

Tabela 1.1.3.14. Niektóre dane farmakologiczne wybranych leków przeciwdepresyjnych

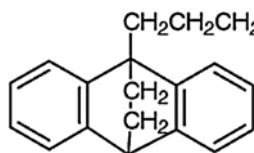
| | Wpływ na neuroprze- kaźnictwo* | | | Udział CYP 450 w metabolizmie** | Hamowanie izoen- zymów CYP 450 | Dawka maksy- malna (mg/dobę) | Okres pół- trwania (h) |
|--|-----------------------------------|-----|----|------------------------------------|-----------------------------------|---------------------------------|---------------------------|
| | NA | 5HT | DA | | | | |
| Inhibitory wychwyty NA i 5HT (selektywne) (SNRI) | | | | | | | |
| Milnacipran | +++ | +++ | | – | | 200 | ok. 8 |
| Wenlafaksyna | ++ | +++ | + | 2D6, (3A4) | 2D6, 2C9/10, 3A4 | 375 (forma ER 225) | 3–7 |
| Inhibitory wychwyty NA (NRI) | | | | | | | |
| Maprotylina | +++ | 0/+ | | 2D6 | | 225 | 12–108 |
| Reboksetyna | +++ | | | 3A4 | 3A4, 2D6 | 12 | 13 |
| Inhibitory wychwyty NA i DA (NDRI) | | | | | | | |
| Bupropion | + | 0/+ | ++ | (2D6 ?) | | 450 | 14–21 |
| Leki głównie o receptorowych mechanizmach działania** | | | | | | | |
| Mianseryna | ++ | ++ | 0 | 2D6, (3A4) | – | 120 | 12–29 |
| Mirtazapina | +++ | +++ | 0 | 2D6, 3A4, 1A2, 2C9 | 2D6, 1A3, 3A4 | 45 | 20–40 |
| Nefazodon | + | ++ | | 3A4, 2D6 | 1A2 (hydroksynefa- zodon 3A4) | 600 | 2–4 |
| Trazodon | + | ++ | | 2D6 | 3A4 | 600 | 3–9 |
| Leki o innych mechanizmach działania | | | | | | | |
| Tianeptyna | ? | ? | ? | (3A4) | | 37,5 | 2,5 |

* Działanie (wpływ): +++ silne, ++ umiarkowane, + słabe.

** Izoenzymy CYP-450 podane w nawiasach – wpływ znikomy lub mały, prawdopodobieństwo interakcji małe.

Uwaga: część danych dotyczących izoenzymów CYP-450 pochodzi z badań na zwierzętach doświadczalnych, niektóre z badań *in vitro*.

Mechanizm działania. W badaniach u zwierząt doświadczalnych wykazuje podstawowe cechy TLPD, jednak w przeciwieństwie do imipraminy ma uspokajający i hamujący wpływ na zachowanie agresywne szczurów i małp. Mechanizm działania jest wiązany z hamowaniem doneuronálnego wychwyty noradrenaliny. Wykazuje duże powinowactwo do receptora noradrenergicznego α_1 i α_2 , wpływ zaś na receptory histaminowe H_1 i H_2 oraz cholinergiczne jest słaby.



Struktura chemiczna maprotyliny.

Farmakokinetyka i metabolizm. Okres półtrwania około 45 h (zakres 12–108 h), wiązanie

z białkami – 88%. Metabolizowana przy udziale CYP 2D6.

Wskazania. Siła wpływu przeciwdepresyjnego i skuteczność maprotyliny są porównywalne z amitriptyliną lub imipraminą. Zdaniem większości autorów działanie „odhamowujące” zbliża ją do imipraminy. Wskazaniem do stosowania maprotyliny są stany depresyjne, zwłaszcza typu endogennego, w których zawiodły podstawowe leki przeciwdepresyjne.

Przeciwwskazania. Takie, jak w przypadku TLPD. Nie należy stosować maprotyliny u chorych z napadami drgawkowymi (w wywiadzie), z jaskrą z zamkniętym kątem przesączania, z przerostem gruczołu krokowego i zaburzeniami oddawania moczu, w okresie ciąży, karmienia piersią (zob. *Ogólne zasady stosowania*).

Środki ostrożności. Należy zachować dużą ostrożność w stosowaniu u chorych z zaburze-