

Ryzatryptan (Maxalt®)

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

N,N-Dimetylo-5-(1H-1,2,4-triazol-1-ilometylo)-1H-indolo-3-etenamina CAS: 144034-80-0

Pochodne : *Benzoesan ryzatryptanu ;MK-462CAS: 145202-66-0MK-0462*

Działanie. Selektywny agonista receptorów serotoninergicznych 5-HT_{1B} i 5-HT_{1D}. Powoduje skurcz naczyń krwionośnych wewnątrzczaszkowych, które ulegają rozszerzeniu podczas napadu migreny. Ponadto jego działanie przeciwmigrenowe może być związane z działaniem na nerw trójdzielny oraz hamowaniem wydzielania niektórych neuropeptydów związanych z powstawaniem wrażeń bólowych. Jest szybko i całkowicie wchłaniany po podaniu doustnym. Średnia dostępność biologiczna ryzatryptanu wynosi ok. 40-45%. Największe stężenie w osoczu osiąga m.w. po 1-1,5 h. Pokarm opóźnia jego wchłanianie. W niewielkim stopniu (ok. 14%) wiąże się z białkami osocza. W ustroju ulega deaminacji oksydacyjnej przy udziale MAO-A do nieczynnej pochodnej indolowej kwasu octowego. Ponadto w niewielkiej ilości powstaje czynny metabolit - N-monodemetyloryzatryptan - o działaniu i właściwościach farmakokinetycznych zbliżonych do właściwości ryzatryptanu. Inne metabolity są nieczynne. Okres półtrwania wynosi ok. 2-3 h. Jest wydalany gł. przez nerki w postaci pochodnej indolowej (51%), postaci niezmienionej (14%) i innych metabolitów. Mniej niż 1% jest wydalane w postaci czynnego metabolitu.

Wskazania. Ryzatryptan jest stosowany w leczeniu ostrych napadów rozpoznanej migreny z aurą lub bez niej.

Interakcje. Inhibitory MAO mogą zwiększać stężenie ryzatryptanu i jego czynnego metabolitu w osoczu i nie należy ich stosować jednocześnie. Propranolol zwiększa stężenie ryzatryptanu w osoczu. Nadolol i metoprolol nie wpływają na to stężenie. Selektynne inhibitory zwrotnego wychwytu serotoniny teoretycznie mogą spowodować wystąpienie zespołu serotoninowego (osłabienie, wzmożenie odruchów, zaburzenia koordynacji). Nie obserwowano takich interakcji z paroksetyną.

Przeciwwskazania/Ostrzeżenia specjalne. Nadwrażliwość na ryzatryptan. Jednoczesne stosowanie z inhibitorami MAO oraz przed upływem 2 tyg. od zakończenia takiego leczenia. Ciężka niewydolność wątroby lub nerek. Przebyty udar mózgu lub przemijający epizod niedokrwienności mózgu. Umiarkowane i ciężkie nadciśnienie tętnicze lub nie leczone łagodne nadciśnienie tętnicze. Choroba niedokrwienności serca, dusznica Prinzmetal'a. Choroby naczyń obwodowych. Migrena połowiczoporażna lub podstawna. Nie należy podawać łącznie z innymi agonistami receptorów serotoninowych 5-HT_{1B} i 5-HT_{1D} (np. sumatryptan) oraz osobom, które w ciągu ostatnich 24 h przyjęły ergotaminę lub dihydroergotaminę lub przyjmują metysergid w celu zapobieżenia napadom migreny. Ryzatryptanu nie należy stosować w innych niż migrenowe bólach głowy oraz w profilaktyce migreny. *Ciąża (kat. C)*. Stosować jedynie w wypadku, gdy korzyść dla matki przeważa nad potencjalnym zagrożeniem dla płodu (brak danych na temat bezpieczeństwa stosowania). *Karmienie piersią*. Wpływ ryzatryptanu na dziecko należy ograniczyć poprzez zaniechanie karmienia piersią przez 24 h od przyjęcia leku. *Dzieci*. Z powodu braku danych dotyczących tej grupy wiekowej nie należy stosować poniżej 18. rż.

Działania niepożądane. Najczęściej zgłaszanymi objawami były zawroty głowy, senność i osłabienie z uczuciem zmęczenia. Ponadto rzadziej mogą występować bóle brzucha, bóle w klatce piersiowej, kołatanie serca, przyspieszenie czynności serca, nudności, wymioty, suchość w ustach, biegunka, wzmożone pragnienie, bóle karku, sztywność mięśniowa, ociążałość grup mięśniowych, osłabienie mięśni, ból głowy, parestezje, obniżenie sprawności umysłowej, bezsenność, osłabienie czucia, drżenia, niezborność, nadmierna pobudliwość nerwowa, zawroty głowy, zaburzenia orientacji, uczucie przeszkody w gardle, duszność, napadowe zaczerwienienie skóry, świąd, pocenie się, zamazane widzenie, napady gorąca.

Dawkowanie. Zalecana dawka wynosi 10 mg doustnie. Dawkę można powtórzyć co najmniej po 2 h. W ciągu 24 h nie należy przyjmować więcej niż 2 dawki leku. Jeżeli lek był skuteczny podczas napadu migreny i w ciągu 24 h napad powtórzy się, można przyjąć następną dawkę, nie przekraczając maksym. dawki dobowej. Jeżeli pierwsza dawka okazała się nieskuteczna, nie należy przyjmować drugiej dawki podczas tego samego napadu bólu migrenowego. U osób leczonych jednocześnie propranololem oraz u osób z łagodną lub umiarkowaną niewydolnością wątroby lub nerek zaleca się stosowanie dawek o połowę mniejszych (5 mg).

Przedawkowanie. Może prowadzić do omdleń, zwolnienia czynności serca, zawrotów głowy, a także do wzrostu ciśnienia tętniczego i poważnych zaburzeń sercowo-naczyniowych. Należy wówczas usunąć lek z przewodu pokarmowego oraz prowadzić co najmniej 12-godz. nadzór kliniczny i EKG.

Uwagi. Ryzatryptan należy przyjmować co najmniej po 2 h od podania propranololu. Podczas migreny lub w wyniku zażycia ryzatryptanu mogą wystąpić zawroty głowy lub senność. W takich przypadkach nie należy prowadzić pojazdów mechanicznych lub obsługiwać maszyn.

Preparaty proste :

- **Maxalt®, ~ RPD** (Merck Sharp & Dohme, CH): tabl. 5 mg i 10 mg; tabl. (~ RPD) 5 mg i 10 mg (subst. liofiliz.). Preparat zawiera benzoesan ryzatryptanu. Dawki podano w przeliczeniu na ryzatryptan. U. Tabletki polyka się w całości i popija płynem. Tabletki RPD (szybko rozpuszczalne zawierające subst. liofiliz.) nie muszą być przyjmowane z płynem. Tabletki zawierają laktozę, dlatego nie powinny być podawane osobom z niedoborem laktazy. Tabletki RPD zawierają aspartam, dlatego nie powinny być podawane chorym na fenyloketonurię.

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

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