

## ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

### ЗОЛМІГРЕН® ( ZOLMIGREN )

#### **Загальна характеристика:**

**міжнародна та хімічна назви:** zolmitriptan (золмітриптан); (4S)-4-[[3-[2-(диметиламіно) етил]-1H-індол-5-ил]метил]-2-оксазолідинон;

**основні фізико-хімічні властивості:** таблетки круглої форми, з двоопуклою поверхнею, вкриті плівковою оболонкою блідого коричнево-жовтого кольору;

**склад:** 1 таблетка містить золмітриптану 0,0025 г ( 2,5 мг);

**допоміжні речовини:** лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна 102, натрію крохмальгліколят, магнію стеарат, Sepifilm 752 Blanc або Spectrablend White, заліза оксид жовтий.

**Форма випуску.** Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби, що застосовуються при мігрені. Селективні агоністи 5HT<sub>1</sub>-рецепторів серотоніну. Золмітриптан. Код АТС N02C C03.

**Фармакологічні властивості.** *Фармакодинаміка.* Протимігренозний засіб. Є селективним агоністом рекомбінантних 5-HT<sub>1B/1D</sub>-рецепторів серотоніну судин людини. Має помірну спорідненість із серотоніновими 5-HT<sub>1A</sub>-рецепторами, не має суттєвої афінності або фармакологічної активності щодо 5HT<sub>2</sub>-, 5HT<sub>3</sub>-, 5HT<sub>4</sub>-серотонінових рецепторів,  $\alpha_1$ -,  $\alpha_2$ -,  $\beta$ -адренергічних рецепторів, H<sub>1</sub>-, H<sub>2</sub>-гістамінових рецепторів, М-холінових рецепторів, D<sub>1</sub>-, D<sub>2</sub>-дофамінергічних рецепторів. Препарат викликає вазоконстрикцію, переважно краніальних судин, блокує вивільнення нейропептидів, зокрема вазоактивного інтестинального пептиду, який є основним ефекторним трансмітером рефлекторного збудження, що викликає вазодилатацію, яка лежить в основі патогенезу мігрені. Призупиняє розвиток нападу мігрені без прямої аналгетичної дії. Поряд з купіруванням мігренозного нападу послаблює нудоту, блювання (особливо при лівосторонніх атаках), фото- і фонофобію. На доповнення до периферичної дії справляє вплив на центри стовбура головного мозку, пов'язані з мігренню, що пояснює стійкий повторний ефект при лікуванні серії з кількох нападів мігрені в одного пацієнта. Високоєфективний у комплексному лікуванні мігренозного статусу (серії з кількох тяжких, наступаючих один за одним нападів мігрені тривалістю 2-5 діб). Усуває мігрень, асоційовану з менструацією. Високі дози справляють седативну дію і викликають сонливість.

Дія препарату розвивається через 15-20 хвилин і досягає максимуму через годину після прийому. Максимальний ефект спостерігається при прийомі під час розвитку нападу.

*Фармакокінетика.* При пероральному прийомі добре всмоктується у травному тракті. Абсорбція препарату не залежить від приймання їжі. Середня абсолютна біодоступність становить приблизно 40%. Зв'язування з білками плазми – 25%. Час досягнення макси-

мальної концентрації становить 1 годину, терапевтична концентрація в плазмі підтримується протягом наступних 4-6 годин. При повторному прийомі кумуляції препарату не спостерігається. Підлягає інтенсивній біотрансформації у печінці з утворенням N-десметилпохідного, що має у 2-6 разів більшу фармакологічну активність, ніж первинна сполука, і ряду неактивних метаболітів. Виводиться з організму переважно нирками у вигляді метаболітів, близько 30% - кишечником у незміненому вигляді. Відомі три основних метаболіти золмітриптану: індоліоцтова кислота (основний метаболіт у

плазмі і сечі), N-оксид- і N-десметиланалоги. N-десметилований метаболіт – активний, а два інші метаболіти - неактивні. Середній період напіввиведення ( $T_{1/2}$ ) золмігріптану становить 2,5-3 години. У жінок максимальна концентрація і біодоступність препарату вище, а загальний кліренс нижче, ніж у чоловіків. У пацієнтів з помірною і вираженою нирковою недостатністю нирковий кліренс золмігріптану і його метаболітів у 7-8 разів менше порівняно з такими у здорових добровольців, період напіввиведення збільшується на годину (до 3-3,5 години), тоді як біодоступність золмігріптану і його активного метаболіту збільшується лише на 16 і 35 %.

**Показання для застосування.** Зняття нападу мігрені з аурою (зорові, слухові, рухові і психічні розлади) і без аури.

**Спосіб застосування та дози.** Препарат не призначений для застосування з метою профілактики мігренозного нападу. Золмігрен рекомендується застосовувати якомога раніше після виникнення нападу мігрені.

Дорослим призначають по 1 таблетці (2,5 мг золмігріптану). За відсутності ефекту або при рецидиві болю можливий повторний прийом 1 таблетки. За необхідності повторна доза може прийматися не раніше, ніж через 2 години після першої дози. При недостатній ефективності дози 2,5 мг допускається збільшення разової дози до 5 мг (вища разова доза). Вища добова доза – 15 мг.

Для пацієнтів з легкими і помірними порушеннями функції печінки коригування дози не потребується. Для пацієнтів з тяжкими порушеннями функції печінки добова доза препарату не повинна перевищувати 5 мг.

**Побічна дія.** *З боку травної системи:* нудота, сухість у роті.

*З боку центральної і периферичної нервової системи:* запаморочення, сонливість, порушення чутливості, відчуття важкості і стискання у горлі, шиї, кінцівках і грудях, парестезії, дизестезії.

*З боку кістково-м'язової системи:* міалгія, м'язова слабкість.

*З боку серцево-судинної системи:* транзиторне підвищення артеріального тиску.

*Інші:* відчуття тепла, астенія.

Побічні реакції звичайно носять легкий або помірно транзиторний характер, не частішають після прийому повторних доз і минають самостійно (без лікування).

**Протипоказання.** Тяжка артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця, ангіоспастична стенокардія, тяжкі порушення функції печінки, дитячий і літній (старше 65 років) вік, підвищена індивідуальна чутливість до компонентів препарату.

**Передозування.** *Симптоми:* у добровольців, які приймали одноразово золмігріптан у дозі 50 мг, спостерігався седативний ефект.

*Лікування:* промивання шлунка, застосування активованого вугілля, симптоматична терапія, у т.ч. забезпечення прохідності дихальних шляхів, моніторинг і підтримання функцій серцево-судинної системи. Специфічного антидоту немає.

**Особливості застосування.** Препарат не призначений для профілактики нападів мігрені.

Перед початком лікування необхідно детальне неврологічне обстеження для виключення органічної патології центральної нервової системи, а також оцінка стану серцево-судинної системи.

Препарат не слід застосовувати під час роботи водіям транспортних засобів і особам, робота яких пов'язана з підвищеною концентрацією уваги, оскільки можливий розвиток сонливості.

*У період вагітності і годування груддю* Золмігрен застосовують тільки у тому випадку, якщо можливий терапевтичний ефект для матері перевищує потенціальний ризик для плода. Немає даних

Сторінка 3 з 3. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України стосовно проникнення золмітриптану в грудне молоко. Тому необхідно з обережністю призначати Золмігрен жінкам, які годують груддю.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами.** Не рекомендується одночасне застосування з іншими препаратами з групи агоністів 5-HT<sub>1B/1D</sub> γ-рецепторів.

Припустимо поєднання препарату з протимігренозними засобами іншого механізму дії (з ерготаміном, дигідроерготаміном, пізотифеном) і аналгетиками (з парацетамолом і ін.).

При сумісному прийомі з моклобемідом біодоступність золмітриптану збільшується, у зв'язку з чим для пацієнтів, які приймають моклобемід, рекомендована добова доза золмітриптану не повинна перевищувати 7,5 мг.

При сумісному прийомі з циметидином період напіввиведення і біодоступність золмітриптану збільшується, у зв'язку з чим для пацієнтів, які приймають циметидин, рекомендована добова доза золмітриптану не повинна перевищувати 5 мг.

Не можна виключити можливості взаємодії золмітриптану з інгібіторами ізоферменту CYP1A2 цитохрому P<sub>450</sub>. Виходячи з цього, при сумісному застосуванні золмітриптану з препаратами, метаболізм яких відбувається за участі зазначеного ферменту, добова доза не повинна перевищувати 5 мг.

**Умови та термін зберігання.** Зберігати у недоступному для дітей, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Термін придатності – 2 роки.

**Умови відпуску.** За рецептом.

**Упаковка.** По 2 таблетки у контурній чарунковій упаковці; по 1 контурній чарунковій упаковці в пачці.

**Виробник.** ВАТ "Фармак".

**Адреса.** Україна, 04080, м. Київ, вул. Фрунзе, 74.