

ТРЕЋА ГЕНЕРАЦИЈА АНТИЕПИЛЕПТИКА

проф. др Слободан Јанковић

Дефиниција треће генерације

Под трећом генерацијом антиепилептика се подразумевају лекови који су добили дозволу за коришћење 2008 године и касније

То су:

- Есликарбазепин
- Лакосамид
- Перампанел
- Руфинамид
- Стирипентол
- Ретигабин* - повучен из употребе 2016. године због токсичности

Бриварацетам

- Инхибира ослобађање екситаторних неуротрансмитера из пресинаптичких завршетака
- Везује се за протеин на везикулама нервних завршетака 2A (SV2A) и омета његово функционисање
- SV2A је гликопротеин који омогућава егзоцитозу везикула са неуротрансмитерима

Есликарбазепин

- То је про-лек који се брзо метаболише до активне форме С-ликарбазепина
- Инхибира волтажно-зависне натријумске канале, и тиме омета ослобађање неуротрансмитера

Лакосамид

- То је аминокиселина којој су додате функционалне групе
- Појачава инактивацију волтажно-зависних натријумских канала
- Инхибира колапсин, неуротрофни фактор који стимулише раст аксона и диференцијацију неурона, па тиме спречава ре-моделирање možданог ткива после трауме

Руфинамид

- Дериват триазола
- Продужава неактивно стање волтажно-зависних натријумских канала

Перампанел

- Делимично селективни, не-компетитивни антагониста АМПА рецептора за глутамат
- Смањује ексцитацију неурона који на себи имају АМПА рецепторе

Стирипентол

- То је алостерички модулатор ГАБА-А рецептора
- Појачава дејство ГАБА-е

Канабидиол

- Канабидиол блокира ЦБ1 и ЦБ2 рецепторе, али због тога не делује антиконвулзивно
- Активира 5HT1a рецепторе
- Инхибира ослобађање глутамата
- Инхибира поновно преузимање норадреналина, допамина и аденозина
- Стимулише глицинске рецепторе
- Стимулише и доводи до десензитизације јонских канала који доводе до пролазне промене потенцијала (ankyrin и vanilloid типови, тј. TRPA1, TRPV1 и TRPV2 рецептори)

Механизам дејства антиепилептика треће генерације у слици

