

AULIN GEL

nimesulid

SLOŽENÍ

Přípravek AULIN gel obsahuje 3% nimesulidu, tj. 1 g gelu obsahuje 30 mg nimesulidu.

MECHANISMUS ÚČINKU

Nimesulid je zástupcem nesteroidních antiflogistik (NSA). Vzhledem ke své relativně vyšší afinitě k cyklooxygenáze 2 v porovnání s klasickými NSA je řazen mezi preferenční inhibitory COX-2, a vykazuje tedy účinky protizánětlivé, analgetické a antipyretické. Kromě inhibice tohoto enzymu nimesulidem na periférii předchází bradykininem či cytokiny navozené hyperalgezií pomocí inhibice uvolňování TNF- α .

Nimesulid inhibicí fosfodiesterázy IV a proteinkinázy C omezuje tvorbu volných kyslíkových radikálů stimulovanými polymorfonukleáry. Ovlivněním inhibitoru plazmatické α_1 -proteinázy snižuje aktivitu proteolytických enzymů (kolagenáz, elastáz). Zabraňuje tvorbě metaloproteáz, které se podílejí na destrukci chrupavky např. při osteoartróze. Nimesulid rovněž vykazuje přímý scavengerový účinek na již vytvořené silné oxidanty. Snižováním intracelulární koncentrace cAMP v neutrofilech působí inhibicí PAF a leukotrienu B_4 a dále inhibuje chemotaxi a tlumí tvorbu leukotrienu C_4 v aktivovaných eosinofilech. V žírných buňkách a bazofilech zabraňuje uvolňování histaminu. Současně byla prokázána také inhibice apoptózy chondrocytů a možné ovlivnění glukokortikoidních receptorů.¹

V preklinických studiích u myši byl při tlumení zánětu vyvolaného podáním karageninu nimesulid gel srovnatelně účinný jako gel diklofenaku, avšak ve formalinovém testu vykazoval vyšší účinnost. Účinnější byl rovněž v modelu adjuvantní artritidy, a to v porovnání s diklofenakem i piroxikamem.²

FARMAKOKINETICKÉ VLASTNOSTI

Při lokálním podání je plazmatická koncentrace nimesulidu velmi nízká. Po jednorázové aplikaci 200 mg nimesulidu ve formě gelu bylo dosaženo maximální plazmatické koncentrace 9,77 ng/ml za 24 hodin (v ustáleném stavu jde o $37,25 \pm 13,25$ ng/ml), přičemž hlavní známý metabolit, 4-hydroxy-nimesulid, není vůbec detekován. Nimesulid však výborně proniká do synoviálního prostoru.³

KLINICKÉ ZKUŠENOSTI

Nimesulid u zdravých dobrovolníků aplikovaný na předloktí byl ve dvojité zaslepené studii účinnější než diklofenak či piroxikam.⁴

V jiné studii s obdobným designem u nemocných s osteoartrózou kolena (n = 74) vedla léčba již 1% nimesulidem 3x denně po dobu 30 dnů oproti placebo k významnému zlepšení indexu WOMAC (Western Ontario a McMaster universties osteoarthritis Index) (p = 0,03). Jak nemocní, tak i lékaři jako účinnější léčbu označili shodně verum.⁵

INDIKACE

Přípravek je určen k symptomatické léčbě bolesti při podvrtnutí nebo u akutní traumatické tendinitidy.

KONTRAINDIKACE

Přípravek je kontraindikován při známé přecitlivělosti na nimesulid, kyselinu acetylsalicylovou či jiné NSA nebo v případě přecitlivělosti na některou z látek pomocných. Nesmí být aplikován na poraněnou kůži či oblast postiženou infekcí. Současně by neměl být nikdy podán s jinými lokálními přípravky. Nesmí být podán dětem do 12 let.

LÉKOVÉ INTERAKCE

Vzhledem k omezené systémové expozici je riziko lékových interakcí prakticky nulové – žádné dosud nebyly popsány.

TĚHOTENSTVÍ A LAKTACE

Podávání přípravku se během těhotenství a kojení nedoporučuje.

NEŽÁDOUCÍ ÚČINKY

Topické lékové formy NSA obecně představují přípravky s velmi příznivým bezpečnostním profilem. Obsažená účinná látka dobře penetruje přímo do postiženého místa a do systémové cirkulace se dostává pouze v minimálním množství, což je důvodem systémové bezpečnosti takové léčby.⁶ Obvykle se vyskytují jen lokální reakce přecitlivělosti, projevující se jako zarudnutí či svědění.

DÁVKOVÁNÍ

Přípravek je nanášen v tenké vrstvě (cca 3 g, což odpovídá 6–7 cm) na postižené místo 2–3x denně, obvykle po 1 až 2 týdny.

BALENÍ

Registrované velikosti balení: 15 g, 30 g, 50 g, 100 g.

VÝROBCE

Medicom International s.r.o.

Poznámka: Statut přípravku – léčivý přípravek, výdej není vázán na lékařský předpis. Není hrazen z prostředků zdravotního pojištění. Profil přípravku zpracován kolektivem autorů vedeným MUDr. Jiřím Slívou, Ph.D., s využitím odborné literatury a SPC podle poslední revize.

Literatura

- Doležal T, Slíva J. Nimesulidum. *Remedia* 2004;14:2–8.
- Gupta SK, Prakash J, Awor L, Joshi S, Velpandian T, Sengupta S. Anti-inflammatory activity of topical nimesulide gel in various experimental models. *Inflamm Res* 1996;45:590–592.
- Erdogan F, Ergun H, Gokay NS, Gulmez SE, Bolay B, Tulunay FC. The diffusion of nimesulide gel into synovial fluid: a comparison between administration routes. *Int J Clin Pharmacol Ther* 2006;44:270–275.
- Sengupta S, Velpandian T, Kabir SR, Gupta SK. Analgesic efficacy and pharmacokinetics of topical nimesulide gel in healthy human volunteers: double-blind comparison with piroxicam, diclofenac and placebo. *Eur J Clin Pharmacol* 1998;54:541–547.
- Ergun H, Kulcu D, Kutlay S, Bodur H, Tulunay FC. Efficacy and safety of topical nimesulide in the treatment of knee osteoarthritis. *J Clin Rheumatol* 2007;13:251–255.
- Radermacher J, Jentsch D, Scholl MA, Lustinetz T, Frolich JC. Diclofenac concentrations in synovial fluid and plasma after cutaneous application in inflammatory and degenerative joint disease. *Br J Clin Pharmacol* 1991;31:537–541.

