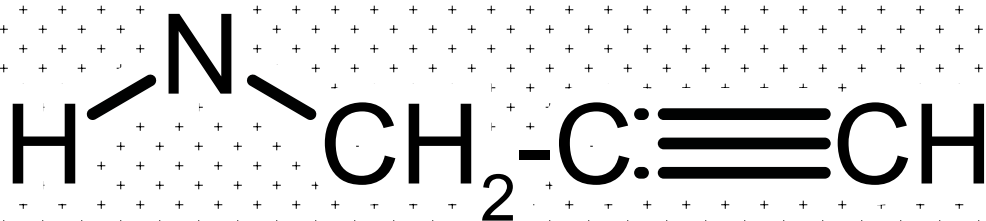
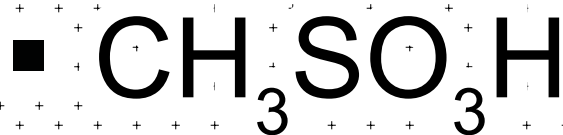
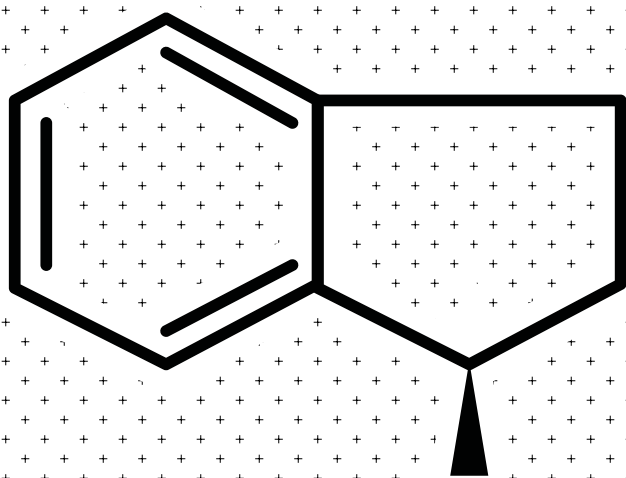


NUEVAS DROGAS:

RASAGILINA, MESILATO DE



CLASE FARMACOLOGICA

N04BD02: Sistema Nervioso. Drogas antiparkinsonianas. Agente Dopaminérgicos. Inhibidores de la Monoaminoxidasa tipo B. Rasagilina

CARACTERISTICAS ORGANOLEPTICAS Y CONSERVACION

Polvo blanco a blanquesino. Peso molecular: 267,34.

Fácilmente soluble en agua o etanol, escasamente soluble en isopropanol.

Conservación: Proteger de la luz.

ACCION FARMACOLOGICA

Antiparkinsoniano

MECANISMO DE ACCION

Actúa inhibiendo de forma selectiva e irreversible la monoamino-oxidasa B (MAO-B), enzima que se encuentra en las neuronas del hipotálamo y es responsable mayoritaria del metabolismo de la dopamina. Produce un aumento de la concentración de dopamina en los segmentos cerebrales nigroestriados y, como consecuencia mejora la función motora en los pacientes con enfermedad de Parkinson.

INDICACION

Está indicada en el tratamiento de la enfermedad idiopática de Parkinson en monoterapia o en terapia coadyuvante (con levodopa) en pacientes con fluctuaciones en la respuesta motora de final de dosis.

DOSIS

1 mg una vez al día, con o sin levodopa.

VIAS DE ADMINISTRACION

Se administra por vía oral. Puede tomarse con o sin alimentos.

FARMACOCINETICA

Tras su administración oral se absorbe con rapidez y alcanza la Cmax. a las 0,5 horas, con una biodisponibilidad del 36%. La unión a proteínas se aproxima al 60-70%. Atraviesa la barrera hematoencefálica. Se metaboliza casi completamente en el hígado a metabolitos de aminoindanos, siendo la CYP1A2 la principal isoenzima implicada. Se elimina por orina (62,6%) y heces (21,8%), menos de un 1% se excreta de forma inalterada por orina. Guarda relación química y farmacológica con la selegilina, pero, a diferencia de esta, rasagilina no se metaboliza a derivados de anfetamina.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

- Está contraindicado su uso con otros inhibidores de la IMAO, petidina, y debe utilizarse con precaución en pacientes tratados con antidepresivos.

Deben transcurrir al menos 14 días entre la interrupción de la administración de rasagilina y el inicio del tratamiento con inhibidores de la MAO o petidina.

- Está contraindicado su uso con fluoxetina o fluvoxamina. Deben transcurrir al menos 5 semanas entre la interrupción de la administración de fluoxetina o fluvoxamina y el inicio del tratamiento con rasagilina.

- No se recomienda su administración junto con dextrometorfano o simpaticomiméticos descongestionantes como los incluidos en preparados anticatarrales.

- Los inhibidores potentes de la CYP1A2 pueden incrementar las concentraciones plasmáticas de rasagilina (por ejemplo, Ciprofloxacina), por lo que deben administrarse con precaución.

- En los pacientes fumadores puede disminuir los niveles plasmáticos de rasagilina por la inducción de la enzima metabolizadora CYP1A2.

ADVERTENCIAS

EMBARAZO: No hay datos sobre su uso en humanos. Los estudios en animales no indican efectos directa o indirectamente nocivos sobre el embarazo.

Deben extremarse las precauciones al prescribir rasagilina a mujeres embarazadas.

LACTANCIA: Los datos experimentales indican que inhibe la secreción de prolactina y que, por lo tanto, puede inhibir la lactancia. Se desconoce si rasagilina se excreta por la leche materna. Deben extremarse las precauciones cuando se administre a mujeres lactantes.

PEDIATRICOS: No se ha establecido seguridad y eficacia en menores de 18 años.

GERIATRICOS: No es necesario ajuste de dosis en ancianos
OTROS: Se debe evitar su uso en pacientes con insuficiencia hepática moderada y debe utilizarse con precaución en pacientes con insuficiencia hepática leve.

EFFECTOS COLATERALES O ADVERSOS

En los ensayos clínicos ha sido bien tolerada.

En monoterapia, los efectos adversos más frecuentes han sido cefalea (>10%), dispepsia, síndrome gripal y artralgia. Asociada a levodopa, discinesia (>10%), hipotensión postural, caídas por accidentes y vómitos. Se han comunicado algunos casos de melanoma, aunque no se ha establecido la relación causal.

CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en hipersensibilidad al principio activo o excipientes, insuficiencia hepática grave.

SINTOMAS DE SOBREDOSIS

Los síntomas reportados después de una sobredosis de rasagilina en dosis de 3 mg a 100 mg incluyen disforia, hipomanía, crisis hipertensiva y síndrome serotoninérgico. No hay antídoto específico. En caso de sobredosis, los pacientes deben ser monitoreados y se debe instituir una terapia sintomática y de sostén apropiada.

PRESENTACION

Comprimidos de 1 mg (como mesilato) por 30.

CONDICIONES DE EXPENDIO

Bajo receta

BIBLIOGRAFIA

Prospecto de Azilect. Disposición ANMAT 2906/17
Martindale. The Complete Drug Reference Pharmaceutical. 36 th ed. 2009.
Manual Farmacoterapéutico. 2017

ULTIMA REVISION: Mayo de 2018

