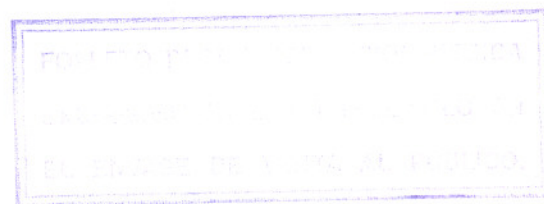


FOLLETO DE INFORMACION AL MEDICO

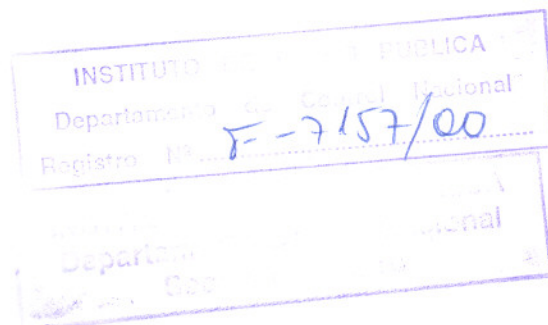
DAGOTIL MR.
Risperidona
Solución para gotas orales 1mg/ml



FORMULA:

Cada 100 ml contiene:

Risperidona 0.1 g
Excipiente c.s.



ALPES CHEMIE S.A.

CLASIFICACION TERAPEUTICA : ANTISICÓTICO.

FARMACOLOGIA

Risperidona es un derivado del benzisoxazol, es un antagonista monoaminérgico selectivo, posee una alta afinidad por los receptores serotoninérgicos 5HT₂ y dopaminérgicos D₂. La actividad antisicótica de risperidona puede ser mediada a través de antagonismo en la combinación de esos sitios receptores, particularmente a través de un bloqueo cortical de receptores serotoninérgicos y del sistema límbico-dopamina.

También se une a los receptores alfa 1 adrenérgicos pero no tiene afinidad por los receptores colinérgicos.

FARMACODINAMIA

Risperidona es completamente absorbido después de la administración oral y alcanza concentraciones plasmáticas máximas en una a dos horas. La absorción no es afectada por los alimentos, por lo tanto, puede administrarse con ellos o no.

Risperidona es extensamente metabolizada en el hígado vía citocromo P450 II D6 (CYP2D6).

La principal vía metabólica es la hidroxilación, siendo su principal metabolito activo el 9-hidroxirisperidona.

La hidroxilación de Risperidona esta sujeto a un polimorfismo genético.

Pacientes que son grandes metabolizadores exhiben baja concentración en el plasma de Risperidona y alta concentración de 9-hidroxirisperidona.

Sin embargo, niveles sanguíneos de Risperidona y 9-hidroxirisperidona pueden diferir.

La unión a proteínas es alta, alrededor del 77% para su metabolito activo y 90% para Risperidona.

La vida media de eliminación de la 9-hidroxirisperidona y de la fracción antipsicótica activa es de aproximadamente 24 horas.

El estado de equilibrio de Risperidona se alcanza dentro del primer día, en la mayoría de los pacientes. El estado de equilibrio de la 9-hidroxirisperidona se alcanza dentro de 4 a 5 días de iniciado el tratamiento.

La eliminación es por vía renal (70%). Por las heces 14%.

En la orina la Risperidona y la 9-hidroxirisperidona representan el 35 a 45% del total. El resto son metabolitos inactivos.

Un estudio de dosis única demostro una concentración plasmática activa mayor y una eliminación más lenta de Risperidona en pacientes ancianos e insuficiencia renal. Las concentraciones plasmaticas de

Risperidona son normales en pacientes con insuficiencia hepática.

INDICACIONES

- Tratamiento de la psicosis esquizofrénica crónica y aguda.
- Tratamiento de las alteraciones del comportamiento en pacientes con demencia en los cuales síntomas como agresividad, alteraciones de la actividad o síntomas psicóticos son prominentes.

REACCIONES ADVERSAS

Risperidona es generalmente bien tolerado y en muchos casos ha sido difícil diferenciar los efectos adversos de los síntomas de la enfermedad subyacente.

Los efectos adversos más comunes observados son: insomnio, agitación, ansiedad y cefalea.

Menos comunes: somnolencia, fátiga, vértigo, dificultad de concentración, constipación, dispepsia, náusea, vómitos, dolor abdominal, visión borrosa, disfunción erectil, disfunción eyaculatoria, disfunción orgásmica, rinitis y exantema.

En algunos casos puede producir síntomas extrapiramidales como temblor, rigidez, sialorrea, bradiquinesia, acatesia, distonía aguda. Estos efectos son generalmente leves y se revierten con la reducción de la dosis o la administración de medicación antiparquinsoniana de ser necesaria.

Con dosis iniciales altas se ha observado vértigo ortostático, hipotensión ortostática y taquicardia refleja.

Risperidona puede inducir un aumento de dosis-dependiente en la concentración plasmática de prolactina.

Manifestaciones potencialmente asociadas son: galactorrea, disturbios del ciclo menstrual y amenorrea.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

Risperidona debe ser usado con cuidado en pacientes con enfermedades cardiovasculares tales como insuficiencia cardíaca, infarto al miocardio, anormalidades de la conducción, deshidratación, hipovolemia o enfermedades cerebrovasculares.

La dosis debe ser ajustada gradualmente.

Drogas con propiedades antagonistas de los receptores dopaminérgicos han sido asociados con la inducción de disquinesia tardía, caracterizada por movimientos rítmicos involuntarios, principalmente de la lengua o la cara o ambas.

Si aparecen signos y síntomas de disquinesia tardía, debe considerarse la suspensión del antipsicótico.

Síndrome neuroléptico maligno (SNM) que se caracteriza por hipertermia, rigidez muscular, inestabilidad autonómica, compromiso de conciencia, debe suspenderse el tratamiento con Risperidona si aparecen algunos de estos síntomas.

Se recomienda reducir a la mitad tanto la dosis inicial como los incrementos subsecuentes de dosis en pacientes geriátricos y en portadores de insuficiencia renal o hepática.

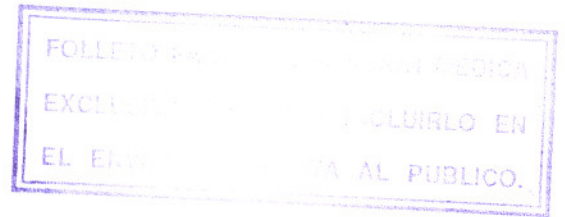


Se recomienda precaución al prescribir Risperidona a pacientes con enfermedad de Parkinson ya que en teoría puede agravarla.

Precaución con pacientes epilépticos.

El uso de Risperidona produce aumento de peso.

Risperidona puede interferir con las actividades que requieren de alerta mental.



CONTRAINDICACIONES

Risperidona esta contraindicado en pacientes que presenten hipersensibilidad a la droga.

EMBARAZO Y LACTANCIA

La seguridad de Risperidona para su uso durante el embarazo humano no se ha establecido. Solo debe usarse en embarazo si los beneficios superan los riesgos.

En experimentos con animales no se ha observado efectos teratogénicos, sin embargo, se mostraron efectos indirectos mediados por la prolactina y el SNC.

Risperidona esta catalogado en categoría C por el FDA.

En todos los estudios en animales Risperidona y 9-hidroxirisperidona se excretaron a través de la leche humana, por lo tanto, mujeres que estén recibiendo Risperidona no debieran amamantar.

INTERACCIONES

Por los efectos que produce sobre el SNC, debiera usarse con cautela en combinación con otras drogas que actúan a nivel central.

Antihipertensivos: el potencial efecto hipotensivo de estos medicamentos puede aumentar los efectos hipotensivos de Risperidona.

Risperidona puede antagonizar los efectos de levodopa y agonistas dopaminérgicos.

La administración crónica de carbamazepina puede aumentar el clearance de Risperidona.

Fenotiazinas, antidepresivos tricíclicos y algunos betabloqueadores pueden aumentar la concentración plasmática de Risperidona, pero no de la fracción antisicótica.

Si Risperidona se administra conjuntamente con otras drogas que se ligan en alto grado a proteínas plasmáticas, no se produce desplazamiento clínicamente relevante de ninguna de ambas drogas.

La concentración de prolactina sérica puede encontrarse aumentada cuando se esta administrando Risperidona.

Clozapina: la administración crónica de clozapina puede disminuir el clearance de risperidona.

DOSIFICACION

La dosis de Risperidona debe ser individualizada y reevaluada periódicamente.

ADULTOS: Todos los pacientes, tanto agudos como crónicos deben comenzar con 1 mg de Risperidona 2 veces al día.

La dosis debe aumentarse a 2 mg 2 veces al día en el segundo día y a 3mg 2 veces al día en el tercer día. De ahí en adelante la dosis puede mantenerse o individualizar si fuere necesario.

La dosis habitual óptima es de 2 mg a 4 mg 2 veces al día.

Dosis sobre los 5 mg 2 veces al día no son eficaces y pueden causar síntomas extrapiramidales.

Cuando se requiere una sedación adicional a Risperidona pueden adicionarse una benzodiazepina.

Dosis límite : 16 mg al día. (8 mg dos veces al día)

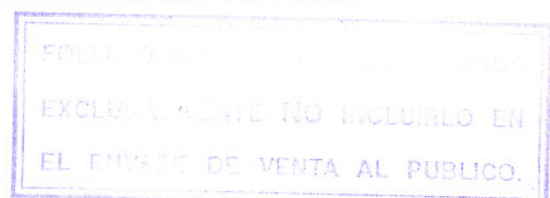
ANCIANOS : Se recomienda una dosis de inicio de 0.5 mg 2 veces al día.

Esta dosis debe ser ajustada en forma individual con incrementos de 0,5 mg 2 veces al día, hasta llegar a 1 o 2 mg 2 veces al día.

Debe usarse con precaución Risperidona en este grupo de pacientes hasta que se tenga una mayor experiencia.

Dosis límite: 3 mg al día.

NIÑOS : No hay experiencia en niños menores de 15 años.



VIA DE ADMINISTRACION

Risperidona se administra por vía oral, ya sea en comprimidos de 1 y 3 mg o en solución para gotas orales: 1mg/ml.

SOBREDOSIS

Los principales signos y síntomas que se observan por una sobredosis son: somnolencia y sedación, taquicardia e hipotensión y síntomas extrapiramidales.

Se han informado casos de sobredosis de hasta 360 mg.

En casos de sobredosis aguda, debe considerarse la posibilidad de participación de múltiples drogas.

Tratamiento

No existe un antídoto específico para risperidona, por lo tanto, debe establecerse y mantenerse una vía aérea expedita, asegurando oxigenación y ventilación adecuada. Se debe considerar el lavado gástrico (después de intubación si el paciente esta inconsciente) y la administración de carbón activado junto con un laxante.

Inmediatamente se debe comenzar con monitoreo cardiovascular, que debe incluir un continuo monitoreo electrocardiográfico para descartar posibles arritmias.

Tratamiento Especifico

Para síntomas extrapiramidales se debe administrar agentes anticolinérgicos.

Para arritmias; administrar algún agente antiarritmico como procaína o quinidina.

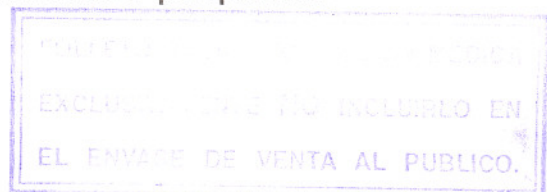
Para el tratamiento de la hipotensión o colapso circulatorio seleccionar un apropiado agente simpaticomimético.

La supervisión médica estrecha y el monitoreo deben continuar hasta que el paciente se recupere.

Medidas de soporte:

Mantener una adecuada hidratación, un balance de electrolitos y una buena oxigenación.

Estos pacientes deben ser derivados a un médico psiquiatra.



ALMACENAMIENTO

Almacenar a temperatura menor de 40°C; preferentemente entre 15° y 30°C.

Proteger de la luz directa.

PRESENTACION

Risperidona se presenta en comprimidos de 1 y 3 mg y solución para gotas orales: 1mg/ml.

