

Eletryptan (Relpax®)

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

3-[[[(2R)-1-Metylo-2-pirolidynylo]-metylo]-5-[2-(fenylosulfonylo)-etylo]-H-indol CAS: 143322-58-1, UK 116044

Pochodne :Bromowodorek eletryptanu ;CAS: 177834-92-3

Działanie. Selektywny agonista receptorów serotoninowych 5-HT_{1B} w naczyniach krwionośnych i 5-HT_{1D} w komórkach nerwowych. Wykazuje też powinowactwo do innych typów tych receptorów. Eletryptan działa podobnie jak sumatryptan. Po podaniu doustnym jest szybko i dobrze (w ponad 81%) wchłaniany w przewodzie pokarmowym. Osiąga największe stężenie w osoczu mw. po 1,5 h po podaniu. Podczas bólu migrenowego wchłanianie jest słabsze i wolniejsze i największe stężenie może być osiągnięte nawet w ciągu 2,8 h. Podanie eletryptanu po tłustym posiłku zwiększa wchłanianie leku. Całkowita dostępność biologiczna wynosi ok. 50%. Z białkami wiąże się mw. w 85%. Przemiany metaboliczne eletryptanu przebiegają z udziałem izoenzymu 3A4 układu enzymatycznego cytochromu P450 (CYP 3A4). Jeden z metabolitów powstałych w procesie N-metylacji jest czynny, jednak w nieznacznym stopniu wpływa na działanie lecznicze. Eletryptan przenika do mleka matki. Tylko ok. 10% leku jest eliminowane przez nerki. Okres półtrwania w fazie eliminacji wynosi ok. 4-5 h. Eletryptan zwiększa ciśnienie tętnicze, zwł. w przypadkach współistniejącej niewydolności nerek.

Wskazania. Eletryptan jest stosowany w leczeniu ostrego migrenowego bólu głowy z aurą lub bez aury u osób dorosłych od 18. do 65. rz. Nie stosuje się go w profilaktyce migreny.

Interakcje. Nie wolno stosować jednocześnie (tj. 24 h przed podaniem eletryptanu i do 24 h po jego podaniu) pochodnych ergotaminy oraz innych agonistów receptorów 5-HT₁. Nie można stosować wraz z lekami silnie hamującymi izoenzym CYP 3A4, np. ketokonazolem, itrakonazolem, erytromycyną, klarytromycyną, jozamycyną. Nie należy także stosować jednocześnie z inhibitorami proteaz, np. rytonawirem, indinawirem, nelfinawirem. Jednoczesne przyjmowanie preparatów ziołowych zawierających dziurawiec może nasilać występowanie działań niepożądanych. Kofeina zwiększa wzrost ciśnienia tętniczego wywołany przez eletryptan.

Przeciwwskazania/Ostrzeżenia specjalne. Nadwrażliwość na eletryptan. Ciężka niewydolność wątroby lub nerek. Ciężkie lub źle kontrolowane nadciśnienie tętnicze. Choroba wieńcowa. Niewydolność serca. Zaburzenia rytmu serca. Choroby naczyń obwodowych. Przebyte epizody niedokrwienne mózgu. Nie stosuje się w migrenie z objawami połowicznymi, migrenie okoporażnej lub podstawnej oraz w niemigrenowych bólach głowy. Bardzo ostrożnie stosuje się u osób z czynnikami ryzyka choroby wieńcowej (cukrzyca, nadciśnienie tętnicze, palenie papierosów, duże stężenie cholesterolu, wywiad rodzinny, wiek powyżej 40. rz. u mężczyzn, okres po menopauzie u kobiet). *Ciąża.* Nie ma danych na temat bezpieczeństwa stosowania w ciąży. *Karmienie piersią.* Zaleca się nie karmić piersią przez 24 h po zażyciu eletryptanu. *Dzieci.* Nie stosuje się.

Działania niepożądane. Może powodować skurcz naczyń wieńcowych i objawy niedokrwienia m. sercowego. Może powodować wzrost ciśnienia tętniczego. Spośród objawów niepożądanych często występują: osłabienie, dyskomfort w klatce piersiowej, ból głowy, brzucha, klatki piersiowej, gardła, dreszcze, uderzenia gorąca, kołatanie serca, przyspieszenie czynności serca, nudności, suchość w jamie ustnej, niestrawność, osłabienie lub

bóle mięśni, senność, zawroty głowy, dzwonięcie w uszach lub inne nieprawidłowe odczucia, uczucie sztywności, zaburzenia czucia, zapalenie gardła, nadmierne pocenie się. Rzadko występują: ogólne rozbicie, obrzęk twarzy, zaburzenia ukrwienia obwodowego, biegunka, brak łaknienia, zapalenie języka, bóle stawowe, drżenie, przeczulica, zaburzenia myślenia, pobudzenie, bezsenność, dezorientacja, niezdarność, zaburzenia osobowości, euforia, spowolnienie ruchowe, zaburzenia mowy, depresja, osłupienie, duszność, ziewanie, zapalenie błony śluzowej nosa, zaburzenia oddychania, świąd, wysypka, zaburzenia widzenia, częstomocz. Bardzo rzadko obserwowano wstrząs, zwolnienie czynności serca, zaparcia, zapalenie przełyku, powiększenie węzłów chłonnych, biochemiczne objawy uszkodzenia wątroby, pokrzywkę, zapalenie spojówek, bolesność sutków i bolesne miesiączkowanie.

Dawkowanie. Lek należy przyjąć jak najszybciej po wystąpieniu napadu migreny, ale nie w okresie aury. Zalecana dawka początkowa wynosi 40 mg. U osób z łagodną lub umiarkowaną niewydolnością nerek zalecaną dawką początkową jest 20 mg. Jeżeli mimo poprawy po pierwszej dawce ból powróci, można podać następną dawkę, jednak nie wcześniej niż po 2 h od przyjęcia pierwszej dawki. W razie braku poprawy w ciągu 2 h od przyjęcia pierwszej dawki nie należy przyjmować drugiej, ponieważ jest w takich przypadkach nieskuteczna. U chorych, u których dawka 40 mg okazała się nieskuteczna podczas poprzednich 2-3 napadów migreny, można zastosować dawkę 80 mg. Kolejnej dawki 80 mg nie należy przyjmować wcześniej niż po upływie 24 h, ponieważ maksym. dawka dobową wynosi 80 mg.

Uwagi. Podczas stosowania eletriptanu mogą wystąpić senność i zawroty głowy. Nie można wykluczyć, że te objawy są wywołane migreną. Niezależnie od przyczyny mogą zaburzać zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych.

Preparaty proste :

- **Relpax®** (Pfizer, B): tabl. powł. 20 mg i 40 mg (bromowodorek).

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

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