Инструкция по применению
Золмитриптан-СЗ Таблетки 2,5 мг 4 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Северная Звезда
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Золмитриптан
Количество в упаковке: 4
Дозировка действующего вещества: 2,5 мг



Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого с коричневатым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые. На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Золмитриптан

Состав

1 таблетка содержит: действующее вещество: золмитриптан - 2,5 мг, вспомогательные вещества: лактоза безводная (сахар молочный безводный) - 98,3 мг, целлюлоза микрокристаллическая (тип 102) - 15,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 3,0 мг, магния стеарат -1,2 мг. состав оболочки: гипромеллоза - 2,15 мг, полисорбат-80 (твин-80) - 0,60 мг, тальк - 0,60 мг, титана диоксид Е 171 - 0,45 мг, краситель железа оксид желтый Е 172 - 0,20 мг.

Форма выпуска

Таблетки

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 серотониновых 5НТш /т-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 максимальную концентрацию (Cmax). Cmax достигается в течение 1,5 часов (75 % Cmax - в течение 1 часа), максимальная концентрация препарата в плазме поддерживается в течение последующих 4-6 часов. При приеме нескольких доз кумуляции препарата не наблюдалось. В течение 4 часов после приема препарата внутрь во время приступа мигрени концентрация золмитриптана и его метаболитов в плазме крови 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. 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 в 2 раза меньше концентрации золмитриптана. Следовательно, можно предположить, что этот метаболит вносит свой вклад в терапевтическое действие золмитриптана. Более 60 % золмитриптана, введенного в виде разовой пероральной дозы, выводится с мочой (преимущественно в виде индолуксусного метаболита) и около 30 % выводится через кишечник, 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 период полувыведения 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 периода полувыведения 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 %, Cmax - на 47 %, периода полувыведения - 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

Купирование приступов мигрени с аурой или без ауры.

Способ применения и дозы

Таблетки следует принимать внутрь целиком, запивая водой. Рекомендуемая доза препарата для снятия приступа мигрени - 2,5 мг (1 таблетка). Рекомендуется принимать препарат как можно раньше с момента начала головной боли, однако препарат эффективен и при приеме в более поздние сроки после начала приступа. Если симптомы мигрени возникают вновь в течение 24 часов, можно принять повторную дозу препарата Золмитриптан-СЗ. Не следует принимать повторную дозу ранее, чем через 2 часа после приема первой дозы. 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 препарат Золмитриптан-СЗ в дозе 5 мг (2 таблетки). Не следует принимать более 2 доз препарата Золмитриптан-СЗ в сутки. Суммарная доза золмитриптана, принятая в течение суток, не должна превышать 10 мг (4 таблетки). Препарат Золмитриптан-СЗ не показан для профилактики мигрени. Применение у особых групп пациентов Детский и подростковый возраст Эффективность и безопасность применения золмитриптана у детей до 12 лет не изучалась. Эффективность применения золмитриптана в плацебоконтролируемом клиническом исследовании у пациентов в возрасте от 12 до 17 лет не установлена. Применение препарата Золмитриптан-СЗ у детей и подростков не рекомендуется. Пожилой возраст Эффективность и безопасность золмитриптана у пациентов старше 65 лет не установлена. Поэтому применение препарата Золмитриптан-СЗ 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. Препарат противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени тяжести (клиренс креатинина менее 15 мл/мин). 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.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любым компонентам препарата. Детский возраст - до 18-ти 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 серотониновых 5ЫTib/id-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. Непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

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 противопоказано в период беременности. Период грудного вскармливания Золмитриптан проникает в молоко лактирующих животных. Неизвестно, проникает ли золмитриптан в грудное молоко женщин в период грудного вскармливания. Поэтому необходимо с осторожностью подходить к вопросу назначения препарата женщинам в период грудного вскармливания. Прекращение грудного вскармливания на 24 часа позволяет минимизировать воздействие золмитриптана на грудного ребенка.

Побочные действия

Нежелательные реакции при применении золмитриптана, как правило, возникают в течение 4 часов после приема препарата, носят транзиторный характер и разрешаются спонтанно без лечения. Частота нежелательных реакций не увеличивается при приеме повторных доз. Частота развития нежелательных реакций представлена согласно классификации ВОЗ: очень часто (>1/10 случаев), часто (>1/100 и 1/1000 и 1/10000 и <1/1000 случаев), очень редко (<1/10000 случаев). Со стороны центральной нервной системы: часто — нарушения чувствительности, головокружение, гиперестезия, парестезии, сонливость, ощущение «тепла» или «холода», вертиго. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ощущение сердцебиения, нечасто - тахикардия, незначительное повышение артериального давления, транзиторное повышение артериального давления, очень редко - инфаркт миокарда, стенокардия, коронарный ангиоспазм. Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - боль в животе, тошнота, рвота, сухость во рту, диспепсия, дисфагия, очень редко - ишемия или инфаркт (например, ишемия или инфаркт кишки, инфаркт селезенки), симптомами которых могут быть диарея с примесью крови и боль в животе. Со стороны костно-мышечной системы: часто - мышечная слабость, миалгия. Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - полиурия, частое мочеиспускание, очень редко - императивные позывы к мочеиспусканию. Со стороны иммунной системы: редко - реакции гиперчувствительности, в том числе, крапивница, ангионевротический отек и анафилактические реакции. Общие расстройства: часто - астения, инертность, чувство стеснения дыхания, боль или чувство стеснения в глотке, области шеи, грудной клетке или конечностях, повышенное потоотделение. Некоторые из перечисленных симптомов могут быть симптомами мигрени. Если любые из указанных в инструкции нежелательные реакции усугубляются, или Вы заметили другие нежелательных реакций не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы При однократном приеме внутрь золмитриптана в дозе 50 мг здоровыми добровольцами обычно отмечался седативный эффект. Период полувыведения золмитриптана составляет 2,5 - 3 часа, поэтому при передозировке наблюдение за пациентом должно продолжаться, как минимум в 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.

Взаимодействие с другими препаратами

В исследованиях по изучению взаимодействия 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 моклобемида (ингибитор МАО-А) отмечалось небольшое увеличение (на 26 %) AUC золмитриптана и трехкратное увеличение AUC его активного метаболита. После приема циметидина, ингибитора цитохрома Р450, отмечалось увеличение периода полувыведения золмитриптана на 44 % и увеличение AUC на 48 %. Период полувыведения и AUC активного N-дезметилированного 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 золмитриптана, 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 (селективный ингибитор обратного захвата серотонина (СИОЗС) не было подтверждено. Однако при одновременном применении триптанов и СИОЗС или СИОЗСиН (селективных ингибиторов обратного захвата серотонина и норадреналина) были описаны случаи развития серотонинового синдрома (см. раздел «Особые указания»). Как и другие агонисты серотониновых бНТт/т-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

Препарат Золмитриптан-СЗ 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 офтальмоплегической мигрени. У пациентов, принимающих агонисты серотониновых 5НТш/т-рецепторов, отмечались нарушения мозгового кровообращения, в том числе, инсульты. Пациенты с 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 серотониновых 5НТш/т-рецепторов) отмечались коронарный ангиоспазм, стенокардия и инфаркт миокарда. Перед назначением золмитриптана пациентам с факторами риска развития ишемической болезни сердца (ИБС) (например, курение, артериальная гипертензия, гиперлипидемия, сахарный диабет, отягощенный семейный анамнез в отношении ИБС) рекомендуется провести обследование сердечнососудистой системы, необходимо контролировать артериальное давление и электрокардиограмму. 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. Как и в случае применения других агонистов серотониновых 5HTib/id-рецепторов, при применении золмитриптана сообщалось об ощущениях тяжести, давления или стеснения в области сердца. 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 серотониновых бНТт/т-рецепторов, 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 одновременном приеме триптанов и растительных препаратов, содержащих зверобой продырявленный (Hypericum perforatum). Отмечалось развитие серотонинового синдрома при сочетанном применении триптанов и СИОЗС или СИОЗСиН. Серотониновый синдром может включать следующие признаки и симптомы: изменения психического состояния, вегетативные и нервно-мышечные симптомы. Рекомендуется тщательное наблюдение за пациентами при сопутствующем назначении препарата Золмитриптан-СЗ 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»). 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 управлять транспортными средствами, 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 транспортным средством или механизмами), рекомендуется соблюдать осторожность из-за возможного развития сонливости и других симптомов мигрени.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.