

Sumatriptan (Imigran® / Imitrex®)

Antimigraenicum, Selektywny agonista receptorów 5-HT₁ ATC: N 02 CC

3-(2-Dimetyloaminoetylo)-indol-5-ilo-N-metylometanosulfonamid CAS: 103628-46-2, GR 43175X

Pochodne : *Bursztynian sumatryptanu* ;GR 43175 CCAS: 103628-48-4SN 308

Wodorobursztynian sumatryptanu ;CAS: 103628-47-3

Działanie. Specyficzny i selektywny agonista receptorów 5-hydroksytryptaminowych-1 (serotoninowych, 5-HT₁), które znajdują się przede wszystkim w naczyniach krwionośnych zaopatrujących tkanki zewnątrz- i wewnątrzczaszkowe, np. opony mózgowo-rdzeniowe. Rozszerzenie tych naczyń jest prawdopodobnie przyczyną napadów migreny. Powodując wybiórczo skurcz tych naczyń, sumatryptan jest skuteczny w leczeniu migreny. Nie działa on na inne typy receptorów 5-HT. Działanie występuje po 10-15 min po wstrzyknięciu podskórnym i 30 min po podaniu doustnym. Po podaniu podskórnym biodostępność sumatryptanu wynosi 96%. Maksymalne stężenie w surowicy osiąga po 25 min. Okres połowicznego wydalania wynosi 2 h. Po podaniu doustnym sumatryptan jest szybko wchłaniany i po 45 min osiąga 70% maksym. stężenia w krwi. Całkowita biodostępność wynosi 14%. Z białkami krwi łączy się tylko w 14-21%. Jest wydalany przez nerki, przede wszystkim w postaci metabolitów, które nie działają na receptory 5-HT₁ ani 5-HT₂. Napady migreny oraz wiek pacjentów nie wpływają znacząco na farmakokinetykę sumatryptanu.

Wskazania. Sumatryptan jest stosowany w leczeniu napadów migreny (z aurą lub bez aury) oraz klasterowych bólów głowy. Sumatryptan jest równie skuteczny po podaniu zarówno na początku, jak i podczas napadu migreny.

Interakcje. Może być stosowany łącznie z: propranololem, flunaryzyną, dihydroergotaminą, pizotyfenem. Nie jest wskazane jednoczesne stosowanie sumatryptanu i ergotaminy (możliwość nasilonego skurczu naczyń) lub inhibitorów MAO. Nie ma dowodów na występowanie interakcji z etanolem.

Przeciwwskazania/Ostrzeżenia specjalne. Nie należy stosować w profilaktyce migreny lub klasterowych bólów głowy. Nadwrażliwość na sumatryptan. Nie zaleca się stosowania u pacjentów z ciężką postacią nadciśnienia tętniczego, z objawami choroby niedokrwiennej serca, anginą Prinzmetala, po przebytych zawałach serca oraz ostrożnie u osób z chorobami, które mogą wpływać na metabolizm, wydalanie i dystrybucję sumatryptanu (choroby nerek, wątroby). Nie zaleca się stosowania u osób powyżej 65. rż. *Ciąża (kat. C)*. Można stosować jedynie w wypadku, gdy korzyść dla matki przeważa nad potencjalnym zagrożeniem dla płodu (brak odpowiednio licznych i prawidłowo kontrolowanych badań u kobiet w ciąży). *Karmienie piersią*. W okresie stosowania leku należy przerwać karmienie piersią (sumatryptan przechodzi do mleka karmiących kobiet). *Dzieci*. Nie zaleca się stosowania (bezpieczeństwo stosowania i skuteczność leczenia nie zostały ustalone).

Działania niepożądane. Bóle w okolicy wstrzyknięcia, dzwonienie w uszach, mrowienie, swędzenie, uczucie ociężałości, napięcia w różnych częściach ciała, uderzenia gorąca, zawroty głowy, osłabienie, zmęczenie, senność. Objawy te są umiarkowanie nasilone i przemijające. Rzadko występują wymioty i nudności. Zaraz po podaniu leku obserwowano przemijający wzrost ciśnienia tętniczego. Po podaniu podskórnym nudności,

wymioty i osłabienie występowały rzadziej niż po podaniu doustnym, natomiast po wstrzyknięciach pojawiały się częściej uderzenia gorąca, dzwonienie w uszach, uczucie ciężkości i napięcia. U pacjentów z chorobą niedokrwienną serca podanie sumatryptanu dożylnie może wywołać skurcz naczyń wieńcowych. *Uwaga.* Podczas stosowania leku wyniki testów wątrobowych mogą być nieprawidłowe.

Dawkowanie. Napady migreny. Podskórnie 6 mg, dawkę można powtórzyć dopiero po upływie 1 h; maksym. dawka dobową wynosi 12 mg (dwa wstrzyknięcia po 6 mg). Doustnie 100 mg jako dawka początkowa, w razie konieczności można podać w ciągu doby najwyżej 3 razy po 100 mg. Donosowo 5 mg, 10 mg lub 20 mg, dawkę można powtórzyć po 2 h; maksym. dawka dobową wynosi 40 mg. Klasterowe bóle głowy - 6 mg podskórnie. Maksymalnie 2 razy na dobę po 6 mg z przerwą co najmniej 1 h.

Uwagi. Po napadzie migreny może wystąpić senność, dlatego nie należy prowadzić pojazdów mechanicznych i obsługiwać maszyn.

Preparaty proste :

- **Imigran®** (GlaxoSmithKline Export, GB): tabl. powł. 50 mg i 100 mg; strzykawki 6 mg w 0,5 mL - roztw. do wstrzyknięć s.c.; fiol. 0,1 mL - aerozol do nosa (0,1 mL zawiera 20 mg); czopki 25 mg. Preparat zawiera sumatryptan w postaci bursztynianu.
- **Imitrex®** (GlaxoSmithKline, USA): tabl. powł. 25 mg i 50 mg; fiol., ampułkostrzykawki, wstrzykiwacze i wkłady do wstrzykiwaczy - roztwór do stosowania s.c. (0,5 mL zawiera 6 mg); opak. aerozolowe 5 mg i 20 mg - roztwór do rozpylania do nosa (1 dawka zawiera odpowiednio 5 mg lub 20 mg). Wszystkie postaci preparatu, oprócz roztworu do rozpylania, zawierają bursztynian sumatryptanu. Dawki podano w przeliczeniu na sumatryptan.
- **Sumamigren®** (Polpharma, PL): tabl. powł. 25 mg, 50 mg i 100 mg.

Rozpoznanie, diagnozy i dobór leków należą tylko i wyłącznie do lekarzy!!!

Eksperymenty z lekami na własną rękę zagrażają zdrowiu i życiu pacjenta!!!