

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
13.07.11 № 406
Регистрационное удостоверение
№ UA/4796/01/01

ИЗМЕНЕНИЯ ВНЕСЕНЫ
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
23.09.13 № 826

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ЗОЛМИГРЕН
(ZOLMIGREN)

Состав:

действующее вещество: zolmitriptan;
1 таблетка содержит золмитриптана в пересчёте на 100 % вещество 2,5 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая 102, натрия крахмалгликолят (тип А), магния стеарат;
состав оболочки: Sepifilm 752 Blanc (гидроксипропилметилцеллюлоза, целлюлоза микрокристаллическая, полиэтиленгликоль (макрогол 40), титана диоксид (Е 171), железа оксид жёлтый (Е 172)).

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые плёночной оболочкой.

Фармакотерапевтическая группа.

Средства, применяемые при мигрени. Селективные агонисты 5HT₁-рецепторов серотонина. Золмитриптан. Код ATC N02C C03.

Клинические характеристики.

Показания.

Купирование приступа мигрени с аурой (зрительные, слуховые, двигательные и психические расстройства) и без ауры.

Противопоказания.

Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата.
Тяжелая артериальная гипертензия, а также умеренное неконтролированное повышение давления. Ишемическая болезнь сердца, в том числе инфаркт миокарда в анамнезе. Ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметалла). Цереброваскулярные нарушения и транзиторная ишемическая атака (ТИА) в анамнезе. Клиренс креатинина ниже 15 мл/мин. Синдром WPW и аритмии, ассоциированные с другими сердечными дополнительными путями проведения. Одновременный приём эрготамина, производных эрготамина, суматриптана, наратриптана или других агонистов рецепторов 5HT_{1B/1D}. Заболевание периферических сосудов. Пожилой (старше 65 лет) возраст.

Способ применения и дозы.

Препарат не предназначен для применения с целью профилактики приступа мигрени. Золмигрен рекомендуется применять как можно раньше после возникновения приступа мигрени. Взрослым назначают по 1 таблетке (2,5 мг золмитриптана). При отсутствии эффекта или при

КОНТРОЛЬНЫЙ

рецидиве боли возможен повторный прием 1 таблетки. При необходимости повторную дозу можно принимать не ранее, чем через 2 часа после первой дозы.

При недостаточной эффективности дозы 2,5 мг допускается увеличение разовой дозы до 5 мг (максимальная разовая доза). Максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Для пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени корректировка дозы не требуется. Для пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени суточная доза препарата не должна превышать 5 мг.

При клиренсе креатинина более 15 мл/мин дозу корректировать не нужно.

Побочные реакции.

Побочные эффекты обычно носят лёгкий характер, как правило, обратимы, появляются в течение 4 часов после приёма препарата, не учащаются после повторного применения и исчезают спонтанно без дополнительного лечения. По частоте возникновения побочные эффекты классифицируются по таким категориям:

очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100 < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000 < 1/1000$).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто – ощущение сердцебиения; нечасто – тахикардия, незначительное повышение артериального давления; редко – инфаркт миокарда, стенокардия напряжения, коронароспазм.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто – нарушение чувствительности, головокружение, усиление головной боли, гиперестезии, парестезии, сонливость, ощущение жара.

Со стороны пищеварительного тракта: часто – боль в животе, тошнота, рвота, сухость во рту; редко – ишемия или инфаркт (например, интестинальная ишемия, интестинальный инфаркт, инфаркт селезёнки), что может проявляться как диарея с примесью крови или болью в брюшной полости.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто – полиурия, частое мочеиспускание; редко – императивные позывы к мочеиспусканию.

Со стороны костно-мышечной системы: часто – мышечная слабость, боль в мышцах.

Общие расстройства: часто – астения, ощущение тяжести и сдавливания в горле, шее, грудной клетке и конечностях.

Со стороны иммунной системы: нечасто – реакции гиперчувствительности, включая крапивницу, отёк Квинке и анафилактические реакции.

Некоторые симптомы могут принадлежать самой мигрени.

Передозировка.

Симптомы: у добровольцев, которые принимали одноразово золмитриптан в дозе 50 мг, наблюдался седативный эффект. В случае передозировки следует наблюдать за пациентом по крайней мере 15 часов или до исчезновения симптомов или признаков.

Лечение: промывание желудка, применение активированного угля; симптоматическая терапия, в том числе обеспечение проходимости дыхательных путей, мониторинг и поддержание функций сердечно-сосудистой системы. Специфического антидота нет.

Применение в период беременности и кормления грудью.

В период беременности Золмигрен применяют только в том случае, если возможный терапевтический эффект для матери превышает потенциальный риск для плода/ребёнка.

Нет данных о том, секretируется ли золмитриптан в грудное молоко. Не рекомендуется кормить ребёнка грудью на протяжении 24 часов после приёма препарата.

Дети. Препарат не применяют для лечения детей.

Особенности применения.

Препарат не назначают для профилактики приступов мигрени.

Препарат следует принимать только в случаях, когда точно установлен диагноз мигрени. Перед началом лечения головной боли у пациентов, у которых раньше мигрень не диагностировалась, или пациентов, склонных к мигрени, у которых наблюдаются атипичные симптомы, следует

КОНТРОЛЬНЫЙ

исключить другие патологические состояния. Препарат не следует принимать при гемиплегической, базилярной мигрени.

У пациентов, принимающих агонисты 5HT_{1B/1D} возможно возникновение инсульта и других побочных цереброваскулярных нарушений. У лиц, склонных к мигрени, могут появиться некоторые симптомы, связанные с цереброваскулярной недостаточностью сосудов головного мозга.

Золмигрен не следует назначать пациентам, которые страдают синдромом Вольфа-Паркинсона-Уайта или аритмиями, связанными с другими дополнительными проводящими путями сердца.

В единичных случаях, так же, как и при применении других агонистов 5HT_{1B/1D}, возможен коронароспазм, приступы стенокардии и инфаркт миокарда. При наличии факторов, способствующих развитию ишемической болезни сердца (например, курение, повышенное артериальное давление, гиперлипидемия, сахарный диабет, наследственность), Золмигрен следует назначать только после обследования пациента на наличие заболеваний со стороны сердечно-сосудистой системы.

У некоторых пациентов после приёма золмитриптина может появиться ощущение тяжести, давления или сжимания в области сердца. При появлении боли в грудной клетке или симптомов, характерных для ишемической болезни сердца применение Золмигрена следует прекратить и провести обследование пациента.

У пациентов как с повышенным артериальным давлением в анамнезе, так и с нормальным артериальным давлением возможно преходящее повышение артериального давления. Очень редко такое повышение артериального давления связано с серьёзными клиническими проявлениями. Применять Золмигрен следует в дозе, которая не превышает рекомендованную.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкостными наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять препарат.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Препарат не следует применять во время работы водителям транспортных средств и лицам, работа которых связана с повышенной концентрацией внимания, поскольку возможно развитие сонливости.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Допустимо сочетание препарата с кофеином, парацетамолом, метоклопрамидом, пизотифеном, рифампицином и пропранололом.

Противопоказан одновременный приём эрготамина, производных эрготамина, суматриптина, наратриптина или других агонистов рецепторов 5HT_{1B/1D}.

Пациентам, которые применяют ингибиторы МАО-А, принимать золмитриптан рекомендуется в дозе не более 5 мг в сутки. Препараты не должны применяться одновременно во время приёма моклобемида в дозе выше 150 мг дважды в сутки.

Пациентам, которые принимают циметидин, принимать золмитриптан рекомендуется в дозе не более 5 мг в сутки. Исходя из общего профиля взаимодействия, нельзя исключать возможность взаимодействия со специфическими ингибиторами CYP 1A2. Поэтому во время применения подобных соединений, таких как флуоксамин и хинолоны (например, ципрофлоксацин), дозировки также рекомендуется снижать.

С точки зрения фармакокинетики, селегилин (ингибитор МАО-В) и флуоксетин (СИОЗС) не взаимодействуют с золмитриптаном.

После одновременного применения триптанов и селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (СИОЗС) или ингибиторов обратного захвата серотонина и норадреналина (ИОЗСиН) может развиться серотониновый синдром. Если одновременное применение золмитриптина и СИОЗС или ИОЗСиН является клинически оправданным, рекомендуется провести соответствующее обследование пациента, особенно в начале лечения, с увеличением дозы или применением другого серотонинергического средства. Подобно другим агонистам рецепторов 5HT_{1B/1D}, золмитриптан может замедлять всасывание других лекарственных средств.

КОНТРОЛЬНЫЙ

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Противомигренозное средство. Является селективным агонистом рекомбинантных 5-HT_{1B/1D}-рецепторов серотонина сосудов человека. Обладает умеренным сродством с серотониновыми 5-HT_{1A}-рецепторами, не имеет существенной аффинности или фармакологической активности по отношению к 5HT₂-, 5HT₃-, 5HT₄-серотониновым рецепторам, α₁-, α₂-, β₁-адрениретическим рецепторам, H₁-, H₂-гистаминовым рецепторам, M-холиновым рецепторам, D₁-, D₂-дофаминергическим рецепторам. Препарат вызывает вазоконстрикцию преимущественно краиальных сосудов, блокирует высвобождение нейропептидов, в частности вазоактивного интестинального пептида, который является основным эффекторным трансмиттером рефлекторного возбуждения, вызывающего вазодилатацию, которая лежит в основе патогенеза мигрени. Приостанавливает развитие приступа мигрени без прямого аналгетического действия. Наряду с купированием мигренозного приступа ослабляет тошноту, рвоту (особенно при левосторонних атаках), фото- и фонофобию. В дополнение к периферическому действию оказывает влияние на центры ствола головного мозга, связанные с мигренью, что объясняет устойчивый повторный эффект при лечении серии из нескольких приступов мигрени у одного пациента. Высокоэффективен в комплексном лечении мигренозного статуса (серии из нескольких тяжелых, следующих один за другим приступов мигрени продолжительностью 2-5 суток). Устраняет мигрень, ассоциированную с менструацией. Высокие дозы оказывают седативное действие и вызывают сонливость.

Действие препарата развивается через 15-20 минут и достигает максимума через час после приема. Максимальный эффект наблюдается при приеме во время развития приступа.

Фармакокинетика. При пероральном приеме хорошо всасывается в пищеварительном тракте. Абсорбция препарата не зависит от приема пищи. Средняя абсолютная биодоступность составляет около 40 %. Связывание с белками плазмы – 25 %. Время достижения максимальной концентрации составляет 1 час, терапевтическая концентрация в плазме поддерживается в течение последующих 4-6 часов. При повторном приеме кумуляции препарата не наблюдается. Подвергается интенсивной биотрансформации в печени с образованием N-десметилпроизводного, обладающего в 2-6 раз большей фармакологической активностью, чем исходное соединение, и ряда неактивных метаболитов. Выводится из организма преимущественно почками в виде метаболитов, около 30 % – кишечником в неизмененном виде. Известны три основных метаболита золмитриптана: индолуксусная кислота (основной метаболит в плазме и моче), N-оксид- и N-десметиланалоги. N-десметилированный метаболит – активный, а два других метаболита – неактивные. Средний период полувыведения (T_{1/2}) золмитриптана составляет 2,5-3 часа. У женщин максимальная концентрация и биодоступность препарата выше, а общий клиренс ниже, чем у мужчин. У пациентов с умеренной и выраженной почечной недостаточностью почечный клиренс золмитриптана и его метаболитов в 7-8 раз меньше, по сравнению с таковыми у здоровых добровольцев, период полувыведения увеличивается на час (до 3-3,5 часа), в то время как биодоступность золмитриптана и его активного метаболита увеличивается лишь на 16 и 35 %. При печеночной недостаточности метabolizm золмитриптана снижается пропорционально её степени.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, покрытые плёночной оболочкой бледного коричнево-жёлтого цвета.

Срок годности. 3 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения.

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 2 или 10 таблеток в блистере. По 1 блистеру, вложенному в пачку.

КОНТРОЛЬНА

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Фармак».

Местонахождение. Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 63.

Дата последнего пересмотра. 23.09.2013.

КОНТРОЛЬНЫЙ