

[Инструкция Рапіміг таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 5 мг №12 \(6x2\)](#)

УВАГА! Уся інформація узята з відкритих джерел і надається виключно в ознайомлювальних цілях.

## Рапіміг таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 5 мг №12 (6x2)



**Діюча речовина:** Золмітриптан

**Лікарська форма:** Таблетки

**Фармакотерапевтична група:** Серотонінергические препарати.

### Склад

*діюча речовина:* zolmitriptan (золмітриптан);

1 таблетка містить золмітриптану 2,5 або 5 мг;

*допоміжні речовини:* целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), магнію стеарат, лактоза ангідрит, барвник для таблеток 2,5 мг - Opadry II Yellow 57U32675; барвник для таблеток 5 мг - Opadry II Pink 57U34477.

### Лікарська форма

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

### Фармакотерапевтична група

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

### Показання

Лікування нападів мігрені, які супроводжуються аурою і без аури.

## Протипоказання

- Підвищена чутливість до компонентів препарату.
- Тяжка артеріальна гіпертензія, а також помірне неконтрольоване підвищення тиску.
- Ангіоспастична стенокардія.
- Ішемічна хвороба серця.
- Літній (старше 65 років) вік.
- Інфаркт міокарда в анамнезі.
- Стенокардія Принцметала (коронароспазм).
- Інсульт та мінуща ішемічна атака (МІА) в анамнезі.
- Кліренс креатиніну нижче 15 мл/хв.
- Синдром WPW та аритмії, асоційовані з додатковими шляхами проведення.

## Спосіб застосування та дози

Рапіміг рекомендується застосовувати якомога раніше після виникнення нападу мігрені, хоча ефективність препарату не залежить від того, через який час після початку нападу була прийнята таблетка.

Таблетку слід ковтати не розжовуючи та запиваючи рідиною.

Рекомендована доза Рапімігу для зняття мігренового нападу - 1 таблетка (2,5 мг). За відсутності ефекту або при рецидиві болю можливий повторний прийом 1 таблетки (2,5 мг). За необхідності повторну дозу можна приймати 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 не повинна перевищувати 10 мг.

### *Печінкова недостатність*

Для пацієнтів з легкими і помірними порушеннями функції печінки немає потреби коригувати дозу. Для пацієнтів з тяжкими порушеннями функції печінки добова доза препарату не повинна перевищувати 5 мг.

### *Ниркова недостатність*

При кліренсі креатиніну понад 15 мл/хв дозу коригувати не потрібно.

## Побічні реакції

Рапіміг добре переноситься. Побічні ефекти звичайно носять легкий характер, як правило, є мінущими, з'являються протягом чотирьох годин після прийому препарату, не частішають після його повторного застосування та зникають спонтанно без жодного додаткового лікування.

За частотою виникнення побічні ефекти класифікуються таким чином: дуже поширені: ( $\geq 1/10$ ); поширені ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ); непоширені ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ ); рідко поширені ( $\geq 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ).

### *З боку серцево-судинної системи*

*Поширені:* відчуття серцебиття.

*Непоширені:* тахікардія, незначне підвищення артеріального тиску.

*Рідко поширені:* інфаркт міокарда, стенокардія напруження, коронароспазм.

*З боку центральної та периферичної нервової системи*

*Поширені:* порушення чутливості, запаморочення, посилення головного болю, гіперестезії; парестезії; сонливість, відчуття жару.

*З боку травної системи*

*Поширені:* біль у животі, нудота, блювання; сухість у роті.

*Рідко поширені:* ішемія або інфаркт (наприклад, інтестинальна ішемія, інтестинальний інфаркт, інфаркт селезінки), що може проявлятися як діарея з кров'ю або біль у черевній порожнині.

*З боку сечостатевої системи*

*Непоширені:* поліурія, часте сечовипускання.

*Рідко поширені:* невідкладні позиви до сечовипускання.

*З боку кістково-м'язової системи*

*Поширені:* м'язова слабкість, біль у м'язах.

*Загальні розлади*

*Поширені:* астенія; відчуття важкості і стискання у горлі, шиї, грудній клітці та кінцівках.

*З боку імунної системи*

*Непоширені:* реакції гіперчутливості, включаючи кропив'янку, набряк Квінке й анафілактичні реакції.

Певні симптоми можуть належати самій мігрені.

## **Передозування**

У разі передозування слід спостерігати за пацієнтом принаймні 15 годин або до зникнення симптомів чи ознак.

*Лікування.* Промивання шлунка, застосування активованого вугілля. Терапія симптоматична. У разі необхідності слід забезпечити моніторинг серцево-судинної системи. Специфічного антидоту немає.

## **Застосування у період вагітності або годування груддю**

У період вагітності і годування груддю Рапіміг застосовують тільки у тому випадку, коли можливий терапевтичний ефект для матері перевищує потенційний ризик для плода або дитини.

## Діти

Не рекомендується призначати Рапіміг дітям віком до 18 років через відсутність даних щодо безпеки й ефективності його застосування.

## Особливості застосування

Рапіміг не призначений для профілактики нападів мігрені.

Препарат слід застосовувати лише у випадках, коли точно встановлено діагноз мігрені. Перед початком лікування головного болю у пацієнтів, у яких раніше мігрень не діагностувалася, чи пацієнтів, схильних до мігрені, у яких спостерігаються атипові симптоми, слід виключити інші неврологічні стани. Рапіміг не слід приймати при геміплегічній, базилярній мігрені.

У пацієнтів, що приймають агоністи 5HT<sub>1B/1D</sub>, повідомляють про можливість виникнення інсульту та інших побічних церебрально-васкулярних випадків. Слід зазначити, що в осіб, схильних до мігрені, можуть з'явитися певні симптоми, пов'язані з церебро-васкулярною недостатністю судин головного мозку.

Рапіміг не слід призначати пацієнтам, які страждають на симптоматичний синдром Вольфа-Паркінсона-Уайта чи аритмії, пов'язані з іншими додатковими серцевими провідними шляхами.

У поодиноких випадках, так само, як і при застосуванні інших агоністів 5HT<sub>1B/1D</sub>, повідомляють про коронарний спазм, напади стенокардії та інфаркт міокарда. При наявності факторів, що сприяють розвитку ішемічної хвороби серця (наприклад, тютюнопаління, підвищений артеріальний тиск, гіперліпідемія, цукровий діабет, спадковість), Рапіміг слід призначати лише після обстеження пацієнта на наявність захворювань з боку серцево-судинної системи.

У деяких пацієнтів після прийому золмітриптану може з'явитись відчуття важкості, тиску чи стискання у ділянці серця. При появі болю у грудній клітці чи симптомів, характерних для ішемічної хвороби серця, застосування Рапімігу слід припинити та провести обстеження пацієнта.

У пацієнтів як з підвищенням артеріального тиску в анамнезі, так і з нормальним артеріальним тиском повідомляють про минуле підвищення артеріального тиску. Дуже рідко таке підвищення артеріального тиску пов'язане із серйозними клінічними проявами. Застосовувати Рапіміг слід у дозі, що не перевищує рекомендовану.

Пацієнтам, які страждають на фенілкетонурію, необхідно повідомити, що Рапіміг містить фенілаланін (компонент аспартаму). Кожна таблетка 2,5 мг містить 4 мг фенілаланіну, а кожна таблетка 5 мг – 8 мг фенілаланіну.

## Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами

Препарат чинить седативну дію, тому його не рекомендується застосовувати під час роботи водіям транспортних засобів і особам, робота яких пов'язана з підвищеною концентрацією уваги.

## Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Припустиме поєднання препарату з кофеїном, ерготаміном, дигідроерготаміном,

парацетамолом, метоклопрамідом, пізотифеном, рифампіцином і пропранололом.

Між золмітриптаном і ерготаміном не спостерігається взаємодії. Оскільки теоретично може зрости ризик виникнення коронароспазму, Рапіміг рекомендується приймати не раніше ніж через 24 години після застосування препаратів із вмістом ерготаміну. І навпаки, препарат із вмістом ерготаміну рекомендується приймати не раніше ніж через 6 годин після застосування Рапімігу.

Не рекомендується призначати Рапіміг одночасно з іншими 5-НТ<sub>1B/1D</sub>-агоністами.

Після прийому моклобеміду, специфічного інгібітору MAO-A, спостерігалось незначне збільшення (26 %) AUC (площі під кривою «концентрація-час») для золмітриптану та триразове збільшення AUC для активного метаболіту. Тому пацієнтам, які застосовують інгібітор MAO-A, приймати золмітриптан рекомендується в дозі не більше 5 мг на добу. Препарати не повинні застосовуватися одночасно при прийомі моклобеміду в дозах понад 150 мг двічі на добу.

Після прийому циметидину, загального інгібітору P<sub>450</sub>, період напіввиведення золмітриптану зростає на 44 %, а AUC - на 48 %. Крім того, циметидин подвоює період напіввиведення й AUC активного, N-диметильованого метаболіту (183C91). Пацієнтам, які застосовують циметидин, приймати золмітриптан рекомендується в дозі не більше 5 мг на добу. Виходячи із загального профілю взаємодії, не можна виключати можливість взаємодії зі специфічними інгібіторами CYP 1A2. Тому при застосуванні подібних сполук, таких як флувоксамін і хінолони (наприклад, ципрофлоксацин), дозування так само рекомендується зменшувати.

З погляду фармакокінетики, селегілін (інгібітор MAO-B) і флуоксетин (CІЗЗС) із золмітриптаном не взаємодіють.

Після одночасного застосування триптанів і селективних інгібіторів зворотного захоплення серотоніну (CІЗЗС) чи інгібіторів зворотного захоплення серотоніну і норадреналіну (CІЗЗСiН) повідомляють про появу серотонінового синдрому (включаючи зміну психічного стану, нервово-м'язові порушення, такі як акатизія, двосторонній симптом Бабінського, епілептиформні напади, порушення координації, міоклонії, горизонтальний та вертикальний ністагм, опістотонус, парестезії, ригідність м'язів, тремор). Ці реакції можуть бути тяжкими. Якщо одночасне застосування золмітриптану та CІЗЗС і CІЗЗСiН є клінічно доцільним, рекомендується провести відповідне обстеження пацієнта, особливо на початку лікування, зі збільшенням дози або застосуванням іншого серотонінергічного засобу.

Подібно до інших агоністів рецепторів 5НТ<sub>1B/1D</sub>, золмітриптан може уповільнювати всмоктування інших лікарських засобів.

## **Фармакологічні властивості**

*Фармакодинаміка.* Золмітриптан є селективним агоністом рекомбінантних 5-НТ<sub>1B/1D</sub>-рецепторів серотоніну судин людини. Має помірну спорідненість із серотоніновими 5-НТ<sub>1A</sub>-рецепторами, не має суттєвої афінності або фармакологічної активності щодо 5НТ<sub>2</sub>-, 5НТ<sub>3</sub>-, 5НТ<sub>4</sub>-серотонінових рецепторів, α<sub>1</sub>-, α<sub>2</sub>-, β<sub>1</sub>-адренергічних рецепторів, H<sub>1</sub>-, H<sub>2</sub>-гістамінових рецепторів, M-холінових рецепторів, D<sub>1</sub>-, D<sub>2</sub>-дофамінергічних рецепторів.

Препарат спричиняє вазоконстрикцію, переважно краніальних судин, блокує вивільнення нейропептидів, зокрема вазоактивного інтестинального пептиду, який є основним ефекторним трансмітером рефлекторного збудження, що спричиняє 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 фонophobia. На доповнення до периферичної дії впливає на центри стовбура головного мозку, пов'язані з мігренню, що пояснює стійкий повторний ефект при лікуванні серії з кількох нападів мігрени в одного пацієнта. Високоєфективний у комплексному лікуванні мігренозного статусу (серії з кількох тяжких нападів мігрени тривалістю 2 - 5 діб, що настають один за одним). Усуває мігрень, асоційовану з менструацією. Високі дози чинять седативну дію і спричиняють сонливість.

Дія препарату починається з першої години після прийому та досягає максимуму між 2 та 4 годинами після прийому. Максимальний ефект спостерігається при прийомі під час розвитку нападу.

*Фармакокінетика.* При пероральному прийомі добре всмоктується (принаймні на 64 %) у травному тракті. Абсорбція препарату не залежить від приймання їжі. Середня абсолютна біодоступність становить приблизно 40 %. Зв'язування з білками плазми - 25 %. Час досягнення максимальної 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.

Було встановлено AUC і  $C_{max}$  (максимальна концентрація) для золмітриптану і його активного метаболіту від 2,5 до 50 мг. За даними клінічних досліджень, 75 %  $C_{max}$  досягається протягом години, після цього дана концентрація золмітриптану підтримується протягом 4 - 5 годин. Поглинання золмітриптану не залежить від прийому їжі.

Виведення золмітриптану зумовлюється, в основному, процесами біотрансформації в печінці, після чого відбувається виведення метаболітів із сечею. Існують три основні метаболіти: індолоцтова кислота (основний метаболіт у плазмі і сечі), N-оксид- і N-десметиланалоги. Активним є лише N-десметилований метаболіт. Плазмові концентрації N-десметилованого метаболіту приблизно в два рази нижчі, ніж концентрації вихідної лікарської речовини, а отже, він може посилити терапевтичну дію золмітриптану. При пероральному одноразовому застосуванні понад 60 % виводиться із сечею (головним чином, у формі метаболіту - індолоцтової кислоти), а приблизно 30 % - з калом у незміненому вигляді. Після внутрішньовенного введення загальний плазмовий кліренс у середньому становить приблизно 10 мл/хв/кг, з яких чверть припадає на нирковий кліренс. Нирковий кліренс перевищує швидкість клубочкової фільтрації, що свідчить про секрецію в ниркових каналцях. Об'єм розподілу після внутрішньовенного введення становить 2,4 л/кг. Зв'язування золмітриптану та N-десметилованого метаболіту з протеїнами плазми низьке (приблизно 25 %). Період напіввиведення золмітриптану в середньому становить 2,5 - 3 години. Час напіввиведення його метаболітів є подібним, що свідчить про те, що їх виведення обмежується швидкістю утворення.

Нирковий кліренс золмітриптану та всіх його метаболітів у пацієнтів, що страждають на помірну і тяжку ниркову недостатність, знижений (у 7 - 8 разів), хоча AUC (площа під кривою «концентрація/час») вихідної сполуки й активного метаболіту лише незначно збільшилася (16 і 35 % відповідно), а час напіввиведення збільшився на 1 годину і досягав 3 - 3,5 години.

Метаболізм золмітриптану знижується при печінковій недостатності пропорційно його ступеню. У добровольців з тяжкою печінковою недостатністю і здорових добровольців AUC і  $C_{max}$  золмітриптану збільшуються на 226 і 50 % відповідно, при цьому час напіввиведення в перших

збільшується до 12 годин. Скорочується час перебування в організмі метаболітів, включаючи активний метаболіт.

## **Основні фізико-хімічні властивості**

таблетки 2,5 мг – блідо-жовтого кольору, круглі, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою з написом «ZL2.5»;

таблетки 5 мг – блідо-рожевого кольору, круглі, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою з написом «ZL5».

## **Термін придатності**

2 роки.

## **Умови зберігання**

Зберігати в сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці!

*Не застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці!*

## **Упаковка**

По 2 таблетки у блістері, в картонній коробці; по 6 таблеток у блістері, по 1 або 2 блістера в картонній коробці.

## **Категорія відпуску**

За рецептом.

## **Виробник**

Актавіс ЛТД, Мальта.

## **Місцезнаходження**

В16, Будинок Булебед Інд., м. Зейтун ZTN 08, Мальта.

Увага ! Текст опису препарату "Рапіміг таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 5 мг №12 (6x2)" надано для загальної інформації та ознайомлення. Даний опис є спрощеним варіантом офіційною анотації до ліків. Перед придбанням і використанням препарату обов'язково зверніться до лікаря і отримайте професійні рекомендації . Даний текст розміщений на порталі суто для ознайомлювальних цілей і не може слугувати приводом для самолікування. Тільки лікар може виносити рішення про призначення тих чи інших ліків, визначати дозу та графік прийому.