Зомиг



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "Z" на одной стороне.

	1 таб.
золмитриптан	2.5 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 100 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 3 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав оболочки: макрогол 8000 - 200 мкг, краситель желтый (OY-22906) - 3.1 мг.
Состав красителя: гипромеллоза - 1.923 мг, титана диоксид - 963 мкг, макрогол 400 - 192 мкг, краситель железа оксид желтый (E172) - 22 мкг.

2 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
3 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный агонист $5HT_1$-рецепторов, противомигренозный препарат.

Обладает высоким сродством по отношению к $5HT_{1B/1D}$-рецепторам и умеренной аффинностью к $5HT_{1A}$-рецепторам. Золмитриптан не проявляет существенной фармакологической активности по отношению к $5HT_2$-, $5HT_3$-, $5HT_4$-рецепторам, α_1-, α_2-, β_1-адренорецепторам, гистаминовым H_1-, H_2-рецепторам, мускариновым рецепторам, допаминовым рецепторам типа 1 и 2. Кровеносные сосуды и сосуды твердой мозговой оболочки иннервируются афферентными волокнами тройничного нерва. В экспериментах на животных введение золмитриптана вызывает, благодаря его свойствам агониста $5HT_{1B/1D}$-рецепторов сосудов, вазоконстрикцию, ассоциированную с подавлением высвобождения пептида, связанного с геном кальцитонина, вазоактивного интестинального пептида и субстанции Р. Сужение сосудов и ингибирование высвобождения нейропептидов, как предполагается, являются причиной улучшения состояния при приступе мигрени, в частности, снижения интенсивности боли не позднее чем через 1 ч после приема препарата и уменьшения тошноты, рвоты, фотофобии и фонофобии, связанных с мигренью.

В дополнение к периферическому действию золмитриптан обладает действием на ядра ствола головного мозга, вовлеченные в механизм развития приступов мигрени, что объясняет устойчивый эффект повторного применения при лечении нескольких приступов мигрени у одного пациента. При приступе мигрени отмечается вазодилатация благодаря активации рефлекторного возбуждения, поддерживаемого ортодромными волокнами тройничного нерва и парасимпатической иннервацией сосудов головного мозга через высвобождение вазоактивного интестинального пептида, как основного эффекторного нейромедиатора. Золмитриптан блокирует это рефлекторное возбуждение и высвобождение вазоактивного интестинального пептида.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь золмитриптан быстро и хорошо абсорбируется (как минимум на 64%).

75% C_{max} достигается в течение 1 ч; определяемая концентрация в плазме сохраняется в течение последующих 4-6 ч. Абсорбция золмитриптана не зависит от приема пищи.

При приеме разовой дозы золмитриптан и его активный метаболит имеют пропорционально зависимые от дозы AUC и C_{max} в диапазоне доз от 2.5 до 50 мг.

Средняя абсолютная биодоступность - приблизительно 40%.

При многократном приеме кумуляции препарата не наблюдалось.

Распределение

Связывание с белками плазмы низкое (приблизительно 25%).

Метаболизм

Метаболизируется в печени с образованием 3 основных метаболитов: индол-уксусной кислоты (основной метаболит в плазме и моче), N-оксида и N-десметил аналогов. N-десметилированный метаболит (183C91) является активным, а два других метаболита неактивны. N-десметил-метаболит (183C91) обладает в 2-6 раз большей активностью агониста $5HT_{1D}$-рецепторов, чем золмитриптан (по данным экспериментов на животных). Концентрация N-десметил-метаболита (183C91) в плазме составляет приблизительно половину от концентрации золмитриптана, и, следовательно, можно предположить, что этот метаболит вносит свой вклад в терапевтическое действие Зомига.

Выведение

Более 60% препарата, введенного в виде разовой пероральной дозы, выводится с мочой (преимущественно в виде индол-уксусного метаболита), и около 30% выделяется с фекалиями, преимущественно в неизмененном виде.

Средний $T_{1/2}$ золмитриптана 4.7 ч. $T_{1/2}$ его метаболитов примерно такой же, что предполагает выведение по мере их образования.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести почечный клиренс золмитриптана и его метаболитов в 7-8 раз ниже по сравнению со здоровыми добровольцами, хотя AUC золмитриптана и активного метаболита несколько увеличивается (на 16% и 35% соответственно), а $T_{1/2}$ увеличивается на 1 ч (до 3-3.5 ч).

При оценке фармакокинетики золмитриптана при заболеваниях печени разной степени тяжести было показано увеличение AUC на 94% и C_{max} на 50% при умеренных нарушениях функции печени, и соответственно на 226% и 47% при тяжелых нарушениях функции печени по сравнению со здоровыми добровольцами. Образование метаболитов (в т.ч. активного) при заболеваниях печени уменьшается. Для метаболита 183C91 значение AUC и C_{max} уменьшается на 33% и 44% в группе пациентов с умеренными нарушениями функции печени и на 82% и 90% у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени.

$T_{1/2}$ золмитриптана в группе пациентов с умеренными нарушениями функции печени составил 7.3 ч, у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени - 12 ч. $T_{1/2}$ метаболитов соответственно составил 5.7 ч, 7.5 ч и 7.8 ч.

Не отмечалось фармакокинетического взаимодействия с эрготамином.

Фармакокинетика золмитриптана у здоровых пожилых людей сходна с фармакокинетикой у здоровых молодых людей.

Одновременное введение золмитриптана с эрготамином/кофеином переносилось хорошо и не приводило к возрастанию частоты неблагоприятных реакций или изменениям АД по сравнению с введением только золмитриптана.

Селегилин (ингибитор МАО тип В) и флуоксетин (селективный ингибитор обратного захвата серотонина) не оказывают влияния на фармакокинетические параметры золмитриптана.

Показания к применению:

— купирование приступов мигрени с аурой или без ауры.

Относится к болезням:

- Мигрень

Противопоказания:

— неконтролируемая артериальная гипертензия;

— ИБС;

— ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала);

— нарушения мозгового кровообращения или транзиторные ишемические атаки в анамнезе;

— совместное применение с эрготамином или его производными или другими агонистами $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов;

— синдром WPW или аритмии, ассоциированные с другими дополнительными путями проведения импульса;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* назначают препарат пациентам пожилого возраста (безопасность и эффективность применения Зомига у лиц старше 65 лет не изучались).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза для *купирования приступа мигрени* - 2.5 мг.

Если симптомы сохраняются или вновь возникают в течение 24 ч, может потребоваться прием повторной дозы Зомига. При этом повторную дозу не следует принимать в течение 2 ч после первой дозы. Если после применения Зомига в дозе 2.5 мг терапевтический эффект не достигнут, для купирования последующих приступов мигрени можно применять препарат в дозе 5 мг.

Клинически значимый эффект проявляется в течение 1 ч после приема Зомига.

Эффективность препарата не зависит от того, через какое время после начала приступа была принята таблетка, однако рекомендуется принимать Зомиг как можно раньше с момента начала мигренозной головной боли.

При возникновении повторных приступов мигрени общая доза Зомига, принятая в течение 24 ч, не должна превышать 10 мг.

Пациентам с легкими и умеренными нарушениями функции печени коррекции дозы не требуется, при **тяжелых нарушениях функции печени** рекомендуемая максимальная доза препарата, принятая в течение 24 ч, составляет 5 мг.

Пациентам с нарушениями функции почек не требуется коррекция режима дозирования Зомига.

Побочное действие:

При описании побочных явлений использовались следующие критерии частоты встречаемости: часто - ≥1%, но <10%; редко - ≥0.01%, но <0.1%; очень редко - <0.01%.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - нарушения чувствительности, астения, головокружение, ощущение тяжести и скованности в конечностях, стеснение в глотке, шее, и в грудной области (не сопровождающиеся ишемическими изменениями на ЭКГ), парестезии, сонливость, ощущение тепла; редко - головная боль.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, сухость во рту; очень редко - боль в животе, геморрагическая диарея, ишемический колит, инфаркт селезенки, ишемия или инфаркт кишечника.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - миалгия, мышечная слабость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - тахикардия, сердцебиение; очень редко - стенокардия, спазм коронарных сосудов, инфаркт миокарда, транзиторная артериальная гипертензия (очень редко сопровождающаяся клинически значимыми симптомами).

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - полиурия, частое мочеиспускание.

Аллергические реакции: редко - анафилактические реакции, ангионевротический отек, крапивница.

Зомиг, как правило, хорошо переносится. Неблагоприятные реакции выражены легко или умеренно, носят транзиторный характер и разрешаются спонтанно без лечения.

Возможные неблагоприятные реакции чаще возникают в течение 4 ч после приема препарата и не учащаются с приемом повторных доз.

Передозировка:

Симптомы: при однократном приеме Зомига в дозе 50 мг внутрь обычно отмечался седативный эффект.

Лечение: контроль состояния пациентов должен продолжаться как минимум в течение 15 ч ($T_{1/2}$ золмитриптана - 2.5-3 ч), или пока сохраняются симптомы передозировки. Специфического антидота нет. При выраженной интоксикации рекомендуются мероприятия интенсивной терапии, включая ИВЛ, а также контроль и поддержание функции сердечно-сосудистой системы. Неизвестно, какой эффект на концентрацию золмитриптана в сыворотке оказывают гемодиализ и перитонеальный диализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Клинических исследований применения препарата при беременности не проводилось. Применение Зомига при беременности возможно только в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

В *экспериментальных исследованиях* на лабораторных животных тератогенное действия золмитриптана не выявлено.

С осторожностью следует решать вопрос о возможности назначения Зомига в период лактации (грудного вскармливания).

В *экспериментальных исследованиях* установлено, что золмитриптан выделяется с молоком лактирующих животных. Данных о выделении золмитриптана с грудным молоком у людей нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нет данных, подтверждающих, что сопутствующий прием препаратов для профилактики мигрени (бета-адреноблокаторы, дигидроэрготамин, пизотифен) оказывает какое-либо действие на эффективность или нежелательные эффекты Зомига.

Фармакокинетические параметры и переносимость Зомига не изменялись при сочетанном применении с парацетамолом, метоклопрамидом и эрготамином.

В ходе исследований у здоровых добровольцев показано отсутствие клинически значимого взаимодействия между Зомигом и эрготамином, однако увеличение риска развития коронарного вазоспазма теоретически возможно. В связи с этим рекомендуется соблюдать интервал (минимум 24 ч) между отменой эрготаминосодержащих препаратов и назначением Зомига. После отмены Зомига следует назначать эрготаминосодержащие препараты не ранее, чем через 6 ч.

Сопутствующий прием других агонистов $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов в течение 12 ч после приема Зомига должен быть исключен.

После введения моклобемида (ингибитор МАО типа А) отмечалось небольшое увеличение (на 26%) AUC золмитриптана и трехкратное увеличение AUC его активного метаболита. Поэтому максимальная рекомендуемая доза Зомига, принятая в течение 24 ч, для пациентов, получающих одновременно ингибиторы МАО типа А, не должна превышать 5 мг.

После приема циметидина (ингибитора ферментов цитохрома Р450) отмечалось увеличение $T_{1/2}$ золмитриптана на 44% и увеличение AUC на 48%. $T_{1/2}$ и AUC активного N-деметилированного метаболита увеличивался вдвое, в связи с чем для пациентов, принимающих циметидин, рекомендуемая максимальная доза препарата Зомиг, принятая в течение 24 ч, составляет 5 мг.

Основываясь на общем профиле взаимодействия золмитриптана, нельзя исключить возможности его взаимодействия с ингибиторами изофермента CYP1A2. Следовательно, при совместном применении препаратов такого типа (флувоксамин и антибиотики хинолонового ряда) рекомендуется уменьшить общую дозу Зомига, принятую в течение 24 ч, до 5 мг.

После введения рифампицина не отмечалось клинически значимых изменений в фармакокинетике золмитриптана

или его активных метаболитов.

При совместном применении существует возможность взаимодействия с препаратами зверобоя (Hypericum perforatum), которое может увеличивать риск развития нежелательных эффектов (как и при применении с другими агонистами $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов).

Особые указания и меры предосторожности:

Зомиг не предназначен для профилактики приступов мигрени.

Зомиг обладает выраженным эффектом при мигрени с аурой и без ауры и при мигрени, ассоциированной с менструацией. На эффективность препарата не влияют пол и возраст пациента, продолжительность приступа, наличие тошноты перед приемом препарата и использование обычных препаратов для профилактики приступов мигрени.

Препарат следует применять только при установленном диагнозе. Перед применением препарата следует исключить другие возможные серьезные неврологические состояния.

В настоящее время нет данных о применении Зомига при гемиплегической или базилярной мигрени.

У пациентов с мигренью может быть повышен риск развития нарушений мозгового кровообращения. У пациентов, принимающих агонисты $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, отмечались геморрагический инсульт, субарахноидальный инсульт, ишемический инсульт и другие нарушения мозгового кровообращения.

Очень редко при применении данного класса препаратов (агонисты $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов) отмечались спазмы коронарных сосудов, стенокардия или развитие инфаркта миокарда. Пациентам с высокой степенью риска развития ИБС перед началом применения препарата рекомендуется провести обследование состояния сердечно-сосудистой системы. В очень редких случаях серьезные сердечно-сосудистые осложнения могут развиться у пациентов, не имевших указаний на заболевания сердечно-сосудистой системы в анамнезе.

При применении Зомига (как и других агонистов серотониновых $5HT_{1B/1D}$-рецепторов) сообщалось об атипичных ощущениях в области сердца. При возникновении болей в груди или симптомов ИБС следует прекратить прием золмитриптана до проведения соответствующего медицинского обследования.

Зомиг может вызывать легкое транзиторное повышение АД (как и других агонистов серотониновых $5HT_{1B/1D}$-рецепторов) независимо от наличия артериальной гипертензии в анамнезе; очень редко такое повышение АД было клинически выраженным.

При применении Зомига (как и других агонистов серотониновых $5HT_{1B/1D}$-рецепторов) редко отмечались анафилактические/анафилактоидные реакции.

Чрезмерное применение противомигренозных препаратов может приводить к увеличению частоты возникновения головной боли, что потенциально требует отмены лечения.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения Зомига у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не наблюдалось значительного ухудшения в выполнении психомоторных тестов при приеме Зомига в дозе до 20 мг. Маловероятно, что применение препарата приведет к ухудшению способности пациента заниматься потенциально опасными видами деятельности, но пациента следует предупредить о возможности развития сонливости.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек не требуется коррекция режима дозирования Зомига.

При нарушениях функции печени

Пациентам с легкими и умеренными нарушениями функции печени коррекции дозы не требуется, при **тяжелых нарушениях функции печени** рекомендуемая максимальная доза препарата, принятая в течение 24 ч, составляет 5 мг.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* назначают препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Безопасность и эффективность применения Зомига у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлена.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре ниже 30°C. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке или блистере.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Zomig