

ARIPIPRAZOL

Antipsicótico 2ª geração Esquizofrenia



www.farmacam.com.br

O aripiprazol é um medicamento antipsicótico usado para tratar alguns transtornos mentais, incluindo esquizofrenia, transtorno bipolar, transtorno de Tourette e irritabilidade associada ao transtorno autista. Ele também pode ser usado em combinação com antidepressivos para o tratamento da depressão. O aripiprazol pode reduzir as alucinações e outros sintomas psicóticos, como pensamentos desorganizados. Ele também pode estabilizar o humor, melhorar a depressão e diminuir os tiques do transtorno de Tourette.

VANTAGENS DE ARIPIPRAZOL

- Causa menos efeitos colaterais;
- Possui mecanismo de ação diferenciado dos fármacos antigos;
- Não apresenta complicadores como o andar robotizado e o aumento de peso;
- Ação seletiva - modula a dopamina de forma a inibi-la onde é preciso e estimulá-la onde é necessário. O paciente tem os sintomas controlados e uma qualidade de vida melhor;
- A medicação permite estabilidade psicológica, dando ao doente a oportunidade de se organizar internamente, o que favorece um melhor desempenho social. O portador também adere mais ao tratamento e pode voltar à rotina normal;
- Alternativa para falha terapêutica ou presença de efeitos colaterais dos antipsicóticos convencionais.

MECANISMO DE AÇÃO

Acredita-se que a eficácia do aripiprazol na esquizofrenia seja mediada através da combinação do agonismo parcial nos receptores D2 de dopamina e 5-HT1A de serotonina, e do antagonismo dos receptores 5-HT2A de serotonina. Interações com outros receptores que não os subtipos de receptores de dopamina e serotonina podem explicar alguns dos outros efeitos clínicos do aripiprazol.

Nome Químico

7-[4-(2,3-diclorofenil)-1-piperazinil]-butoxi]-3,4-dihidro-2(1H)-quinolinona

Fórmula Molecular

C₂₃H₂₇Cl₂N₃O₂

Classe terapêutica

Portaria 344/98: lista C1

Dose usual

Inicial: 15mg/dia – independente das refeições.

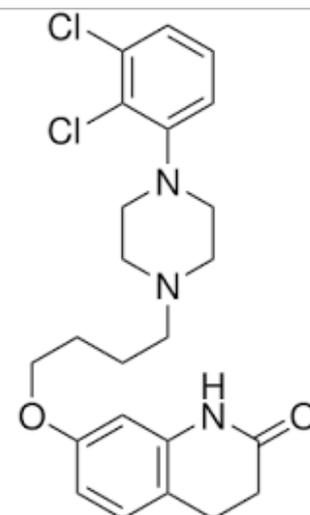
Dose máxima: 30mg/dia

Em geral, não é necessário ajuste de dose baseado na idade, sexo, raça, tabagismo, função hepática ou renal dos pacientes. Somente uso adulto.

Indicações do produto

-Esquizofrenia; - Transtorno bipolar.

Fórmula estrutural



Aripiprazol

ESTUDOS

Aripiprazol no tratamento de episódios maníacos ou mistos agudos em doentes com doença bipolar I: um estudo controlado com placebo de 3 semanas

Este estudo comparou a eficácia, segurança e tolerabilidade de um agonista parcial da dopamina, aripiprazol, com placebo no tratamento de pacientes com transtorno bipolar I com episódio maníaco ou misto agudo. No total, 272 pacientes hospitalizados foram randomizados para aripiprazol 30mg/dia ou placebo neste ensaio clínico duplo-cego, controlado com placebo de 3 semanas. A dosagem pode ser reduzida para 15mg/dia para tolerabilidade e, subsequentemente, aumentada para 30mg/dia com base na resposta clínica.

A medida de eficácia primária foi a alteração média da linha de base para o desfecho na pontuação total da Escala de Avaliação da Mania Nova (YMRS); Resposta foi definida como uma diminuição de 50% do escore basal do YMRS. Os doentes tratados com aripiprazol demonstraram uma melhoria significativamente maior do ponto de partida para o desfecho na média dos escores totais de YMRS comparados com os doentes tratados com placebo tão cedo quanto ao Dia 4 e sustentados até à Semana 3. Foi observado uma taxa de resposta significativamente maior nos doentes tratados com aripiprazol (53% vs 32% no ponto final). O aripiprazol produziu melhorias significativamente maiores do que o valor basal em outras avaliações de eficácia em comparação com o placebo, incluindo os resultados da Classificação Clínica Global - Bipolar Version Severity and Improvement. A dose de 30 mg / dia foi mantida por 85% dos doentes tratados com aripiprazol. A incidência de descontinuações devido a eventos adversos foi semelhante para aripiprazol (8,8%) e placebo (7. 5%). Tratamento aripiprazol não resultou em nenhuma diferença significativa em relação ao placebo na alteração do peso corporal médio e não foi associada com prolactina sérica elevada ou QT c prolongamento. Em conclusão, o aripiprazol demonstrou eficácia superior ao placebo no tratamento de pacientes com transtorno bipolar I com episódios agudos maníacos ou mistos e apresentou um perfil de segurança e tolerabilidade favorável.

PROPRIEDADES FARMACOCINÉTICAS

Absorção

O Aripiprazol é bem absorvido após a administração do comprimido, com concentrações de pico no plasma ocorrendo entre 3 e 5 horas; a biodisponibilidade oral absoluta da formulação do comprimido é de 87%. Aripiprazol pode ser administrado com ou sem alimentos.

A administração do comprimido de Aripiprazol 15 mg com uma refeição padrão com alto teor de gordura não afetou de modo significativo a $C_{máx}$ ou AUC (Área Sob a Curva) de Aripiprazol ou seu metabólito ativo de hidro-Aripiprazol, mas retardou o $T_{máx}$ em 3 horas para o Aripiprazol e 12 horas para o de hidro-Aripiprazol.

Distribuição

O volume da distribuição no estado de equilíbrio de Aripiprazol após a administração intravenosa é alto (404 L ou 4,9 L/kg), indicando distribuição extravascular extensiva. Em concentrações terapêuticas, a ligação do Aripiprazol e seu metabólito principal a proteínas séricas, principalmente albumina, é superior a 99%.

Em voluntários humanos adultos que receberam entre 0,5 mg/dia e 30 mg/dia de Aripiprazol por 14 dias, houve uma ocupação do receptor D2 dependente da dose, indicando penetração cerebral do Aripiprazol em humanos.

Metabolismo e Eliminação

Aripiprazol é metabolizado principalmente por três vias de biotransformação: desidrogenação, hidroxilação e N-dealquilação. Com base em estudos in vitro, as enzimas CYP3A4 e CYP2D6 são responsáveis pela desidrogenação e hidroxilação de Aripiprazol, e a N-dealquilação é catalisada pela CYP3A4. O Aripiprazol é a porção ativa predominante da droga na circulação sistêmica. No estado de equilíbrio, o de hidro-Aripiprazol, o qual é o metabólito ativo, representa cerca de 40% da AUC de Aripiprazol no plasma.

Após uma dose oral única de Aripiprazol marcado com [14C], aproximadamente 25% e 55% da radioatividade administrada foi recuperada na urina e nas fezes, respectivamente. Menos de 1% de Aripiprazol inalterado foi excretado na urina e aproximadamente 18% da dose oral foi recuperada inalterada nas fezes.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

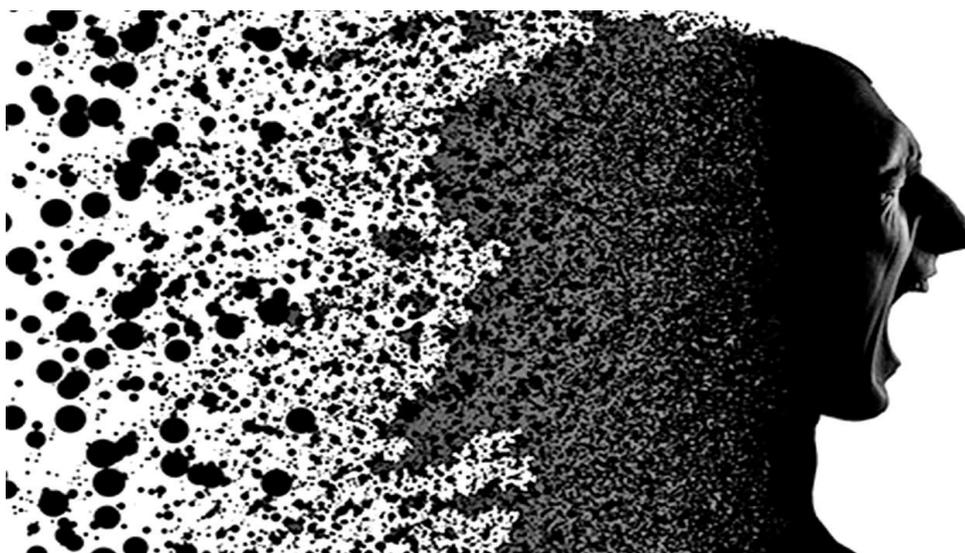
Pode potencializar os efeitos do álcool;
Intensifica o efeito de queda de pressão com medicações anti-hipertensivas;
Pode ter sua concentração diminuída por carbamazepina e outros agentes que induzem CYP3A4;
Demanda cuidados quando associado a medicamentos que estimulam o sistema nervoso central; medicamentos que deprimem o sistema nervoso central;
Pode ter sua concentração aumentada com inibidores de CYP3A4 (como cetoconazol, itraconazol) e inibidores de CYP2D6 (como fluoxetina, paroxetina, quinidina);
Pode dificultar a capacidade de reduzir a temperatura corpórea com medicações com atividade anticolinérgica.

EFEITOS COLATERAIS

Ansiedade, prisão de ventre, dor de cabeça, alergias na pele, febre, fraqueza, incapacidade de permanecer sentado, câimbras, insônia, náusea, rinite, sonolência, tosse, tremor, visão turva e vômito.

CONTRAINDICAÇÃO

Gravidez risco C, mulheres em fase de lactação e ou hipersensibilidade ao produto.



Fabricante /Fornecedor 2017. Martindale 35ª edição (861). McGavin JK, Goa KL. Aripiprazole. CNS Drugs 2002;16:779-86. Goodnick PJ, Jerry JM. Aripiprazole: profile on efficacy and safety. Expert Opin. Pharmacother 2002;3:1773-81. NICE. Psychosis and schizophrenia in adults. Treatment and management. National Clinical Practice Guideline Number 178. 2014. Farmacopeia Brasileira. 4 ed. São Paulo :Atheneu, 2003. PT2, fasciculo 4, p. 117.

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130
Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349

 vendas@farmacam.com.br

 whatsapp (21) 98493-7033

 Facebook.com.br/farmacam

 Instagram.com.br/farmacam