Зомиг Рапимелт



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, плоскоциллиндрические с фаской, с легким апельсиновым запахом и с маркировкой "Z" на одной стороне.

	1 таб.
золмитриптан	2.5 мг

Вспомогательные вещества: ароматизатор апельсиновый SN027512 0.4 мг, аспартам 5.0 мг, кремния диоксид коллоидный 0.3 мг, кросповидон 10.0 мг, лимонная кислота безводная 1.5 мг, магния стеарат 2.0 мг, маннитол 60.8 мг, натрия гидрокарбонат 2.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая 15.0 мг.

2 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Золмитриптан является селективным агонистом $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, стимуляция которых приводит к вазоконстрикции. Обладает высоким сродством к рекомбинантным $5HT_{1B/1D}$-серотониновым рецепторам человека и умеренным сродством к $5HT_{1A}$-серотоннновым рецепторам. Золмитриптан не обладает сродством и не проявляет существенной фармакологической активности по отношению, к $5HT_2$-, $5HT_3$-, $5HT_4$- серотониновым, адренергическим, гистаминовым, мускариновым и дофаминергическим рецепторам.

Введение золмитриптана лабораторным животным приводило к вазоконстрикции в бассейне сонной артерии. Кроме того, результаты исследований на лабораторных животных свидетельствуют о том, что золмитриптан блокирует центральную и периферическую, активность тройничного нерва за счет ингибирования высвобождения пептида, связанного с геном кальцитонина, вазоактивного интестинального пептида и субстанции Р.

В клинических исследованиях эффект золмитриптана в отношении головной боли и других симптомов мигрени (таких как тошнота, фотофобия, фонофобия) отмечался через 1 час и нарастал в период от 2 до 4 часов после приема препарата.

Золмитриптан одинаково эффективен в отношении мигрени с аурой, мигрени без ауры и мигрени, ассоциированной с менструацией. Прием золмитриптана во время ауры не предотвращал мигренозной головой боли, поэтому препарат следует принимать после начала болевого приступа.

Фармакокинетика

После приема внутрь золмитриптан быстро и полно абсорбируется (минимум 64%). Абсорбция золмитриптана не зависит от приема пищи. Средняя абсолютная биодоступность приблизительно 40%. Средний объем распределения составляет 7,0 л/кг. Связь с белками плазмы низкая (приблизительно- 25%). Активный, метаболит золмитриптана (N-дезметилметаболит) также является агонистом 5HT

$^{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, в 2-6 раз более сильным, чем золмитриптан. При приеме здоровыми добровольцами разовой дозы в диапазоне от 2,5 до 50 мг золмитриптан и его активный метаболит имеют дозозависимые площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) и C_{max}. При приеме, множественных доз кумуляции,
препарата не наблюдалось.

В течение 4 часов после приема препарата внутрь во время приступа мигрени концентрация золмитриптана и его метаболитов в плазме была ниже, чем в случае приема препарата в межприступный.период. Вероятно, это объясняется замедлением абсорбции золмитриптана, связанным с замедлением, опорожнения желудка во время; приступа мигрени.

Биоэквивалентность препаратов Зомиг и Зомиг Рапимелт была подтверждена в отношении показателей AUC и C_{max} золмитриптана и его активного-метаболита T_{max} их золмитриптана при приеме препарата Зомиг Рапимелт больше, чем при приеме препарата Зомиг (от 0,3 до 15 часов, медиана - 3 часа). C_{max} препарата в плазме поддерживается в течение последующих 4-6 часов. T_{max} активного, метаболита не отличается для препаратов Зомиг и Зомиг Рапимелт (медиана — 3 часа). Золмитриптан элиминируется преимущественно путем печеночной биотрансформации с последующим выведением метаболитов с мочой. Установлены три основных метаболита индолуксусная кислота (основной метаболит,выявляемый в плазме и моче), N-оксид- и N-дезметил-производные. N-дезметилированный метаболит является активным, а два других метаболита не проявляют фармакологической активности. Концентрация N-дезметилметаболита в плазме примерно 2 раза меньше концентрации золмитриптана.

Следовательно можно предположить, что этот метаболит вносит, свой вклад в терапевтическое действие препарата Зомиг, Рапимелт Более 60 % препарата) введенного в виде разовой пероральной дозы, выводится с мочой (преимущественно в виде индолуксусного метаболита) и около 30 % выводится с фекалиями, преимущественно в неизмененном виде.

Средний общий, плазменный клиренс золмитриптана равен 31,5 мл/мин/кг, одну шестую величины которого составляет почечный клиренс. Почечный клиренс выше, чем величина клубочковой фильтрации, что предполагает наличие канальцевой секреции.

Средний $T_{1/2}$ золмитриптана и N-дезметилированного метаболита составляет 4,7 ч и 5,7 ч у здоровых добровольцев, 7,3 ч и 7,5 ч у пациентов с умеренным нарушением функции,печени.и 12 ч и 7,8 ч у пациентов с выраженным нарушением ,
функции печени, соответственно.

Почечный клиренс золмитриптана и его метаболитов в 7-8 раз ниже у пациентов с умеренной и выраженной почечной недостаточностью по сравнению со здоровыми лицами, хотя AUC золмитриптана и активного метаболита увеличивается незначительно (на 16 % и 35 %, соответственно) с увеличением $T_{1/2}$ на 1 час (до 3-3,5 -часов). Значения этих фармакокинетических параметров не выходили, за пределы значений, отмеченных у здоровых добровольцев.

У пациентов с нарушением функции печени отмечалось замедление метаболизма золмитриптана, пропорциональное тяжести нарушения функции печени. У пациентов с выраженным нарушением функции печени по сравнению со здоровыми добровольцами было показано увеличение AUC на 226 %, C_{max} - на 47 %, $T_{1/2}$ - до 12 часов. При этом, отмечалось снижение концентрации метаболитов золмитриптана, в том числе, активного метаболита.

Фармакокинетические параметры у здоровых лиц пожилого возраста аналогичны таковым у молодых здоровых добровольцев.

Показания к применению:

— купирование приступов мигрени с аурой или без ауры.

Относится к болезням:

- Мигрень

Противопоказания:

— детский возраст до 18 лет;

— пожилой возраст старше 65 лет (эффективность и безопасность применения не изучена);

— период беременности (безопасность применения не изучена);

— гемиплегическая, базилярная и офтальмоплегическая мигрень;

— неконтролируемая артериальная гипертензия;

— ишемическая болезнь сердца;

— коронарный вазоспазм/стенокардия Принцметала;

— заболевания периферических артерий;

— нарушение мозгового кровообращения (в том числе, инсульт или транзиторная ишемическая атака) в анамнезе;

— синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта или аритмии, ассоциированные с другими дополнительными путями проведения импульса;

— тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 15 мл/мин.);

— совместное применение с другими агонистами $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, (например, суматриптаном, наратриптаном), эрготамином или его производными (в том числе, метизергидом), а также в течение 24 часов после их отмены;

— совместное применение с ингибиторами МАО А и в течение 14 дней после их отмены;

— фенилкетонурия (препарат содержит аспартам);

— гиперчувствительность к любым компонентам препарата.

С осторожностью: тяжелое нарушение функции печени.

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза препарата Зомиг Рапимелт для снятия приступа мигрени - 2.5 мг. Зомиг Рапимелт рекомендуется, принимать как можно раньше с момента начала головной боли, однако препарат эффективен и при приеме в более поздние сроки после начала приступа.

Таблетку следует положить на язык. В течение нескольких секунд она растворяется на поверхности языка, и ее можно проглотить со слюной, не запивая водой. Зомиг Рапимелт можно применять, чтобы избежать тошноты и рвоты, сопровождающей прием жидкости во время приступа мигрени, а также в ситуациях, когда нет возможности запить
таблетку водой.

Блистер с таблетками Зомиг Рапимелт следует открывать согласно схеме, приведенной на алюминиевой фольге блистера (не следует продавливать таблетку через фольгу). Если симптомы мигрени возникают вновь в течение 24 часов, можно принять повторную дозу препарата Зомиг Рапимелт. Не следует принимать повторную дозу ранее, чем через 2 часа после приема первой дозы препарата Зомиг Рапимелт. Если после приема первой дозы не отмечено клинического эффекта, маловероятна польза от повторного приема препарата во время того же приступа.

Если у пациента не был достигнут терапевтический эффект после приема дозы 2.5 мг, для снятия последующих приступов мигрени можно применять Зомиг Рапимелт в дозе 5 мг. Не следует принимать более 2 доз препарата Зомиг Рапимелт в сутки. Суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 10 мг.

Зомиг Рапимелт не показан для профилактики мигрени.

Применение у особых групп пациентов

Детский и подростковый возраст

Эффективность и безопасность золмитриптана у детей до 12 лет не изучалась. Эффективность золмитриптана в плацебоконтролируемом клиническом исследовании у пациентов в возрасте от 12 до 17 лет не установлена. Применение препарата Зомиг Рапимелт у детей и подростков не рекомендуется.

Пожилой возраст

Эффективность и безопасность золмитриптана у пациентов старше 65 лет не установлена.
Поэтому применение препарата Зомиг Рапимелт у пациентов пожилого возраста не рекомендуется.

Нарушение функции печени

Коррекция дозы при легком и умеренном нарушении функции печени не требуется. Для пациентов с тяжелым, нарушением функции печени суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 5 мг.

Почечная недостаточность

Коррекция дозы не требуется, если клиренс креатинина выше 15 мл/мин. (см. разделы «Противопоказания» и «Фармакокинетика»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами, требующее коррекции дозы

Для пациентов, принимающих циметидин или селективные ингибиторы изофермента CYP1A2 (например, флувоксамин, ципрофлоксацин и другие хинолоны) суммарная доза золмитриптана; принятая в течение суток, не должна превышать 5 мг.

Побочное действие:

Побочные эффекты золмитриптана, как правило, возникают в течение 4 часов после приема препарата, носят транзиторный характер и разрешаются спонтанно без лечения. Частота побочных эффектов не увеличивается при приеме повторных доз.

Частота побочных реакций приведена в виде следующей градации: очень часто (≥1/10); .часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10000, <1/1000); очень редко (<1/10000).

Часто (>1/100 <1/10)	
Со стороны центральной нервной системы:	нарушения чувствительности; головокружение; головная боль; гиперестезия; парестезии; сонливость; ощущение «тепла» или «холода»; вертиго
Со стороны сердечно-сосудистой системы:	ощущение сердцебиения
Со стороны желудочно-кишечного тракта:	боль в животе; тошнота; рвота; сухость во рту; диспепсия; дисфагия
Со стороны костно-мышечной системы:	мышечная слабость; миалгия
Общие расстройства:	астения; инертность; чувство стеснения , дыхания; боль или чувство стеснения в глотке, области шеи, грудной клетке или конечностях; повышенное потоотделение
Нечасто (>1/1000 <1/100)	
Со стороны сердечно-сосудистой системы:	тахикардия; незначительное повышение артериального давления; транзиторное повышение артериального давления; аритмия*; обморок*
Со стороны мочевыделительной системы:	полиурия, частое мочеиспускание
Редко (>1/10000 <1/1000)	
Со стороны иммунной системы:	реакции гиперчувствительности, в том числе, крапивница, ангионевротический отек и анафилактические реакции
Со стороны сердечно-сосудистой системы:	брадикардия*; экстрасистолия*; постуральная гипотензия*; удлинение интервала QT*; тромбофлебит*
Очень редко (<1/10000)	
Со стороны сердечно-сосудистой системы:	инфаркт миокарда**; стенокардия**; коронарный ангиоспазм**
Со стороны желудочно-кишечного тракта:	ишемия или инфаркт (например, ишемия или инфаркт кишки, инфаркт селезенки), симптомами которых могут быть диарея спримесью крови и боль в животе
Со стороны мочевыделительной системы:	императивные позывы к мочеиспусканию

* причинно-следственная связь с приемом препарата достоверно не установлена

** данные нежелательные явления и транзиторная ишемия миокарда, отмечены также при постмаркетинговом применении препарата. Поскольку сообщения получены спонтанно, от популяции неустановленного размера, невозможно достоверно оценить частоту и причинно-следственную связь с приемом препарата.

Некоторые из перечисленных симптомов могут быть симптомами мигрени.

Передозировка:

Симптомы

При однократном приеме здоровыми добровольцами золмитриптана в дозе 50 мг внутрь обычно отмечался седативный эффект. Период полувыведения золмитриптана составляет 2.5-3 часа (см. раздел «Фармакокинетика»), поэтому при передозировке наблюдение за пациентом должно продолжаться, как минимумов течение 15 часов или пока имеются симптомы передозировки.

Лечение

Для золмитриптана нет специфического антидота. В случае выраженной интоксикации рекомендуются мероприятия

интенсивной терапии, включая восстановление и поддержание проходимости дыхательных путей, обеспечение адекватной оксигенации и вентиляции легких, а также наблюдение, и поддержку функции сердечно-сосудистой системы.

Эффект гемодиализа и перитонеального диализа в отношении концентрации золмитриптана в сыворотке не установлен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Безопасность применения золмитриптана во время беременности не изучалась. Результаты исследований на животных не выявили прямых тератогенных эффектов. Однако некоторые данные исследований эмбриотоксичности - свидетельствуют о возможном снижении жизнеспособности эмбрионов. Применение препарата в период беременности противопоказано.

Лактация

Золмитриптан проникает в молоко лактирующих животных. Неизвестно, проникает ли золмитриптан в грудное молоко кормящих женщин. Поэтому необходимо с осторожностью подходить к вопросу назначения препарата Зомиг Рапимелт женщинам, кормящим грудью. Прекращение грудного вскармливания на 24 часа позволяет минимизировать воздействие золмитриптана на грудного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В исследованиях по изучению взаимодействие золмитриптана с кофеином, эрготамином, дигидроэрготамином, парацетамолом, метоклопрамидом, пизотифеном, флуоксетином, рифампицином и пропранололом клинически значимых изменений фармакокинетических параметров золмитриптана и его активного метаболита выявлено не было. Результаты исследований с участием здоровых добровольцев свидетельствуют, об отсутствии фармакокинетического и клинически значимого взаимодействия золмитриптана и эрготамина. Однако из-за теоретического риска коронарного ангиоспазма совместное применение этих препаратов противопоказано. Рекомендуется применять золмитриптан не ранее чем через 24 часа после приема препаратов эрготамина или его производных.

После применения моклобсмида (ингибитор МАО А) отмечалось небольшое увеличение (на 26%) AUC золмитриптана и трехкратное увеличение AUC его активного метаболита. После приемациметидина, ингибитора цитохрома Р450, отмечалось увеличение $T_{1/2}$ золмитриптана на 44% и увеличение AUC - на 48%. $T_{1/2}$ и AUC активного N-деметилированного метаболита увеличивались вдвое. Поэтому для пациентов принимающих циметидин, суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 5 мг. Основываясь на общем профиле взаимодействия препарата.

Зомиг Рапимелт, нельзя исключить возможность его взаимодействия с ингибиторами изофермента CYP1A2 цитохрома Р450. Поэтому для пациентов, принимающих, селективные, ингибиторы изофермента CYP1A2 (например, флувоксамин,
ципрофлоксацин и другие хинолоны) суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 5 мг.

Фармакокинетическое взаимодействие золмитриптана с селегилином (ингибитор МАО В) и флуоксетином,(СИОЗС) не было подтверждено. Однако при сочетанием применении триптанов и СИОЗС или СИОЗСиН были описаны случаи развития серотонинового синдрома (см. раздел «Особые указания»).

Как и другие агонисты $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, золмитриптан может замедлять абсорбцию других лекарственных средств.

Побочные, эффекты могут быть более частыми при совместном приеме триптанов и растительных препаратов, содержащих зверобой продырявленный (Hypericum perforatum).

Особые указания и меры предосторожности:

Зомиг Рапимелт может применяться только в случаях четко диагностированной мигрени. До назначения золмитриптана, как и других средств для купирования мигрени, необходимо исключить другие возможные серьезные неврологические заболевания у, пациентов с ранее не диагностированной мигренью, а также у пациентов с установленным диагнозом мигрени при наличии атипичных симптомов. Золмитриптан не показан для лечения гемиплегической, базилярной и офгальмоплегической мигрени. У пациентов, принимающих агонисты $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рецепторов, отмечались нарушения мозгового кровообращения, кровоизлияние в мозг, субарахноидальное кровоизлияние, в том числе, инсульты. Пациенты, страдающие мигренью, могут быть подвержены риску развития определенных нарушений мозгового кровообращения.

Не следует применять золмитриптан у пациентов с синдромом Вольфа-Паркинсона-Уайта или аритмиями, ассоциированными с другими дополнительными путями проведения импульса.

Очень редко при применении данного класса препаратов (агонисты $5HT_{1B/1D}$ серотониновых рецепторов) отмечались коронарный ангиоспазм, степокардия и инфаркт миокарда. Данные явления развивались в течение.нескольких часов с момента приема препарата.

Перед назначением золмитриптана пациентам с факторами риска развития ИБС (например, курение, артериальная гипертензия, гиперлипидемия, сахарный диабет, отягощенный семейный анамнез в отношении ИБС) рекомендуется, провести обследование сердечно-сосудистой системы, необходимо контролировать АД и ЭКГ (см; раздел «Противопоказания»). Особое внимание следует уделять женщинам в постменопаузальном периоде и мужчинам старше 40 лет при наличии указанных факторов риска. Тем не менее, не у всех пациентов при обследовании удается выявить сердечно-сосудистые заболевания, и в очень редких случаях серьезные сердечно-сосудистые осложнения могут развиться у пациентов, не имевших указаний на сердечно-сосудистые заболевания в анамнезе.

У пациентов, в течение продолжительного времени, получающих интермиттирующую терапию препаратом Зомиг Рапимелт, или с факторами риска развития ИБС, рекомендуется периодически проводить обследование сердечно-сосудистой системы.

Очень редко при, применении золмитриптана и других агонистов $5HT_1$-серотониновых рецепторов отмечались ишемические, явления со стороны ЖКТ, включая ишемический колит, инфаркт кишечника, некроз, симптомами которых могут быть диарея с примесью крови и боль в животе.

Как и в случае применения других агонистов $5HT_{1B/1D}$-серотониновых,рецепторов, при применении золмитриптана сообщалось об ощущениях тяжести, давления или стеснения в области сердца (см. раздел «Побочное действие»). При возникновении болей в области грудной клетки или симптомов ишемической болезни сердца следует прекратить прием,
золмитриптана до проведения соответствующего медицинского обследования.

Как и в случае других агонистов $5HT_{1B/1D}$-серотониновых рцепторов, транзиторное
повышение артериального давления отмечалось у пациентов, независимо от наличия артериальной гипертензии в анамнезе; очень редко такое, повышение-артериального давления было клинически выраженным.
Не следует превышать рекомендованные дозы золмитриптана.

Побочные эффекты могут быть более частыми при совместном приеме триптанов и растительных препаратов, содержащих зверобой продырявленный (Hypericum perforatum).Отмечалось развитие серотонинового синдрома при сочетанном применении триптанов и селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (СИОЗС) или ингибиторов обратного захвата серотонина и норадреналина (СИОЗСиН). Ссротониновый синдром может представлять угрозу для жизни и проявляться следующими признаками и симптомами изменения психического состояния (возбуждение, галлюцинации, кома), вегетативные симптомы (тахикардия, лабильность артериального давления, гипертермия), нервно-мышечные симптомы (гиперрефлексия, нарушение координации), а также симптомы со стороны ЖКТ (тошнота, рвота, диарея). Рекомендуется тщательное наблюдение за пациентами при сопутствующем назначении препарата Зомиг Рапимелт и
СИОЗС или СИОЗСиН, особенно в период начала терапии, увеличения дозы или добавления к.терапии другого препарата, влияющего на обмен серотонина (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды лекарственного взаимодействия»).

Чрезмерное применение противомигренозных препаратов может приводить, к увеличению частоты возникновения головной боли, что потенциально требует отмены лечения. Если у пациента отмечаются частые или ежедневные головные боли, несмотря на регулярный, прием препаратов для лечения этого состояния, следует помнить о возможности развития головной боли при избыточном употреблении лекарственных препаратов для терапии головной боли.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не наблюдалось значительного ухудшения в выполнении психомоторных тестов при приеме золмитриптана в дозе до 20 мг. Пациентам, деятельность которых требует высокой скорости психомоторных реакций (например, управление автомобилем или другими механизмами), рекомендуется соблюдать осторожность, из-за возможного развития сонливости и других симптомов мигрени.

При нарушениях функции почек

Коррекция дозы не требуется, если клиренс креатинина выше 15 мл/мин.

При нарушениях функции печени

Коррекция дозы при легком и умеренном нарушении функции печени не требуется. Для пациентов с тяжелым, нарушением функции печени суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 5 мг.

Применение в пожилом возрасте

Эффективность и безопасность золмитриптана у пациентов старше 65 лет не установлена.
Поэтому применение препарата Зомиг Рапимелт у пациентов пожилого возраста не рекомендуется.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность золмитриптана у детей до 12 лет не изучалась. Эффективность золмитриптана в плацебоконтролируемом клиническом исследовании у пациентов в возрасте от 12 до 17 лет не установлена. Применение препарата Зомиг Рапимелт у детей и подростков не рекомендуется.

Условия хранения:

При температуре не выше 30°С, в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Zomig_Rapimelt