




Citalopram



Präanalytik	Blutentnahme am Ende eines Dosierungsintervalls
Material	<u>Serum, 2 mL</u>
Therap. Bereich	50 - 110 ng/mL
Tox. Bereich	> 220 ng/mL 
Methode	<u>HPLC (UV-Detektion)</u>
Qualitätskontrolle	<u>Zertifikat</u>
Anforderungsschein	<u>Download</u> und <u>Analysenposition</u>
Auskünfte	<u>Klinische Chemie und Toxikologie</u>

Stoffgruppe Antidepressiva

Handelsnamen

- ▶ Cipramil
- ▶ CitaLich
- ▶ Citalogamma
- ▶ Citalon
- ▶ Citalopram

Pharmakologie Citalopram ist ein bicyclisches Isobenzofuran-Derivat, das chemisch nicht mit tricyclischen, tetracyclischen oder anderen verfügbaren Antidepressiva verwandt ist. Es handelt sich um einen selektiven Serotonin-Wiederaufnahmehemmer ohne Effekt auf die neuronale Aufnahme von Noradrenalin, Dopamin und γ -Aminobuttersäure. Citalopram zeigt keine oder nur geringe Affinität zu cholinergen, histaminergen und verschiedenen adrenergen, serotonergen und dopaminergen Rezeptoren. Eine Toleranzentwicklung wird nicht beobachtet.

Die Hauptmetaboliten des Citalopram sind ebenfalls selektive Serotonin-Wiederaufnahme-Hemmer, allerdings in geringerem Ausmaß. Die Metaboliten scheinen keinen Beitrag zur allgemeinen antidepressiven Wirkung zu leisten. Citalopram wird nach oraler Gabe rasch resorbiert: die maximale Plasmakonzentration wird im Durchschnitt nach 4 (1 - 7) Stunden erreicht. Die Resorption ist unabhängig von der Nahrungsaufnahme. Die orale Bioverfügbarkeit beträgt ca. 80 %. Das scheinbare Verteilungsvolumen beträgt 12 - 17 L/kg. Die Plasmaproteinbindung von Citalopram und seinen Metaboliten liegt bei unter 80 %. Citalopram wird zum Demethylcitalopram, Didemethylcitalopram, Citalopram-N-Oxid und einem desaminierten Propionsäurederivat verstoffwechselt. Das Propionsäurederivat ist pharmakologisch inaktiv. Demethylcitalopram, Didemethylcitalopram und Citalopram-N-Oxid sind selektive Serotonin-Wiederaufnahmehemmer, wenn auch schwächer als die Muttersubstanz. Die Plasmahalbwertszeit beträgt ca. 1,5 Tage. Nach systemischer Gabe beträgt die Plasma-Clearance ca. 0,3 - 0,4 L/min, nach oraler Gabe ca. 0,4 L/min. Citalopram wird vorwiegend hepatisch eliminiert (85 %), teilweise aber auch renal (15 %). 12 - 23 % des zugeführten Citalopram wird unverändert über den Harn ausgeschieden. Die hepatische Clearance beträgt ca. 0,3 L/min, die renale ca. 0,05 - 0,08 L/min. Steady-state-Konzentrationen werden nach 1 - 2 Wochen erreicht. Der Steady-state-Plasmaspiegel und die gegebene Dosis verhalten sich zueinander linear. Bei einer Dosis von 40 mg pro Tag wird eine durchschnittliche Plasmakonzentration von ca. 300 nmol/L erreicht. Es ist keine klare Beziehung zwischen den Citalopram-Plasmaspiegeln und der therapeutischen Wirkung oder den Nebenwirkun-



Citalopram



gen erkennbar. Bei Patienten mit leichter bis mittelschwerer Niereninsuffizienz erfolgt die Elimination von Citalopram langsamer ohne größere Auswirkung auf die Pharmakokinetik von Citalopram. Erkenntnisse zur Behandlung von Patienten mit schwerwiegender Niereninsuffizienz (Kreatinin-Clearance unter 20 mL/min) stehen nicht zur Verfügung.

Escitalopram ist das wirksame S-Enantiomere des Citaloprams, so dass bei halbiertem Dosierung die gleiche Wirkung erwartet werden kann. Dementsprechend halbieren sich auch die Unter- und Obergrenzen des therapeutischen Bereichs.