Инструкция по применению
Релпакс Таблетки покрытые пленочной оболочкой 40 мг 2 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Италия
Производитель: Пфайзер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Элетриптан
Количество в упаковке: 2
Дозировка действующего вещества: 40 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Элетриптан

Состав

Действующее вещество: элетриптан (eletriptan)Концентрация действующего вещества (мг): 40

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

ВсасываниеПосле приема внутрь элетриптан быстро и достаточно полно всасывается из ЖКТ (абсорбция составляет около 81%). У мужчин и женщин абсолютная биодоступность при приеме внутрь составляет около 50%. Tmax после приема внутрь в плазме крови в среднем составляло 1.5 ч. В диапазоне терапевтических доз (20-80 мг) фармакокинетика элетриптана характеризуется линейной зависимостью.Cmax элетриптана в плазме крови и AUC увеличивались примерно на 20-30% при приеме препарата после употребления жирной пищи. При приеме внутрь во время приступа мигрени AUC уменьшалась примерно на 30%, Tmax в плазме крови увеличивалось до 2.8 ч.При регулярном применении (по 20 мг 3 раза/сут) в течение 5-7 дней фармакокинетика элетриптана оставалась линейной с предсказуемой кумуляцией. При назначении в более высоких дозах (40 мг 3 раза/сут и 80 мг 2 раза/сут) в течение

7 дней кумуляция элетриптана превышала ожидаемую (примерно на 40%). РаспределениеVd элетриптана при в/в введении составляет 138 л, что указывает на хорошее распределение в ткани. Элетриптан умеренно связывается с белками (примерно на 85%).МетаболизмИсследования in vitro свидетельствуют о том, что первичный метаболизм элетриптана происходит под действием изофермента CYP3A4 в печени. Этот факт подтверждается повышением концентраций элетриптана в плазме крови при одновременном применении эритромицина, который является мощным селективным ингибитором CYP3A4. Исследования in vitro демонстрируют также небольшое участие CYP2D6 в метаболизме элетриптана, хотя в клинических исследованиях не выявлено клинического эффекта полиморфизма этого фермента на фармакокинетические параметры элетриптана.Идентифицировано два основных циркулирующих метаболита, доля которых составляет значительную часть общей радиоактивности плазмы крови после введения элетриптана, меченного 14C. Метаболит, образующийся в результате N-окисления, не обладал активностью в экспериментах на животных in vitro. Метаболит, образующийся в результате N-деметилирования, по активности был сопоставим с элетриптаном в исследованиях на животных in vitro. Третий компонент радиоактивной плазмы не идентифицирован, полагают, что он представляет собой смесь гидроксилированных метаболитов, которые также выводятся почками и через кишечник.Концентрация активного N-деметилированного метаболита в плазме крови составляет всего 10-20% от концентрации элетриптана и соответственно не вносит значительного вклада в его терапевтический эффект.ВыведениеОбщий клиренс элетриптана из плазмы крови после в/в введения составляет в среднем 36 л/ч, а T1/2 - примерно 4 ч. Средний почечный клиренс после приема внутрь равен примерно 3.9 л/ч. Доля внепочечного клиренса составляет примерно 90% от общего клиренса; это свидетельствует о том, что элетриптан выводится, главным образом, в виде метаболитов почками и через кишечник.Фармакокинетика в особых клинических случаяхРезультаты мета-анализа клинико-фармакологических исследований и популяционного фармакокинетического анализа свидетельствуют о том, что пол не оказывает клинически значимого влияния на концентрацию элетриптана в плазме крови.У людей пожилого возраста (65-93 года) выявлено небольшое и статистически незначимое снижение (на 16%) клиренса элетриптана и статистически значимое увеличение T1/2 (примерно с 4.4 до 5.7 ч) по сравнению с таковыми у молодых взрослых людей. Эффект элетриптана на АД у пожилых людей может быть более выраженным по сравнению с пациентами более молодого возраста.У пациентов с нарушением функции печени (классы A и B по шкале Чайлд-Пью) выявлено статистически значимое увеличение AUC (на 34%) и T1/2, а также небольшое увеличение Cmax (на 18%), однако эти небольшие изменения не считаются клинически незначимыми.У пациентов с легким (КК 61-89 мл/мин), умеренным (КК 31-60 мл/мин) и выраженным (ККменьше30 мл/мин) нарушением

функции почек не выявлено статистически значимых изменений фармакокинетики элетриптана или связывания его с белками плазмы крови.

Показания

купирование приступов мигрени с аурой и без ауры.

Способ применения и дозы

Релпакс следует принимать как можно раньше, однако препарат эффективен и на более поздней стадии приступа мигрени. Рекомендуемая начальная доза составляет 40 мг. Если мигренозная головная боль возобновляется в течение 24 час, то Релпакс можно назначить повторно в той же дозе. Если необходима вторая доза, ее следует принимать не ранее, чем через 2 час после первой дозы. Суточная доза не должна превышать 160 мг.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к элетриптану или к любому другому компоненту препарата .Тяжелые нарушения функции печени, возраст до 18 лет. Противопоказания, общие для всех агонистов серотонтновых рецепторов: неконтролируемая артериальная гипертензия, коронарная болезнь, в т.ч. ишемическая болезнь сердца (стенокардия, стенокардия Принцметала, перенесенный инфаркт миокарда, подтвержденная бессимптомная ишемия миокарда) или подозрение на ее наличие, окклюзионные заболевания периферических сосудов, нарушение мозгового кровообращения или транзиторная ишемическая атака в анамнезе.

Применение при беременности и кормлении грудью

Клинический опыт применения препарата Релпакс при беременности отсутствует. Применение препарата возможно только в случаях, когда предполагаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.Элетриптан выделяется с грудным молоком у женщин. При однократном приеме препарата Релпакс в дозе 80 мг выведение с грудным молоком в течение 24 ч составило в среднем 0.02% от принятой дозы. Риск воздействия элетриптана на новорожденного можно свести к минимуму, если не кормить его грудью в течение 24 ч после приема препарата Релпакс.В экспериментальных исследованиях на животных Релпакс не оказывал тератогенного действия.

Побочные действия

В целом, Релпакс переносится хорошо. Обычно побочные эффекты носят преходящий характер, слабо или умеренно выражены и проходят самостоятельно без дополнительного лечения. Основные побочные эффекты, зарегистрированные при лечении Релпаксом, являются типичными для всего класса агонистов 5-HT1 рецепторов. Наиболее частые: астения, боль в спине, боль и стеснение в груди, сердцебиение, тахикардия, повышение артериального давления, сонливость, головокружение, парестезия, боль в животе, сухость во рту, тошнота, рвота, диспепсия, миалгия, фарингит, сыпь, зуд, крапивница.

Передозировка

Симптомы: возможно развитие артериальной гипертензии или других нарушений со стороны сердечно-сосудистой системы.Лечение: промывание желудка, проведение симптоматической терапии. T1/2 элетриптана составляет около 4 ч, поэтому в случае передозировки следует контролировать состояние пациентов в течение, по крайней мере, в течение 20 ч или до исчезновения клинических симптомов передозировки. Влияние гемодиализа и перитонеального диализа на концентрацию элетриптана в плазме неизвестно.

Взаимодействие с другими препаратами

Влияние других лекарственных препаратов на элетриптанПри одновременном назначении эритромицина (1 г) и кетоконазола (400 мг), являющихся мощными специфическими ингибиторами изофермента CYP3A4, выявлено значительное увеличение Cmax (в 2 и 2.7 раза соответственно) и AUC (в 3.6 и 5.9 раза соответственно) элетриптана. Эти эффекты сопровождались увеличением T1/2 элетриптана с 4.6 до 7.1 ч при применении эритромицина и с 4.8 до 8.3 ч при применении кетоконазола. Поэтому Релпакс не следует применять в комбинации с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4, в частности с кетоконазолом, итраконазолом, эритромицином, кларитромицином, джозамицином и ингибиторами протеазы (ритонавиром, индинавиром и нелфинавиром).Взаимодействие препарата Релпакс с бета-адреноблокаторами, трициклическими антидепрессантами, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина и флунаризином не выявлено, однако результаты специальных клинических исследований по взаимодействию с этими препаратами в настоящее время отсутствуют (за исключением пропранолола).Популяционный фармакокинетический анализ клинических исследований показал, что влияние следующих лекарственных препаратов на фармакокинетику препарата Релпакс маловероятно: бета-адреноблокаторы, трициклические антидепрессанты, селективные ингибиторы

обратного захвата серотонина, эстрогеносодержащие препараты для ЗГТ и эстрогеносодержащие пероральные контрацептивы, блокаторы кальциевых каналов. Элетриптан не является субстратом МАО. В связи с этим не предполагается взаимодействия препарата Релпакс и ингибиторов МАО, специальных исследований их взаимодействия не проводилось.При одновременном применении пропранолола (160 мг), верапамила (480 мг) или флуконазола (100 мг) Cmax элетриптана повышается соответственно в 1.1, 2.2 и 1.4 раза, а его AUC - в 1.3, 2.7 и 2 раза. Эти изменения считаются клинически незначимыми, т.к. они не сопровождались повышением АД или увеличением частоты нежелательных явлений, по сравнению с таковой при применении одного элетриптана.Прием кофеина/эрготамина внутрь через 1 и 2 ч после приема препарата Релпакс приводит к небольшому, но аддитивному повышению АД, которое можно было предсказать на основании фармакологических свойств этих препаратов. В связи с этим препараты, содержащие эрготамин, или производные эрготамина (в т.ч. дигидроэрготамин) не следует назначать в течение 24 ч после приема препарата Релпакс.И наоборот, Релпакс можно назначать не ранее чем через 24 ч после приема эрготаминосодержащих препаратов.Влияние элетриптана на другие лекарственные препаратыВ терапевтических дозах не выявлено влияние (ингибирование или индуцирование) препарата на систему цитохрома Р450.Взаимодействие с серотонинергическими препаратамиОдновременное применение агонистов серотониновых 5-НТ-рецепторов, в т.ч. элетриптана, с препаратами, обладающими серотонинергической активностью, такими как селективные ингибиторы обратного захвата серотонина и селективные ингибиторы обратного захвата серотонина и норадреналина, может повысить риск развития серотонинового синдрома. В случае клинической необходимости одновременного применения элетриптана и серотонинергических препаратов требуется осторожность. Таких пациентов следует тщательно наблюдать, особенно в начале лечения и при увеличении дозы каждого препарата.

Особые указания

Не рекомендуется применение препарата Релпакс в сочетании с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4, в частности, с кетоконазолом, итраконазолом, эритромицином, кларитромицином, джозамицином и ингибиторами протеазы, такими как ритонавир, индинавир и нелфинавир. Кроме того, Релпакс не следует принимать в течение 72 ч после завершения приема ингибиторов изофермента CYP3A4.Как и другие агонисты серотониновых 5-НТ1-рецепторов, Релпакс следует применять только в тех случаях, когда диагноз мигрени не вызывает сомнения.Релпакс, как и другие агонисты серотониновых 5-НТ1-рецепторов, не следует назначать для лечения атипичных головных болей, которые могут быть связаны с серьезными заболеваниями

(инсульт, разрыв аневризмы), когда сужение сосудов головного мозга может быть вредным.На фоне применения агонистов серотониновых 5-НТ1-рецепторов отмечались случаи развития кровоизлияния в головной мозг, субарахноидального кровоизлияния, инсульта или других цереброваскулярных нарушений, в некоторых случаях с летальным исходом. В нескольких случаях цереброваскулярное нарушение было основным заболеванием и агонисты серотониновых 5-НТ1-рецепторов применяли некорректно, трактовав симптомы, как признаки мигрени. Следует учитывать, что у пациентов с мигренью может быть повышен риск цереброваскулярных осложнений (например, инсульта, кровоизлияния и транзиторной ишемической атаки).При одновременном применении элетриптана и СИОЗС (например, флуоксетин, пароксетин, сертралин, флувоксамин, циталопрам, эсциталопрам) и СИОЗСН (например, венлафаксин, дулоксетин) возможно развитие потенциально жизнеугрожающего серотонинового синдрома. Данный синдром может проявляться следующими симптомами: нарушение психического статуса (например, ажитация, галлюцинации, кома), нестабильность вегетативной нервной системы (например, тахикардия, колебания АД, гипертермия), нарушение функции нейромышечной системы (например, гиперрефлексия, нарушение координации) и/или симптомы нарушения функции пищеварительной системы (например, тошнота, рвота, диарея).Не рекомендуется применять Релпакс у пациентов с факторами риска развития ИБС (например, артериальная гипертензия, гиперхолестеринемия, курение, ожирение, сахарный диабет, отягощенный семейный анамнез, женщины в состоянии хирургической или физиологической менопаузы или мужчины в возрасте старше 40 лет) до тех пор пока не будет проведено тщательное обследование системы кровообращения и не будет исключено сердечно-сосудистое заболевание. Чувствительность методов оценки состояния сердечно-сосудистой системы достаточно мала. В связи с этим, если в анамнезе пациента, на ЭКГ или при проведении других диагностических процедур обнаруживаются признаки, характерные для артериального вазоспазма или ишемии миокарда, применять элетриптан не рекомендуется.У пациентов с факторами риска сердечно-сосудистых заболеваний, но у которых оценка состояния сердечно-сосудистой системы показала удовлетворительный результат, рекомендуется первую дозу элетриптана принимать под наблюдением врача, кроме пациентов, которые ранее получали элетриптан. Т.к. ишемия миокарда может возникнуть в отсутствии клинических симптомов, следует рассмотреть возможность проведения ЭКГ сразу после приема препарата Релпакс. Пациенты с факторами риска сердечно-сосудистых заболеваний, как описано выше, получающие элетриптан длительно, но с перерывами, должны периодически проходить обследование сердечно-сосудистой системы, поскольку они продолжают терапию элетриптаном.Систематическое следование изложенным выше рекомендациям приводит к уменьшению числа случаев, когда пациенты с

неустановленными сердечно-сосудистыми заболеваниями получают терапию элетриптаном.При применении агонистов серотониновых 5-НТ1-рецепторов сообщалось о случаях тяжелых нарушений сердечной функции, в т.ч. инфаркте миокарда, жизнеугрожающих нарушениях сердечного ритма и летальных исходах, развивавшихся в первые несколько часов после приема препарата. Учитывая широту применения серотониновых 5-НТ1-рецепторов у пациентов с мигренью, частота возникновения данных реакций крайне низка.Во время проведения клинических исследований были получены следующие сообщения. Среди пациентов, у которых проводили диагностическую коронарную ангиографию, у одного пациента, получающего элетриптан в/в (Cmax 127 нг/мл, что эквивалентно 60 мг элетриптана для приема внутрь) со стенокардией в анамнезе, артериальной гипертензией и гиперхолестеринемией, возникло чувство стеснения в грудной клетке, а также был выявлен коронарный ангиоспазм (подтвержденный ангиографией) без изменений на ЭКГ, характерных для ишемии. Кроме того, сообщалось об одном случае развития фибрилляции предсердий у пациента с таким нарушением ритма в анамнезе.В постмаркетинговом периоде сообщалось о случаях развития тяжелых сердечно-сосудистых осложнений, некоторые из которых с летальным исходом. В очень редких случаях данные осложнения возникали в отсутствии каких-либо признаков сердечно-сосудистого заболевания. Тем не менее, учитывая трудность контроля сообщений, полученных в постмаркетинговом периоде, невозможно окончательно определить взаимосвязь данных случаев с приемом элетриптана.Релпакс не следует назначать без предварительного обследования больным, у которых вероятно наличие сердечно-сосудистых заболеваний или повышен риск их развития. Системного изучения элетриптана у больных с сердечной недостаточностью не проводилось. Применение элетриптана, как и других агонистов серотониновых 5-НТ1-рецепторов, у этих пациентов не рекомендуется.Релпакс эффективен при лечении мигрени с аурой и без ауры и мигрени, сопутствующей менструальному циклу. Релпакс, принимаемый во время появления ауры, не препятствует развитию головной боли, поэтому его следует принимать только во время фазы головной боли.В клинических исследованиях установлено, что Релпакс является эффективным также для купирования симптомов, сопровождающих мигрень, таких как тошнота, рвота, фотофобия, фонофобия, и для лечения возврата головной боли в течение приступа.Релпакс не следует принимать профилактически.При применении препарата Релпакс в терапевтических дозах 60 мг и более регистрировали небольшое и преходящее повышение АД.АД повышалось в большей степени у пациентов с нарушением функции почек и пожилых людей. Влияние на способность к управлению автотранспортом и работе с механизмамиВ некоторых случаях сама мигрень или прием агонистов серотониновых 5-НТ1-рецепторов, включая Релпакс, могут сопровождаться сонливостью или головокружением. Пациентам при выполнении работы, требующей повышенного

внимания, такой как вождение автотранспорта и работа со сложными механизмами, следует проявлять осторожность во время приступов мигрени и после приема препарата Релпакс.

Условия хранения

В сухом месте