

Inibitori delle COMT (catecol-O-metiltransferasi)

COMT: enzimi, piccole proteine, presenti nel citoplasma di tutte le cellule del corpo umano. Sono presenti in maggior numero nel citoplasma delle cellule post-sinaptiche.

Cellula post-sinaptica: differiscono a seconda del segnale che devono trasmettere, per i neuroni dopaminergici sono le cellule muscolari.

Esse ricevono il segnale attraverso i neurotrasmettitori, come la DOPAMINA.

Questi enzimi sono coinvolti nel metabolismo centrale della Dopamina e in quello periferico della Levodopa.

Si può pertanto dedurre che inibendo la loro azione si ha un aumento della biodisponibilità sia di Dopamina endogena (cioè prodotta dai nostri neuroni dopaminergici) che di Levodopa che alcuni di noi assumono regolarmente con la terapia.

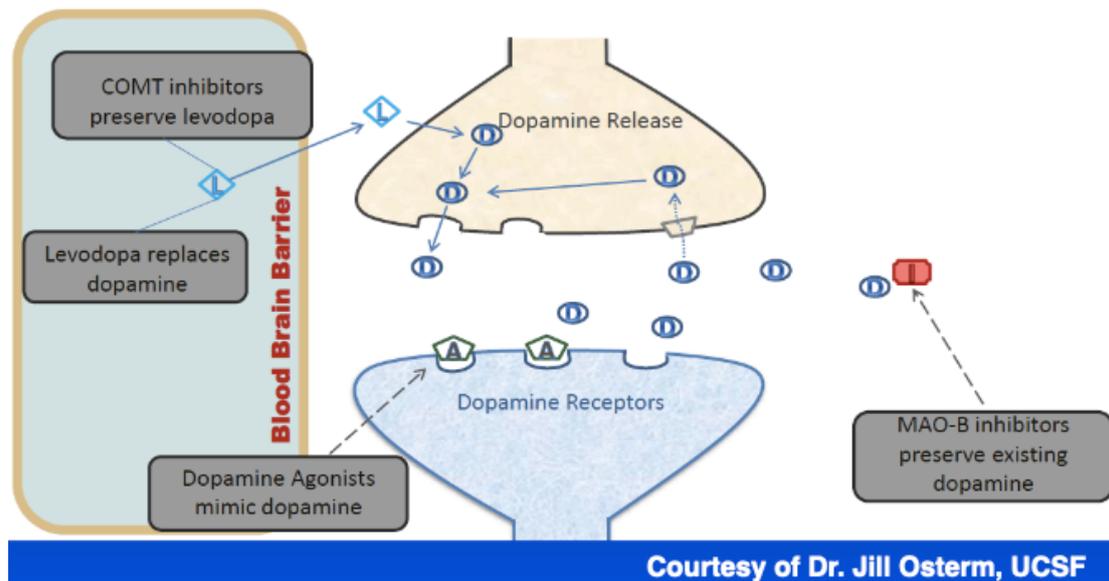
Le formulazioni farmaceutiche disponibili di Levodopa sono sempre Carbidopa o Benserazide (enzimi inibitori periferici della dopa-decarbossilasi che impediscono la precoce degradazione della levodopa prima di attraversare la barriera ematoencefalica), le COMT rappresentano la via di metabolizzazione prevalente della Levodopa, diminuendone la concentrazione plasmatica, e in conseguenza di quella che effettivamente attraversa la barriera ematoencefalica. Inibendo la loro azione si ha un conseguente aumento e stabilizzazione dei livelli plasmatici di Levodopa.

Sia Entacapone che Tolcapone sono inibitori selettivi e reversibili delle COMT.

ENTACAPONE (COMTAN®): agisce solo se assunto insieme a levodopa, aumentandone la biodisponibilità (5/10%). Efficace nel controllo delle fluttuazioni motorie. Per un certo periodo di tempo fu ritirato dal mercato per effetti collaterali non menzionati nel bugiardo.

TOLCAPONE (TASMAR®): a differenza dell'Entacapone è in grado di inibire anche le COMT centrali, oltre a quelle periferiche, ma tale capacità non viene riscontrata in un'effettiva evidenza clinica. È metabolizzato a livello epatico.

OPICAPONE (ONGENTYS®): a differenza del Tolcapone non presenta tossicità epatica. Notevole diminuzione delle fluttuazioni motorie e delle discinesie.



A cura di
Stefania Lavore