коремни болки Гастрит* Диспепсия Стоматит Мелена
Хепатобилиарни нарушения (вижте точка 4.4)	Чести	Повишени чернодробни ензими*
	Много редки	Хепатит Фулминантен хепатит (вкл. смъртни случаи) Жълтеница Холестаза
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	Нечести	Пруритус* Обрив* Засилено изпотяване*
	Редки	Еритема* Дерматит*



	Много редки	Уртикария Ангioneвротичен оток Лицев оток Мултиформена еритема Синдром на Stevens-Johnson Токсична епидермална некролиза
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	Редки	Дизурия* Хематурия*
	Много редки	Бъбречна недостатъчност Задръжка на урина* Олигурия Интерстициален нефрит
Общи нарушения	Нечести	Едема*
	Редки	Физическо неразположение* Обща физическа отпадналост*
	Много редки	Хипотермия

* честота, базирана на клиничните проучвания

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване до:

Изпълнителната агенция по лекарствата

ул. "Дамян Груев" № 8

1303 София

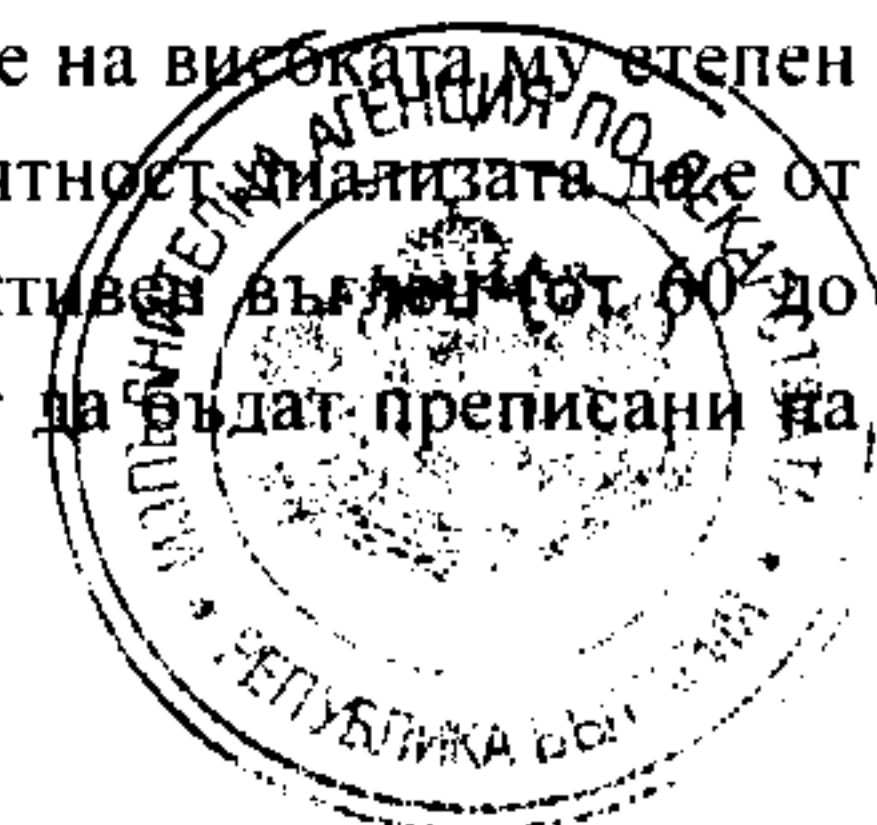
тел.: +359 28903417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Симптомите след остро предозиране с НСПВС обикновено се свеждат до летаргия, замаяност, гадене, повръщане, болка в епигастриума, които по принцип са обратими след медицинска помощ. Може да се наблюдава гастроинтестинално кървене. Известни са случаи на хипертензия, остра бъбречна недостатъчност, респираторна депресия и кома, но те са много рядко срещани. Установени са и анафилактични реакции след терапевтичен прием на нестероидни противовъзпалителни средства, като те могат да се наблюдават след предозиране.

След предозиране с НСПВС, на пациентите трябва да им бъде оказана симптоматична и медицинска помощ. Няма специфични антидоти. Не съществува информация, относно отстраняването на Нимезулид чрез хемодиализа, но основавайки се на високата му степен на свързване с плазмените протеини (до 97.5%), няма голяма вероятност анализата да е от полза при предозиране. Предизвикването на повръщане и/или активен въглехидрат (от 60 до 100 g при възрастни) и/или осмотични слабители средства могат да бъдат препоръчани на



пациенти до 4 часа след поглъщането, при което се наблюдават съответните симптоми или които са поели голяма свръхдоза. Засилената диуреза, алкализирането на урината, хемодиализата или хемоперфузията могат да се окажат безполезни поради високото протеиново свързване. Бъбречната и чернодробната функция трябва да бъдат наблюдавани отблизо.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Други противовъзпалителни и антиревматични лекарства, нестероидни. АТС код: **M01AX17**

Механизъм на действие

Нимезулид е нестероидно противовъзпалително средство /НСПВС/ с аналгетични и антипиретични свойства, което действа като инхибитор на ензима на простагландиновата синтеза- циклооксигеназа.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

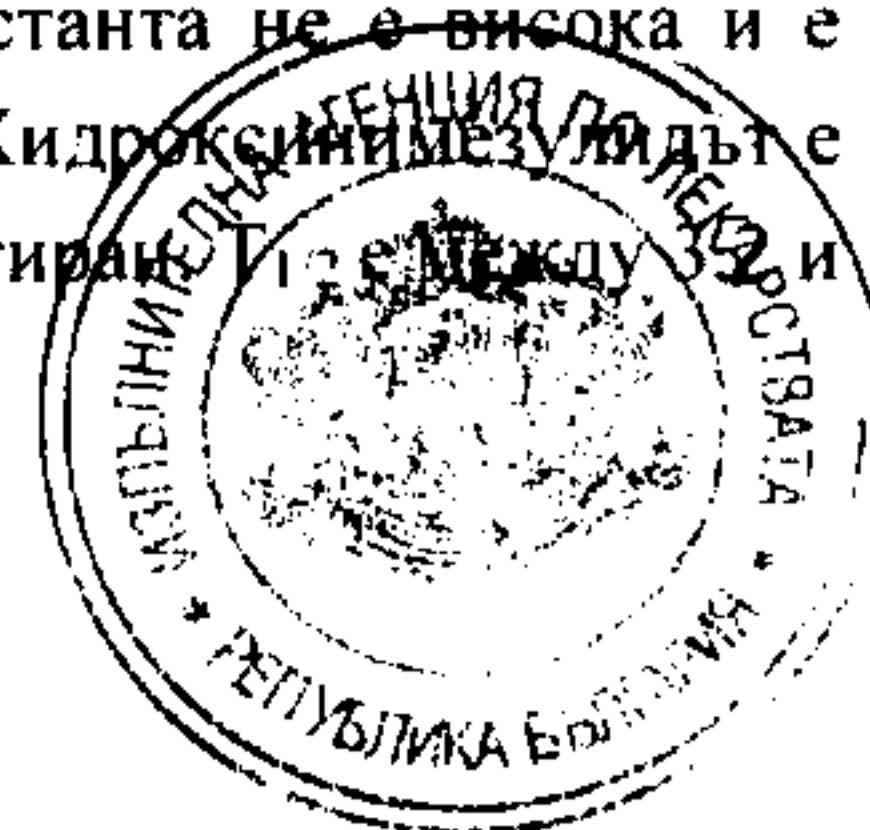
Нимезулид се абсорбира добре, приеман перорално. След единична доза от 100 mg Нимезулид при възрастни се постига върхово плазмено ниво от 3-4 ml/l след 2-3 часа, AUC=20-35 mg h/l. Не е наблюдавана никаква статистически значима разлика между посочените резултати и тези след 100 mg, приемани 2 пъти дневно в продължение на 7 дни.

Разпределение

Свързване до 97.5% с плазмени протеини.

Биотрансформация

Нимезулид се метаболизира екстензивно в черния дроб, следвайки многобройни пътеки, вкл. Цитохром P450 (CYP) 2C9 изоензими. Така че има потенциална възможност за взаимодействие на лекарството при едновременната употреба на лекарства, които се метаболизират чрез CYP2C9 (вижте точка 4.5). Основният метаболит е парахидроксидериват, който също е фармакологично активен. Времето до появата на този метаболит в циркулацията е кратко (около 0.8 час), но формиращата му константа не е висока и е значително по-ниска от абсорбиращата константа на Нимезулид. Хидроксинимезулидът е единственият метаболит, открит в плазмата и е почти изцяло конюгиран. Т1/2 е между 3 и 6 часа.



Елиминиране

Нимезулид се екскретира главно в урината (средно 50% от приетата доза). Само 1-3% се изхвърля в непроменена форма. Хидроксинимезулид, основен метаболит, се открива само глюкуронат. Около 29% от дозата се елиминира, след метаболизиране във фекалиите.

Кинетичната картина на Нимезулид остава непроменена при по-възрастни пациенти след прилагане на интензивни и неколkokратни дози.

В интензивно експериментално изследване, проведено при пациенти с леки до умерени бъбречни увреждания (креатининов клирънс 30-80 ml/min), сравнени със здрави доброволци, върховните плазмени нива на Нимезулид и на основния метаболит не са по-високи при пациенти с увреждания, отколкото при здравите доброволци. AUC и $t_{1/2}$ β са 50% по-високи, но винаги в рамките на кинетичните стойности, наблюдавани при Нимезулид в здрави участници.

Повторното приемане не води до кумулиране.

Нимезулид е противопоказан при пациенти с чернодробна недостатъчност (вижте точка 4.3).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Въз основа на конвекционалните изпитвания за фармакологична безопасност, токсичност след многократни дози, генотоксичност и карциногенен потенциал, предклиничните данни не показват никакъв риск за човека. При изследванията за токсичност след многократни дози, Нимезулид показва гастроинтестинална, бъбречна и чернодробна токсичност.

При изследванията за репродуктивна токсичност са наблюдавани ембриотоксични и тератогенни ефекти при зайци, но не и при плъхове, на дози с нетоксично за майката ниво. При плъховете се наблюдава увеличена смъртност на новородените в ранния следродилен период, а Нимезулид оказва отрицателен ефект върху плодовитостта.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Захароза
Лимонена киселина,
Малтодекстрин
Макроголцетостеарилов етер
Аромат портокал

6.2 Несъвместимости



Не са известни.

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.

Съхранявайте лекарствения продукт в оригиналната опаковка.

Да се използва незабавно след отваряне.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

НЕОЛИН 100 mg гранули за перорална суспензия в саше.

Всяка картонена кутия съдържа 10,20 или 30 сашета, заедно с листовка за пациента.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Фортекс Нутрасютикалс ООД

ул. Прохладен кът № 10

1362 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рег. №

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА



04/2024

